

(19)



**Евразийское
патентное
ведомство**

(11) **047159**(13) **B1**(12) **ОПИСАНИЕ ИЗОБРЕТЕНИЯ К ЕВРАЗИЙСКОМУ ПАТЕНТУ**

(45) Дата публикации и выдачи патента
2024.06.13

(21) Номер заявки
202193191

(22) Дата подачи заявки
2020.05.21

(51) Int. Cl. **C07D 413/10** (2006.01)
A01N 43/80 (2006.01)
C07D 413/14 (2006.01)

(54) ГЕРБИЦИДНЫЕ СОЕДИНЕНИЯ

(31) **1907602.5; 1914260.3; 2002209.1**

(32) **2019.05.29; 2019.10.03; 2020.02.18**

(33) **GB**

(43) **2022.04.22**

(86) **PCT/EP2020/064212**

(87) **WO 2020/239607 2020.12.03**

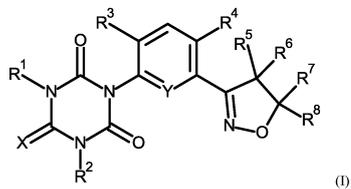
(71)(73) Заявитель и патентовладелец:
**СИНГЕНТА КРОП ПРОТЕКШН АГ
(CH)**

(72) Изобретатель:
**Уиттингем Уильям Гай, Уильямс
Джон, Мэтьюс Кристофер Джон (GB)**

(74) Представитель:
**Веселицкий М.Б., Кузенкова Н.В.,
Каксис Р.А., Белоусов Ю.В., Куликов
А.В., Кузнецова Е.В., Соколов Р.А.,
Кузнецова Т.В. (RU)**

(56) **US-A-5726126
US-A1-2018230139
DA-WEI WANG ET AL.: "Discovery
of Novel N -Isoxazolinyphenyltriazinones as
Promising Protoporphyrinogen IX Oxidase
Inhibitors", JOURNAL OF AGRICULTURAL AND
FOOD CHEMISTRY, vol. 67, no. 45, 21
October 2019 (2019-10-21), pages 12382-12392,
XP055705430, US, ISSN: 0021-8561, DOI:
10.1021/acs.jafc.9b04844, the whole document**

(57) Соединения формулы (I)

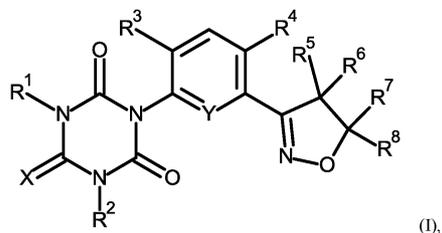


где заместители являются такими, как определено в п.1 формулы изобретения, применимые в качестве пестицидов, в особенности в качестве гербицидов.

B1**047159****047159****B1**

Настоящее изобретение относится к гербицидно активным изоксазолиновым производным, а также к способам и промежуточным соединениям, применяемым для получения таких производных. Настоящее изобретение дополнительно распространяется на гербицидные композиции, содержащие такие производные, а также на применение таких соединений и композиций для контроля роста нежелательных растений, в частности, на применение для контроля сорняков в культурах полезных растений.

Настоящее изобретение основано на открытии того, что изоксазолиновые производные формулы (I), определенные в данном документе, проявляют на удивление хорошую гербицидную активность. Таким образом, в соответствии с настоящим изобретением представлено соединение формулы (I) или его агрономически приемлемая соль



где X выбран из группы, состоящей из кислорода и серы;

Y представляет собой C-H;

R¹ выбран из группы, состоящей из водорода и C₁-C₆-алкила;

R² выбран из группы, состоящей из водорода, amino, C₁-C₆-алкила, C₃-C₆-алкенила и C₃-C₆-алкинила;

R³ выбран из группы, состоящей из водорода, галогена, C₁-C₄-алкила, C₁-C₄-галогеналкила, C₁-C₄-алкокси, C₁-C₄-галогеналкокси и C₁-C₄-алкилсульфонил;

R⁴ выбран из группы, состоящей из водорода, галогена, циано, аминокарбонила, аминотиокарбонила, C₁-C₄-алкила, C₁-C₄-галогеналкила, C₁-C₄-алкокси, C₁-C₄-галогеналкокси и C₁-C₄-алкилсульфонил;

каждый из R⁵ и R⁶ независимо выбран из группы, состоящей из водорода, циано, C₁-C₆-алкила, C₁-C₆-галогеналкила, C₁-C₄-алкилсульфонил, CO₂R⁹, CONR¹⁰R¹¹ и CH₂OR¹²;

каждый из R⁷ и R⁸ независимо выбран из группы, состоящей из водорода, циано, C₁-C₆-алкила, C₁-C₆-галогеналкила, C₁-C₄-алкокси, C₁-C₄-алкилсульфонил, C(=Z)R¹⁵, CO₂R⁹, CONR¹⁰R¹¹ и CH₂OR¹²;

Z выбран из группы, состоящей из кислорода, NOR¹⁶ и NN(R¹⁶)₂;

R⁹ выбран из группы, состоящей из водорода, C₁-C₁₀-алкила, C₁-C₁₀-галогеналкила, C₃-C₆-алкенила, C₃-C₆-галогеналкенила, C₃-C₆-алкинила, C₁-C₄-алкоксиC₁-C₆-алкила, C₁-C₄-галогеналкоксиC₁-C₆-алкила, C₆-C₁₀-арилC₁-C₃-алкила, C₆-C₁₀-арилC₁-C₃-алкила, замещенного 1-4 группами R¹³, гетероарилC₁-C₃-алкила и гетероарилC₁-C₃-алкила, замещенного 1-3 группами R¹³, где каждый гетероарильный фрагмент представляет собой 5- или 6-членное моноциклическое ароматическое кольцо, которое содержит 1, 2, 3 или 4 гетероатома, по отдельности выбранные из азота, кислорода и серы;

R¹⁰ выбран из группы, состоящей из водорода, C₁-C₆-алкила и SO₂R¹⁴;

R¹¹ выбран из группы, состоящей из водорода и C₁-C₆-алкила; или

R¹⁰ и R¹¹ вместе с атомом азота, к которому они присоединены, образуют 3-6-членное гетероциклическое кольцо, которое необязательно содержит атом кислорода;

R¹² выбран из группы, состоящей из водорода, C₁-C₄-алкила, C₁-C₄-галогеналкила, C₁-C₄-алкилсульфонил, C₁-C₄-галогеналкилсульфонил, фенилсульфонил, фенилсульфонил, замещенного 1-2 группами R¹³; C₁-C₄-алкилкарбонил, C₁-C₄-галогеналкилкарбонил, C₆-C₁₀-арилкарбонил, C₆-C₁₀-арилкарбонил, замещенного 1-4 группами R¹³, гетероарилкарбонил, гетероарилкарбонил, замещенного 1-3 группами R¹³, C₆-C₁₀-арилC₁-C₃-алкилкарбонил, C₆-C₁₀-арилC₁-C₃-алкилкарбонил, замещенного 1-4 группами R¹³, гетероарилC₁-C₃-алкилкарбонил и гетероарилC₁-C₃-алкилкарбонил, замещенного 1-3 группами R¹³;

каждая R¹³ независимо выбрана из группы, состоящей из галогена, C₁-C₄-алкила, C₁-C₄-галогеналкила, C₁-C₄-алкокси, C₁-C₄-галогеналкокси, циано и C₁-C₄-алкилсульфонил, где каждый гетероарильный фрагмент представляет собой 5- или 6-членное моноциклическое ароматическое кольцо, которое содержит 1,2,3 или 4 гетероатома, по отдельности выбранные из азота, кислорода и серы;

R¹⁴ выбран из группы, состоящей из C₁-C₄-алкила, C₁-C₄-галогеналкила и C₁-C₄-алкил(C₁-C₄-алкил)амино;

R¹⁵ выбран из группы, состоящей из водорода, C₁-C₄-алкила и C₁-C₄-галогеналкила;

каждый R¹⁶ независимо выбран из группы, состоящей из водорода, C₁-C₄-алкила, C₁-C₄-галогеналкила и C₁-C₄-алкоксикарбонилC₁-C₄-алкила.

В соответствии со вторым аспектом настоящего изобретения представлена агрохимическая композиция, содержащая гербицидно эффективное количество соединения формулы (I) и агрохимически приемлемый разбавитель или носитель. Такая композиция, предназначенная для применения в сельском хозяйстве, может дополнительно содержать по меньшей мере один дополнительный активный ингредиент.

В соответствии с третьим аспектом настоящего изобретения представлен способ контроля или пре-

дупреждения роста нежелательных растений, где гербицидно эффективное количество соединения формулы (I) или композицию, содержащую данное соединение в качестве активного ингредиента, применяют в отношении растений, их частей или места их произрастания.

В соответствии с четвертым аспектом настоящего изобретения представлено применение соединения формулы (I) в качестве гербицида.

В соответствии с пятым аспектом настоящего изобретения представлен способ получения соединения формулы (I).

Применяемый в данном документе термин "галоген" или "галогено" относится ко фтору (фтор), хлору (хлор), бромю (бром) или йоду (йод), предпочтительно фтору, хлору или бромю.

Применяемый в данном документе термин "циано" означает группу -CN.

Применяемый в данном документе термин "гидрокси" означает группу -OH.

Применяемый в данном документе термин "нитро" означает группу -NO₂.

Применяемый в данном документе термин "C₁-C₆-алкил" относится к углеводородному радикалу с прямой или разветвленной цепью, состоящему исключительно из атомов углерода и водорода, не содержащему ненасыщенных связей, имеющему от одного до шести атомов углерода, и который присоединен к остальной части молекулы одинарной связью. C₁-C₄-алкил и C₁-C₂-алкил следует истолковывать соответствующим образом. Примеры C₁-C₆-алкила включают без ограничения метил (Me), этил (Et), н-пропил, 1-метилэтил (изопропил), н-бутил и 1-диметилэтил (трет-бутил).

Применяемый в данном документе термин "C₁-C₆-алкокси" относится к радикалу формулы -OR_a, где R_a представляет собой C₁-C₆-алкильный радикал, который в целом определен выше. C₁-C₄-алкокси следует истолковывать соответствующим образом. Примеры C₁-C₄-алкокси включают без ограничения метокси, этокси, пропокси, изопропокси и трет-бутокси.

Применяемый в данном документе термин "C₁-C₆-галогеналкил" относится к C₁-C₆-алкильному радикалу, который в целом определен выше, замещенному одним или несколькими одинаковыми или различными атомами галогена. C₁-C₄-галогеналкил следует истолковывать соответствующим образом. Примеры C₁-C₆-галогеналкила включают без ограничения хлорметил, фторметил, фторэтил, дифторметил, трифторметил и 2,2,2-трифторэтил.

Применяемый в данном документе термин "C₂-C₆-алкенил" относится к группе, представляющей собой углеводородный радикал с прямой или разветвленной цепью, состоящей исключительно из атомов углерода и водорода, содержащей по меньшей мере одну двойную связь, которая может находиться либо в (E)-, либо в (Z)-конфигурации, имеющей от двух до шести атомов углерода, которая присоединена к остальной части молекулы одинарной связью. C₂-C₄-алкенил следует истолковывать соответствующим образом. Примеры C₂-C₆-алкенила включают без ограничения проп-1-енил, аллил (проп-2-енил) и бут-1-енил.

Применяемый в данном документе термин "C₂-C₆-галогеналкенил" относится к C₂-C₆-алкенильному радикалу, который в целом определен выше, замещенному одним или несколькими одинаковыми или различными атомами галогена. Примеры C₂-C₆-галогеналкенила включают без ограничения хлорэтилен, фторэтилен, 1,1-дифторэтилен, 1,1-дихлорэтилен и 1,1,2-трихлорэтилен.

Применяемый в данном документе термин "C₂-C₆-алкинил" относится к группе, представляющей собой углеводородный радикал с прямой или разветвленной цепью, состоящей исключительно из атомов углерода и водорода, содержащей по меньшей мере одну тройную связь, имеющей от двух до шести атомов углерода, и которая присоединена к остальной части молекулы одинарной связью. C₂-C₄-алкинил следует истолковывать соответствующим образом. Примеры C₂-C₆-алкинила включают без ограничения, проп-1-инил, пропаргил (проп-2-инил) и бут-1-инил.

Применяемый в данном документе термин "C₁-C₆-галогеналкокси" относится к C₁-C₆-алкоксигруппе, определенной выше, замещенной одним или несколькими одинаковыми или различными атомами галогена. C₁-C₄-галогеналкокси следует истолковывать соответствующим образом. Примеры C₁-C₆-галогеналкокси включают без ограничения фторметокси, дифторметокси, фторэтокси, трифторметокси и трифторэтокси.

Применяемый в данном документе термин "C₁-C₃-галогеналкоксиC₁-C₃-алкил" относится к радикалу формулы R_b-O-R_a-, где R_b представляет собой C₁-C₃-галогеналкильный радикал, который в целом определен выше, и R_a представляет собой C₁-C₃-алкиленовый радикал, который в целом определен выше.

Применяемый в данном документе термин "C₁-C₃-алкоксиC₁-C₃-алкил" относится к радикалу формулы R_b-O-R_a-, где R_b представляет собой C₁-C₃-алкильный радикал, который в целом определен выше, и R_a представляет собой C₁-C₃-алкиленовый радикал, который в целом определен выше.

Применяемый в данном документе термин "C₁-C₃-алкоксиC₁-C₃-алкокси-" относится к радикалу формулы R_b-O-R_a-O-, где R_b представляет собой C₁-C₃-алкильный радикал, который в целом определен выше, и R_a представляет собой C₁-C₃-алкиленовый радикал, который в целом определен выше.

Применяемый в данном документе термин "C₃-C₆-алкенилокси" относится к радикалу формулы -OR_a, где R_a представляет собой C₃-C₆-алкенильный радикал, который в целом определен выше.

Применяемый в данном документе термин "C₃-C₆-алкинилокси" относится к радикалу формулы -OR_a, где R_a представляет собой C₃-C₆-алкинильный радикал, который в целом определен выше.

Применяемый в данном документе термин "гидрокси C_1 - C_6 -алкил" относится к C_1 - C_6 -алкильному радикалу, который в целом определен выше, замещенному одной или несколькими гидроксигруппами.

Применяемый в данном документе термин " C_1 - C_6 -алкилкарбонил" относится к радикалу формулы $-C(O)R_a$, где R_a представляет собой C_1 - C_6 -алкильный радикал, который в целом определен выше.

Применяемый в данном документе термин " C_1 - C_6 -алкоксикарбонил" относится к радикалу формулы $-C(O)OR_a$, где R_a представляет собой C_1 - C_6 -алкильный радикал, который в целом определен выше.

Применяемый в данном документе термин "аминокарбонил" относится к радикалу формулы $-C(O)NH_2$.

Применяемый в данном документе термин "аминотиокарбонил" относится к радикалу формулы $-C(S)NH_2$.

Применяемый в данном документе термин " C_3 - C_6 -циклоалкил" относится к стабильному моноциклическому кольцевому радикалу, который является насыщенным или частично ненасыщенным и содержит от 3 до 6 атомов углерода. C_3 - C_4 -циклоалкил следует истолковывать соответствующим образом. Примеры C_3 - C_6 -циклоалкила включают без ограничения циклопропил, циклобутил, циклопентил и циклогексил.

Применяемый в данном документе термин " C_3 - C_6 -галогенциклоалкил" относится к C_3 - C_6 -циклоалкильному радикалу, который в целом определен выше, замещенному одним или несколькими одинаковыми или различными атомами галогена. C_3 - C_4 -галогенциклоалкил следует истолковывать соответствующим образом.

Применяемый в данном документе термин " C_3 - C_6 -циклоалкокси" относится к радикалу формулы $-OR_a$, где R_a представляет собой C_3 - C_6 -циклоалкильный радикал, который в целом определен выше.

Применяемый в данном документе термин " N - C_3 - C_6 -циклоалкиламино" относится к радикалу формулы $-NHR_a$, где R_a представляет собой C_3 - C_6 -циклоалкильный радикал, который в целом определен выше.

За исключением случаев, когда явно указано иное, применяемый в данном документе термин "гетероарил" относится к 5- или 6-членному моноциклическому ароматическому кольцу, которое содержит 1, 2, 3 или 4 гетероатома, по отдельности выбранные из азота, кислорода и серы. Гетероарильный радикал может быть связан с остальной частью молекулы посредством атома углерода или гетероатома. Примеры гетероарила включают фурил, пирролил, имидазолил, тиенил, пиразолил, тиазолил, изотиазолил, оксазолил, изоксазолил, триазолил, тетразолил, пиразинил, пиридазинил, пиримидил или пиридил.

За исключением случаев, когда явно указано иное, применяемый в данном документе термин "гетероциклил" или "гетероциклический" относится к стабильному 4-6-членному неароматическому моноциклическому кольцевому радикалу, который содержит 1, 2 или 3 гетероатома, по отдельности выбранные из азота, кислорода и серы. Гетероциклический радикал может быть связан с остальной частью молекулы посредством атома углерода или гетероатома. Примеры гетероциклила включают без ограничения пирролинил, пирролидил, тетрагидрофурил, тетрагидротиенил, тетрагидротиопиранил, пиперидил, пиперазинил, тетрагидропиранил, дигидроизоксазол, диоксоланил, морфолинил или 5-лактаминил.

Наличие одного или нескольких возможных асимметричных атомов углерода в соединении формулы (I) означает, что соединения могут встречаться в хиральных изомерных формах, т. е. энантиомерных или диастереомерных формах. Также атропоизомеры могут возникать в результате ограниченного вращения вокруг одинарной связи. Предполагается, что формула (I) включает все такие возможные изомерные формы и их смеси. Настоящее изобретение включает все такие возможные изомерные формы соединения формулы (I) и их смеси. Аналогичным образом предполагается, что формула (I) включает все возможные таутомеры (включая лактам-лактимную таутомерию и кето-енольную таутомерию), если они присутствуют. Настоящее изобретение включает все возможные таутомерные формы соединения формулы (I). Аналогично, в случае дизамещенных алкенов, они могут быть представлены в E- или Z-форме или в виде смесей обоих в любой пропорции. Настоящее изобретение включает все такие возможные изомерные формы соединения формулы (I) и их смеси.

Соединения формулы (I) будут, как правило, представлены в форме агрономически приемлемой соли, цвиттер-иона или агрономически приемлемой соли цвиттер-иона. Настоящее изобретение охватывает все такие агрономически приемлемые соли, цвиттер-ионы и их смеси во всех пропорциях.

Подходящие агрономически приемлемые соли по настоящему изобретению могут быть с катионами, которые включают без ограничения металлы, сопряженные с аминами кислоты и органические катионы. Примеры подходящих металлов включают алюминий, кальций, цезий, медь, литий, магний, марганец, калий, натрий, железо и цинк. Примеры подходящих аминов включают аллиламин, аммиак, амиламин, аргинин, бенетамин, бензатин, бутенил-2-амин, бутиламин, бутилэтаноламин, циклогексиламин, дециламин, диамиламин, дибутиламин, диэтаноламин, диэтиламин, диэтилентриамин, дигептиламин, дигексиламин, диизоамиламин, диизопропиламин, диметиламин, диоктиламин, дипропаноламин, дипропаргиламин, дипропиламин, додециламин, этаноламин, этиламин, этилбутиламин, этилендиамин, этилгептиламин, этилоктиламин, этилпропаноламин, гептадециламин, гептиламин, гексадециламин, гексенил-2-амин, гексиламин, гексилгептиламин, гексилноктиламин, гистидин, индолин, изоамиламин, изобутаноламин, изобутиламин, изопропаноламин, изопропиламин, лизин, меглюмин, метоксиэтиламин, ме-

тиламин, метилбутиламин, метилэтиламин, метилгексиламин, метилизопропиламин, метилнониламмин, метилоктадециламин, метилпентадециламин, морфолин, N,N-диэтилэтаноламин, N-метилпиперазин, нониламмин, октадециламин, октиламин, олеиламин, пентадециламин, пентенил-2-амин, феноксиэтиламин, пиколин, пиперазин, пиперидин, пропаноламин, пропиламин, пропилендиамин, пиридин, пирролин, втор-бутиламин, стеариламин, талловый амин, тетрадециламин, трибутиламин, тридециламин, триметиламин, тригептиламин, тригексиламин, триизобутиламин, триизодециламин, триизопропиламин, триметиламин, трипентиламин, трипропиламин, трис(гидроксиметил)аминометан и ундециламин. Примеры подходящих органических катионов включают бензилтрибутиламмоний, бензилтриметиламмоний, бензилтрифенилфосфоний, холин, тетрабутиламмоний, тетрабутилфосфоний, тетраэтиламмоний, тетраэтилфосфоний, тетраметиламмоний, тетраметилфосфоний, тетрапропиламмоний, тетрапропилфосфоний, трибутилсульфоний, трибутилсульфоксоний, триэтилсульфоний, триэтилсульфоксоний, триметилсульфоний, триметилсульфоксоний, трипропилсульфоний и трипропилсульфоксоний.

В следующем перечне представлены определения, включающие предпочтительные определения для заместителей X, Y, Z, R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶, R⁷, R⁸, R⁹, R¹⁰, R¹¹, R¹², R¹³, R¹⁴, R¹⁵ и R¹⁶ со ссылкой на соединения формулы (I) в соответствии с настоящим изобретением. Применительно к любому из этих заместителей любое из определений, приведенных ниже, можно комбинировать с любым определением любого другого заместителя, приведенным ниже или в других частях данного документа. Предпочтительно X представляет собой серу.

Предпочтительно Y представляет собой C-H.

Предпочтительно R¹ выбран из группы, состоящей из водорода и C₁-C₄-алкила, более предпочтительно C₁-C₂-алкила, наиболее предпочтительно метила. Предпочтительно R² выбран из группы, состоящей из водорода, C₁-C₄-алкила и C₃-C₄-алкинила, более предпочтительно C₁-C₂-алкила, наиболее предпочтительно метила. Предпочтительно R³ выбран из группы, состоящей из водорода, хлора и фтора, более предпочтительно хлора и фтора.

Предпочтительно R⁴ выбран из группы, состоящей из водорода, хлора, циано и аминотиокарбонила, более предпочтительно хлора, циано и аминотиокарбонила, наиболее предпочтительно хлора.

Предпочтительно каждый из R⁵ и R⁶ независимо выбран из группы, состоящей из водорода, C₁-C₄-алкила, CO₂R⁹ и CH₂OR¹², более предпочтительно водорода и C₁-C₂-алкила, наиболее предпочтительно водорода.

Предпочтительно каждый из R⁷ и R⁸ независимо выбран из группы, состоящей из водорода, C₁-C₄-алкила, C₁-C₆-галогеналкила, CO₂R⁹, CONR¹⁰R¹¹ и CH₂OR¹². Более предпочтительно R⁷ выбран из группы, состоящей из CO₂R⁹, CONR¹⁰R¹¹ и CH₂OR¹², наиболее предпочтительно CO₂R⁹. Более предпочтительно R⁸ выбран из группы, состоящей из водорода и C₁-C₄-алкила, наиболее предпочтительно метила.

Предпочтительно R⁹ выбран из группы, состоящей из водорода, C₁-C₄-алкила, C₁-C₄-галогеналкила, C₁-C₂-алкоксила, фенилC₁-C₂-алкила и фенилC₁-C₂-алкила, замещенного 1-2 группами R¹³, более предпочтительно водорода, C₁-C₄-алкила, C₁-C₂-алкоксиC₁-C₂-алкила и фенилC₁-C₂-алкила, наиболее предпочтительно водорода, C₁-C₄-алкила и фенилC₁-C₂-алкила.

Предпочтительно R¹⁰ выбран из группы, состоящей из водорода и SO₂R¹⁴, более предпочтительно SO₂R¹⁴.

Предпочтительно R¹¹ представляет собой водород.

Предпочтительно R¹² выбран из группы, состоящей из водорода, C₁-C₂-алкила, C₁-C₂-алкилсульфонила, C₁-C₂-галогеналкилсульфонила, C₁-C₄-алкилкарбонила, фенилкарбонила, фенилкарбонила, замещенного 1-2 группами R¹³, фенилC₁-C₂-алкилкарбонила и фенилC₁-C₂-алкилкарбонила, замещенного 1-2 группами R¹³ более предпочтительно C₁-C₂-алкилсульфонила, C₁-C₂-галогеналкилсульфонила и C₁-C₄-алкилкарбонила.

Предпочтительно R¹³ выбран из группы, состоящей из галогена, C₁-C₄-алкила, C₁-C₄-галогеналкила, C₁-C₄-алкокси, C₁-C₄-галогеналкокси, циано и C₁-C₄-алкилсульфонила.

Предпочтительно R¹⁴ выбран из группы, состоящей из C₁-C₄-алкила и C₁-C₄-алкил(C₁-C₄-алкил)амино, более предпочтительно метила и изопропил(метил)амино.

Предпочтительной подгруппой соединений является подгруппа, в которой:

X представляет собой серу;

Y представляет собой C-H;

R¹ представляет собой C₁-C₂-алкил;

R² представляет собой C₁-C₂-алкил;

R³ выбран из группы, состоящей из водорода, хлора и фтора;

R⁴ выбран из группы, состоящей из хлора, циано и аминотиокарбонила;

каждый из R⁵ и R⁶ независимо выбран из группы, состоящей из водорода и C₁-C₂-алкила;

R⁷ выбран из группы, состоящей из CO₂R⁹, CONR¹⁰R¹¹ и CH₂OR¹²;

R⁸ выбран из группы, состоящей из водорода и C₁-C₄-алкила;

R⁹ выбран из группы, состоящей из водорода, C₁-C₄-алкила, C₁-C₂-алкоксиC₁-C₂-алкила и фенилC₁-C₂-алкила;

R¹⁰ представляет собой SO₂R¹⁴;

R¹¹ представляет собой водород.

R¹² выбран из группы, состоящей из C₁-C₂-алкилсульфонила, C₁-C₂-галогеналкилсульфонила и C₁-C₄-алкилкарбонила;

R¹⁴ выбран из группы, состоящей из метила и изопропил(метил)амино.

Более предпочтительной подгруппой соединений является подгруппа, в которой:

X представляет собой серу;

Y представляет собой C-H;

R¹ представляет собой метил;

R² представляет собой метил;

R³ выбран из группы, состоящей из хлора и фтора;

R⁴ представляет собой хлор;

каждый из R⁵ и R⁶ представляет собой водород;

R⁷ представляет собой CO₂R⁹;

R⁸ представляет собой метил;

R⁹ выбран из группы, состоящей из водорода, C₁-C₄-алкила и фенилC₁-C₂-алкила.

Таблица примеров.

В данной таблице раскрыты конкретные соединения формулы (I), где R¹ и R² представляют собой метил.

Номер соединения	X	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸
1	O	H	Cl	H	H	CO ₂ H	Me
2	O	H	Cl	H	H	CO ₂ Me	Me
3	O	H	Cl	H	H	CO ₂ Et	Me
4	O	H	Cl	H	H	CO ₂ CH ₂ Ph	Me
5	O	H	Cl	H	H	CH ₂ OH	Me
6	O	H	Cl	H	H	CH ₂ OMe	Me
7	O	H	Cl	H	H	CH ₂ OCOMe	Me
8	O	H	Cl	H	H	CH ₂ OCOPh	Me
9	O	H	Cl	H	H	CH ₂ OSO ₂ Me	Me
10	O	H	Cl	H	H	CH ₂ OSO ₂ CF ₃	Me
11	O	H	Cl	H	H	CH ₂ OSO ₂ (4MePh)	Me
12	O	F	Cl	H	H	CO ₂ H	Me
13	O	F	Cl	H	H	CO ₂ Me	Me
14	O	F	Cl	H	H	CO ₂ Et	Me
15	O	F	Cl	H	H	CO ₂ CH ₂ Ph	Me
16	O	F	Cl	H	H	CH ₂ OH	Me
17	O	F	Cl	H	H	CH ₂ OMe	Me
18	O	F	Cl	H	H	CH ₂ OCOMe	Me
19	O	F	Cl	H	H	CH ₂ OCOPh	Me
20	O	F	Cl	H	H	CH ₂ OSO ₂ Me	Me
21	O	F	Cl	H	H	CH ₂ OSO ₂ CF ₃	Me

22	O	F	Cl	H	H	CH ₂ OSO ₂ (4MePh)	Me
23	O	Cl	Cl	H	H	CO ₂ H	Me
24	O	Cl	Cl	H	H	CO ₂ Me	Me
25	O	Cl	Cl	H	H	CO ₂ Et	Me
26	O	Cl	Cl	H	H	CO ₂ CH ₂ Ph	Me
27	O	Cl	Cl	H	H	CH ₂ OH	Me
28	O	Cl	Cl	H	H	CH ₂ OMe	Me
29	O	Cl	Cl	H	H	CH ₂ OCOMe	Me
30	O	Cl	Cl	H	H	CH ₂ OCOPh	Me
31	O	Cl	Cl	H	H	CH ₂ OSO ₂ Me	Me
32	O	Cl	Cl	H	H	CH ₂ OSO ₂ CF ₃	Me
33	O	Cl	Cl	H	H	CH ₂ OSO ₂ (4MePh)	Me
34	S	H	Cl	H	H	CO ₂ H	Me
35	S	H	Cl	H	H	CO ₂ Me	Me
36	S	H	Cl	H	H	CO ₂ Et	Me
37	S	H	Cl	H	H	CO ₂ CH ₂ Ph	Me
38	S	H	Cl	H	H	CH ₂ OH	Me
39	S	H	Cl	H	H	CH ₂ OMe	Me
40	S	H	Cl	H	H	CH ₂ OCOMe	Me
41	S	H	Cl	H	H	CH ₂ OCOPh	Me
42	S	H	Cl	H	H	CH ₂ OSO ₂ Me	Me
43	S	H	Cl	H	H	CH ₂ OSO ₂ CF ₃	Me
44	S	H	Cl	H	H	CH ₂ OSO ₂ (4MePh)	Me
45	S	F	Cl	H	H	CO ₂ H	Me
46	S	F	Cl	H	H	CO ₂ Me	Me
47	S	F	Cl	H	H	CO ₂ Et	Me
48	S	F	Cl	H	H	CO ₂ CH ₂ Ph	Me
49	S	F	Cl	H	H	CH ₂ OH	Me
50	S	F	Cl	H	H	CH ₂ OMe	Me
51	S	F	Cl	H	H	CH ₂ OCOMe	Me

52	S	F	Cl	H	H	CH ₂ OCOPh	Me
53	S	F	Cl	H	H	CH ₂ OSO ₂ Me	Me
54	S	F	Cl	H	H	CH ₂ OSO ₂ CF ₃	Me
55	S	F	Cl	H	H	CH ₂ OSO ₂ (4MePh)	Me
56	S	Cl	Cl	H	H	CO ₂ H	Me
57	S	Cl	Cl	H	H	CO ₂ Me	Me
58	S	Cl	Cl	H	H	CO ₂ Et	Me
59	S	Cl	Cl	H	H	CO ₂ CH ₂ Ph	Me
60	S	Cl	Cl	H	H	CH ₂ OH	Me
61	S	Cl	Cl	H	H	CH ₂ OMe	Me
62	S	Cl	Cl	H	H	CH ₂ OCOMe	Me
63	S	Cl	Cl	H	H	CH ₂ OCOPh	Me
64	S	Cl	Cl	H	H	CH ₂ OSO ₂ Me	Me
65	S	Cl	Cl	H	H	CH ₂ OSO ₂ CF ₃	Me
66	S	Cl	Cl	H	H	CH ₂ OSO ₂ (4MePh)	Me
67	S	H	CN	H	H	CO ₂ H	Me
68	S	H	CN	H	H	CO ₂ Me	Me
69	S	H	CN	H	H	CO ₂ Et	Me
70	S	H	CN	H	H	CO ₂ CH ₂ Ph	Me
71	S	H	CN	H	H	CH ₂ OH	Me
72	S	H	CN	H	H	CH ₂ OMe	Me
73	S	H	CN	H	H	CH ₂ OCOMe	Me
74	S	H	CN	H	H	CH ₂ OCOPh	Me
75	S	H	CN	H	H	CH ₂ OSO ₂ Me	Me
76	S	H	CN	H	H	CH ₂ OSO ₂ CF ₃	Me
77	S	H	CN	H	H	CH ₂ OSO ₂ (4MePh)	Me
78	S	F	CN	H	H	CO ₂ H	Me
79	S	F	CN	H	H	CO ₂ Me	Me
80	S	F	CN	H	H	CO ₂ Et	Me
81	S	F	CN	H	H	CO ₂ CH ₂ Ph	Me

82	S	F	CN	H	H	CH ₂ OH	Me
83	S	F	CN	H	H	CH ₂ OMe	Me
84	S	F	CN	H	H	CH ₂ OCOMe	Me
85	S	F	CN	H	H	CH ₂ OCOPh	Me
86	S	F	CN	H	H	CH ₂ OSO ₂ Me	Me
87	S	F	CN	H	H	CH ₂ OSO ₂ CF ₃	Me
88	S	F	CN	H	H	CH ₂ OSO ₂ (4MePh)	Me
89	S	Cl	CN	H	H	CO ₂ H	Me
90	S	Cl	CN	H	H	CO ₂ Me	Me
91	S	Cl	CN	H	H	CO ₂ Et	Me
92	S	Cl	CN	H	H	CO ₂ CH ₂ Ph	Me
93	S	Cl	CN	H	H	CH ₂ OH	Me
94	S	Cl	CN	H	H	CH ₂ OMe	Me
95	S	Cl	CN	H	H	CH ₂ OCOMe	Me
96	S	Cl	CN	H	H	CH ₂ OCOPh	Me
97	S	Cl	CN	H	H	CH ₂ OSO ₂ Me	Me
98	S	Cl	CN	H	H	CH ₂ OSO ₂ CF ₃	Me
99	S	Cl	CN	H	H	CH ₂ OSO ₂ (4MePh)	Me
100	S	H	CSNH ₂	H	H	CO ₂ H	Me
101	S	H	CSNH ₂	H	H	CO ₂ Me	Me
102	S	H	CSNH ₂	H	H	CO ₂ Et	Me
103	S	H	CSNH ₂	H	H	CO ₂ CH ₂ Ph	Me
104	S	H	CSNH ₂	H	H	CH ₂ OH	Me
105	S	H	CSNH ₂	H	H	CH ₂ OMe	Me
106	S	H	CSNH ₂	H	H	CH ₂ OCOMe	Me
107	S	H	CSNH ₂	H	H	CH ₂ OCOPh	Me
108	S	H	CSNH ₂	H	H	CH ₂ OSO ₂ Me	Me
109	S	H	CSNH ₂	H	H	CH ₂ OSO ₂ CF ₃	Me
110	S	H	CSNH ₂	H	H	CH ₂ OSO ₂ (4MePh)	Me
111	S	F	CSNH ₂	H	H	CO ₂ H	Me

112	S	F	CSNH ₂	H	H	CO ₂ Me	Me
113	S	F	CSNH ₂	H	H	CO ₂ Et	Me
114	S	F	CSNH ₂	H	H	CO ₂ CH ₂ Ph	Me
115	S	F	CSNH ₂	H	H	CH ₂ OH	Me
116	S	F	CSNH ₂	H	H	CH ₂ OMe	Me
117	S	F	CSNH ₂	H	H	CH ₂ OCOMe	Me
118	S	F	CSNH ₂	H	H	CH ₂ OCOPh	Me
119	S	F	CSNH ₂	H	H	CH ₂ OSO ₂ Me	Me
120	S	F	CSNH ₂	H	H	CH ₂ OSO ₂ CF ₃	Me
121	S	F	CSNH ₂	H	H	CH ₂ OSO ₂ (4MePh)	Me
122	S	Cl	CSNH ₂	H	H	CO ₂ H	Me
123	S	Cl	CSNH ₂	H	H	CO ₂ Me	Me
124	S	Cl	CSNH ₂	H	H	CO ₂ Et	Me
125	S	Cl	CSNH ₂	H	H	CO ₂ CH ₂ Ph	Me
126	S	Cl	CSNH ₂	H	H	CH ₂ OH	Me
127	S	Cl	CSNH ₂	H	H	CH ₂ OMe	Me
128	S	Cl	CSNH ₂	H	H	CH ₂ OCOMe	Me
129	S	Cl	CSNH ₂	H	H	CH ₂ OCOPh	Me
130	S	Cl	CSNH ₂	H	H	CH ₂ OSO ₂ Me	Me
131	S	Cl	CSNH ₂	H	H	CH ₂ OSO ₂ CF ₃	Me
132	S	Cl	CSNH ₂	H	H	CH ₂ OSO ₂ (4MePh)	Me
133	S	H	Cl	Me	H	CO ₂ H	Me
134	S	H	Cl	Me	H	CO ₂ Me	Me
135	S	H	Cl	Me	H	CO ₂ Et	Me
136	S	H	Cl	Me	H	CO ₂ CH ₂ Ph	Me
137	S	H	Cl	Me	H	CH ₂ OH	Me
138	S	H	Cl	Me	H	CH ₂ OMe	Me
139	S	H	Cl	Me	H	CH ₂ OCOMe	Me
140	S	H	Cl	Me	H	CH ₂ OCOPh	Me
141	S	H	Cl	Me	H	CH ₂ OSO ₂ Me	Me

142	S	H	Cl	Me	H	CH ₂ OSO ₂ CF ₃	Me
143	S	H	Cl	Me	H	CH ₂ OSO ₂ (4MePh)	Me
144	S	F	Cl	Me	H	CO ₂ H	Me
145	S	F	Cl	Me	H	CO ₂ Me	Me
146	S	F	Cl	Me	H	CO ₂ Et	Me
147	S	F	Cl	Me	H	CO ₂ CH ₂ Ph	Me
148	S	F	Cl	Me	H	CH ₂ OH	Me
149	S	F	Cl	Me	H	CH ₂ OMe	Me
150	S	F	Cl	Me	H	CH ₂ OCOMe	Me
151	S	F	Cl	Me	H	CH ₂ OCOPh	Me
152	S	F	Cl	Me	H	CH ₂ OSO ₂ Me	Me
153	S	F	Cl	Me	H	CH ₂ OSO ₂ CF ₃	Me
154	S	F	Cl	Me	H	CH ₂ OSO ₂ (4MePh)	Me
155	S	Cl	Cl	Me	H	CO ₂ H	Me
156	S	Cl	Cl	Me	H	CO ₂ Me	Me
157	S	Cl	Cl	Me	H	CO ₂ Et	Me
158	S	Cl	Cl	Me	H	CO ₂ CH ₂ Ph	Me
159	S	Cl	Cl	Me	H	CH ₂ OH	Me
160	S	Cl	Cl	Me	H	CH ₂ OMe	Me
161	S	Cl	Cl	Me	H	CH ₂ OCOMe	Me
162	S	Cl	Cl	Me	H	CH ₂ OCOPh	Me
163	S	Cl	Cl	Me	H	CH ₂ OSO ₂ Me	Me
164	S	Cl	Cl	Me	H	CH ₂ OSO ₂ CF ₃	Me
165	S	Cl	Cl	Me	H	CH ₂ OSO ₂ (4MePh)	Me
166	S	H	Cl	Me	Me	CO ₂ H	Me
167	S	H	Cl	Me	Me	CO ₂ Me	Me
168	S	H	Cl	Me	Me	CO ₂ Et	Me
169	S	H	Cl	Me	Me	CO ₂ CH ₂ Ph	Me
170	S	H	Cl	Me	Me	CH ₂ OH	Me
171	S	H	Cl	Me	Me	CH ₂ OMe	Me

172	S	H	Cl	Me	Me	CH ₂ OCOMe	Me
173	S	H	Cl	Me	Me	CH ₂ OCOPh	Me
174	S	H	Cl	Me	Me	CH ₂ OSO ₂ Me	Me
175	S	H	Cl	Me	Me	CH ₂ OSO ₂ CF ₃	Me
176	S	H	Cl	Me	Me	CH ₂ OSO ₂ (4MePh)	Me
177	S	F	Cl	Me	Me	CO ₂ H	Me
178	S	F	Cl	Me	Me	CO ₂ Me	Me
179	S	F	Cl	Me	Me	CO ₂ Et	Me
180	S	F	Cl	Me	Me	CO ₂ CH ₂ Ph	Me
181	S	F	Cl	Me	Me	CH ₂ OH	Me
182	S	F	Cl	Me	Me	CH ₂ OMe	Me
183	S	F	Cl	Me	Me	CH ₂ OCOMe	Me
184	S	F	Cl	Me	Me	CH ₂ OCOPh	Me
185	S	F	Cl	Me	Me	CH ₂ OSO ₂ Me	Me
186	S	F	Cl	Me	Me	CH ₂ OSO ₂ CF ₃	Me
187	S	F	Cl	Me	Me	CH ₂ OSO ₂ (4MePh)	Me
188	S	Cl	Cl	Me	Me	CO ₂ H	Me
189	S	Cl	Cl	Me	Me	CO ₂ Me	Me
190	S	Cl	Cl	Me	Me	CO ₂ Et	Me
191	S	Cl	Cl	Me	Me	CO ₂ CH ₂ Ph	Me
192	S	Cl	Cl	Me	Me	CH ₂ OH	Me
193	S	Cl	Cl	Me	Me	CH ₂ OMe	Me
194	S	Cl	Cl	Me	Me	CH ₂ OCOMe	Me
195	S	Cl	Cl	Me	Me	CH ₂ OCOPh	Me
196	S	Cl	Cl	Me	Me	CH ₂ OSO ₂ Me	Me
197	S	Cl	Cl	Me	Me	CH ₂ OSO ₂ CF ₃	Me
198	S	Cl	Cl	Me	Me	CH ₂ OSO ₂ (4MePh)	Me
199	S	H	Cl	H	H	CO ₂ H	H
200	S	H	Cl	H	H	CO ₂ Me	H
201	S	H	Cl	H	H	CO ₂ Et	H

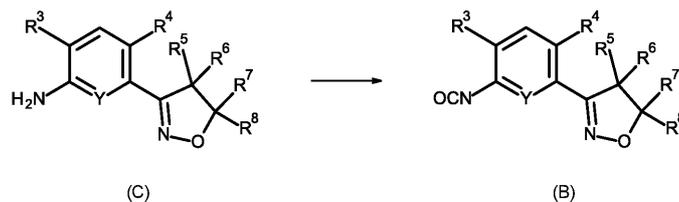
202	S	H	Cl	H	H	CO ₂ CH ₂ Ph	H
203	S	H	Cl	H	H	CH ₂ OH	H
204	S	H	Cl	H	H	CH ₂ OMe	H
205	S	H	Cl	H	H	CH ₂ OCOMe	H
206	S	H	Cl	H	H	CH ₂ OCOPh	H
207	S	H	Cl	H	H	CH ₂ OSO ₂ Me	H
208	S	H	Cl	H	H	CH ₂ OSO ₂ CF ₃	H
209	S	H	Cl	H	H	CH ₂ OSO ₂ (4MePh)	H
210	S	F	Cl	H	H	CO ₂ H	H
211	S	F	Cl	H	H	CO ₂ Me	H
212	S	F	Cl	H	H	CO ₂ Et	H
213	S	F	Cl	H	H	CO ₂ CH ₂ Ph	H
214	S	F	Cl	H	H	CH ₂ OH	H
215	S	F	Cl	H	H	CH ₂ OMe	H
216	S	F	Cl	H	H	CH ₂ OCOMe	H
217	S	F	Cl	H	H	CH ₂ OCOPh	H
218	S	F	Cl	H	H	CH ₂ OSO ₂ Me	H
219	S	F	Cl	H	H	CH ₂ OSO ₂ CF ₃	H
220	S	F	Cl	H	H	CH ₂ OSO ₂ (4MePh)	H
221	S	Cl	Cl	H	H	CO ₂ H	H
222	S	Cl	Cl	H	H	CO ₂ Me	H
223	S	Cl	Cl	H	H	CO ₂ Et	H
224	S	Cl	Cl	H	H	CO ₂ CH ₂ Ph	H
225	S	Cl	Cl	H	H	CH ₂ OH	H
226	S	Cl	Cl	H	H	CH ₂ OMe	H
227	S	Cl	Cl	H	H	CH ₂ OCOMe	H
228	S	Cl	Cl	H	H	CH ₂ OCOPh	H
229	S	Cl	Cl	H	H	CH ₂ OSO ₂ Me	H
230	S	Cl	Cl	H	H	CH ₂ OSO ₂ CF ₃	H
231	S	Cl	Cl	H	H	CH ₂ OSO ₂ (4MePh)	H

047159

232	S	H	Cl	CO ₂ H	Me	H	H
233	S	F	Cl	CO ₂ H	Me	H	H
234	S	Cl	Cl	CO ₂ H	Me	H	H
235	S	H	Cl	CO ₂ Et	Me	H	H
236	S	F	Cl	CO ₂ Et	Me	H	H
237	S	Cl	Cl	CO ₂ Et	Me	H	H
238	S	H	Cl	CH ₂ OH	Me	H	H
239	S	F	Cl	CH ₂ OH	Me	H	H
240	S	Cl	Cl	CH ₂ OH	Me	H	H
241	S	H	Cl	CO ₂ H	Me	H	Me
242	S	F	Cl	CO ₂ H	Me	H	Me
243	S	Cl	Cl	CO ₂ H	Me	H	Me
244	S	H	Cl	CO ₂ Et	Me	H	Me
245	S	F	Cl	CO ₂ Et	Me	H	Me
246	S	Cl	Cl	CO ₂ Et	Me	H	Me
247	S	H	Cl	CH ₂ OH	Me	H	Me
248	S	F	Cl	CH ₂ OH	Me	H	Me
249	S	Cl	Cl	CH ₂ OH	Me	H	Me
250	S	H	Cl	H	H	CO ₂ H	CF ₃
251	S	H	Cl	H	H	CO ₂ Me	CF ₃
252	S	H	Cl	H	H	CO ₂ Et	CF ₃
253	S	H	Cl	H	H	CO ₂ CH ₂ Ph	CF ₃
254	S	H	Cl	H	H	CH ₂ OH	CF ₃
255	S	H	Cl	H	H	CH ₂ OMe	CF ₃
256	S	H	Cl	H	H	CH ₂ OCOMe	CF ₃
257	S	H	Cl	H	H	CH ₂ OCOPh	CF ₃
258	S	H	Cl	H	H	CH ₂ OSO ₂ Me	CF ₃
259	S	H	Cl	H	H	CH ₂ OSO ₂ CF ₃	CF ₃
260	S	H	Cl	H	H	CH ₂ OSO ₂ (4MePh)	CF ₃
261	S	F	Cl	H	H	CO ₂ H	CF ₃

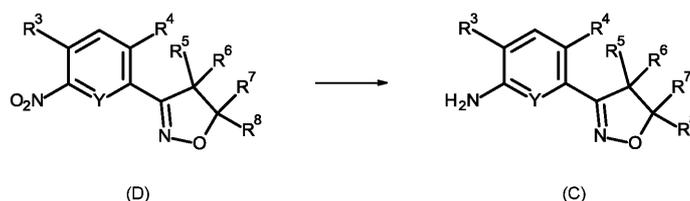
262	S	F	Cl	H	H	CO ₂ Me	CF ₃
263	S	F	Cl	H	H	CO ₂ Et	CF ₃
264	S	F	Cl	H	H	CO ₂ CH ₂ Ph	CF ₃
265	S	F	Cl	H	H	CH ₂ OH	CF ₃
266	S	F	Cl	H	H	CH ₂ OMe	CF ₃
267	S	F	Cl	H	H	CH ₂ OCOMe	CF ₃
268	S	F	Cl	H	H	CH ₂ OCOPh	CF ₃
269	S	F	Cl	H	H	CH ₂ OSO ₂ Me	CF ₃
270	S	F	Cl	H	H	CH ₂ OSO ₂ CF ₃	CF ₃
271	S	F	Cl	H	H	CH ₂ OSO ₂ (4MePh)	CF ₃
272	S	Cl	Cl	H	H	CO ₂ H	CF ₃
273	S	Cl	Cl	H	H	CO ₂ Me	CF ₃
274	S	Cl	Cl	H	H	CO ₂ Et	CF ₃
275	S	Cl	Cl	H	H	CO ₂ CH ₂ Ph	CF ₃
276	S	Cl	Cl	H	H	CH ₂ OH	CF ₃
277	S	Cl	Cl	H	H	CH ₂ OMe	CF ₃
278	S	Cl	Cl	H	H	CH ₂ OCOMe	CF ₃
279	S	Cl	Cl	H	H	CH ₂ OCOPh	CF ₃
280	S	Cl	Cl	H	H	CH ₂ OSO ₂ Me	CF ₃
281	S	Cl	Cl	H	H	CH ₂ OSO ₂ CF ₃	CF ₃
282	S	Cl	Cl	H	H	CH ₂ OSO ₂ (4MePh)	CF ₃
283	S	H	Cl	H	H	CONHSO ₂ Me	Me
284	S	F	Cl	H	H	CONHSO ₂ Me	Me
285	S	Cl	Cl	H	H	CONHSO ₂ Me	Me
286	S	H	Cl	H	H	CONHSO ₂ N(Me)(CHMe ₂)	Me
287	S	F	Cl	H	H	CONHSO ₂ N(Me)(CHMe ₂)	Me
288	S	Cl	Cl	H	H	CONHSO ₂ N(Me)(CHMe ₂)	Me
289	S	H	Cl	H	H	COMe	Me
290	S	F	Cl	H	H	COMe	Me
291	S	Cl	Cl	H	H	COMe	Me

Схема реакции 2.



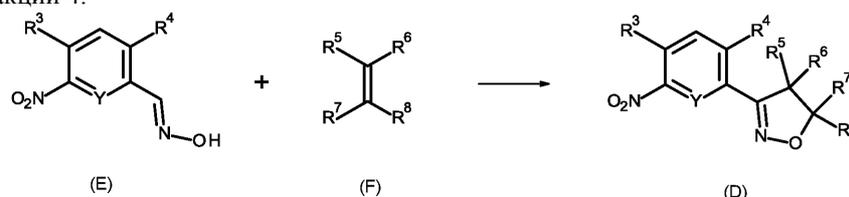
Например, соединение формулы (C) можно обрабатывать реагентом переноса карбонила, таким как дифосген или трифосген, в подходящем растворителе, таком как толуол. Анилины формулы (C) могут быть получены из нитросоединений формулы (D), как показано на схеме реакции 3.

Схема реакции 3.



Например, соединение формулы (D) можно обрабатывать восстановителем, таким как железо и хлорид аммония, в подходящем растворителе, таком как смесь воды и этанола. Нитросоединения формулы (D) могут быть получены из оксимов формулы (E) и алкенов формулы (F), как показано на схеме реакции 4.

Схема реакции 4.

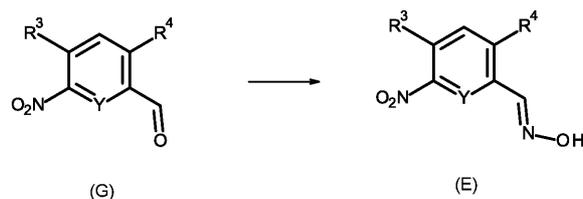


Например, оксим формулы (E) можно обрабатывать N-хлорсукцинимидом в подходящем растворителе, таком как диметилформамид, и полученное промежуточное соединение затем обрабатывают алкеном формулы (F) в присутствии основания, такого как триэтиламин, в подходящем растворителе, таком как дихлорметан.

Алкены формулы (F) доступны или могут быть получены с помощью способов, широко известных в литературе.

Оксимы формулы (E) могут быть получены из альдегидов формулы (G), как показано на схеме реакции 5.

Схема реакции 5.

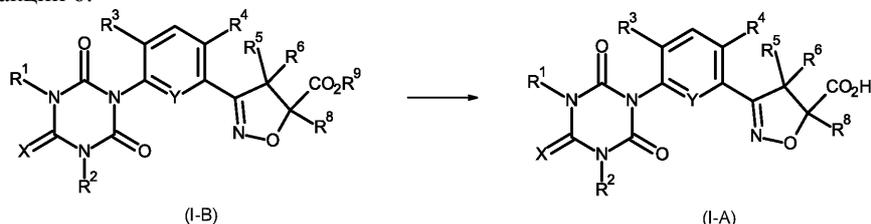


Например, альдегид формулы (G) можно обрабатывать гидрохлоридом гидроксиламина в подходящем растворителе, таком как смесь воды и этанола.

Альдегиды формулы (G) являются доступными или могут быть получены с помощью способов, известных в литературе.

Соединения формулы (I-A), которые представляют собой соединения формулы (I), в которых R^7 представляет собой группу карбоновой кислоты, можно получать из соединений формулы (I-B), которые представляют собой соединения формулы (I), в которых R^7 представляет собой CO_2R^9 , как показано на схеме реакции 6.

Схема реакции 6.

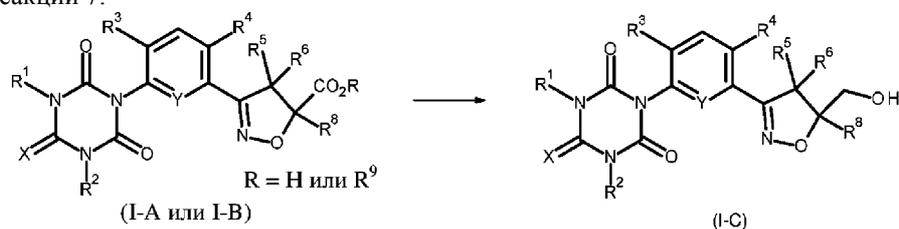


Например, соединение формулы (I-B) можно обрабатывать гидроксидом натрия в подходящем рас-

творителе, таком как смесь воды и этанола.

Соединения формулы (I-C), которые представляют собой соединения формулы (I), в которых R^7 представляет собой гидроксиметильную группу, можно получать из соединений формулы (I-A или I-B), как показано на схеме реакции 7.

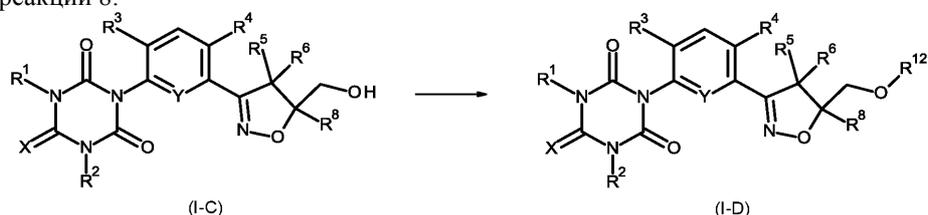
Схема реакции 7.



Например, соединение формулы (I-A) или (I-B) можно обрабатывать подходящим восстановителем, например металлогидридным реагентом, таким как борогидрид натрия или боран, в подходящем растворителе, таком как тетрагидрофуран.

Соединения формулы (I-D), которые представляют собой соединения формулы (I), в которых R^7 представляет собой CH_2OR^{12} , можно получать из соединений формулы (I-C), как показано на схеме реакции 8.

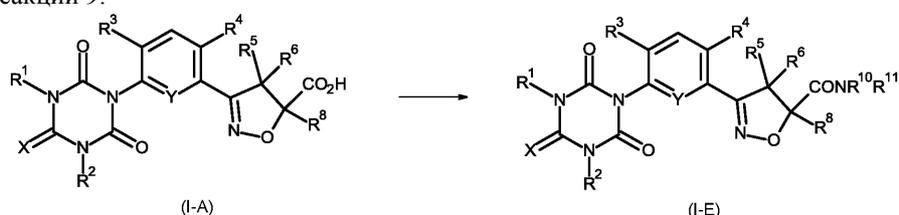
Схема реакции 8.



Например, соединение формулы (I-C) можно обрабатывать реагентом $R^{12}-LG$, где LG представляет собой уходящую группу, такую как галоген, таким как алкилирующее средство, ацилирующее средство или сульфонилующее средство, в присутствии основания, такого как гидрид натрия или триэтиламин, в подходящем растворителе, таком как тетрагидрофуран.

Соединения формулы (I-E), которые представляют собой соединения формулы (I), в которых R^7 представляет собой $CONR^{10}R^{11}$, можно получать из соединений формулы (I-A), как показано на схеме реакции 9.

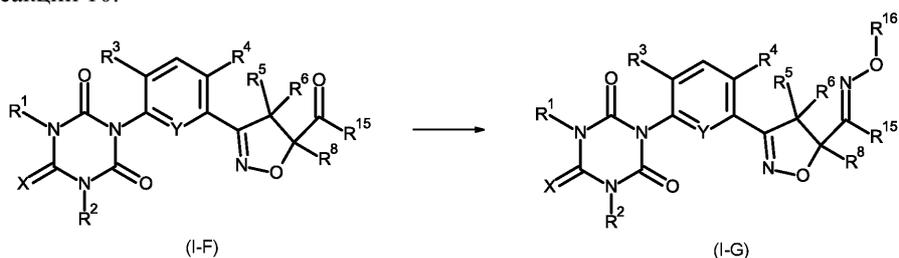
Схема реакции 9.



Например, соединение формулы (I-A) можно обрабатывать реагентом для галогенирования, таким как оксалилхлорид, в подходящем растворителе, таком как дихлорметан, с образованием ацилгалогенида, который можно обрабатывать реагентом $HNR^{10}R^{11}$ в присутствии основания, такого как триэтиламин, в подходящем растворителе, таком как дихлорметан.

Соединения формулы (I-G), которые представляют собой соединения формулы (I), в которых R^7 представляет собой оксимную группу, можно получать из соединений формулы (I-F), которые представляют собой соединения формулы (I), в которых R^7 представляет собой кетонную группу, как показано на схеме реакции 10.

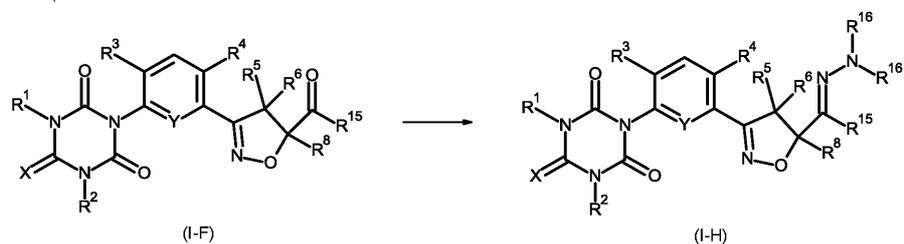
Схема реакции 10.



Например, соединение формулы (I-F) можно обрабатывать гидроксиламином H_2NOR^{16} или его солью, необязательно в присутствии основания, такого как триэтиламин, в подходящем растворителе, таком как этанол.

Соединения формулы (I-H), которые представляют собой соединения формулы (I), в которых R^7 представляет собой гидразоновую группу, можно получать из соединений формулы (I-F), которые представляют собой соединения формулы (I), в которых R^7 представляет собой кетоновую группу, как показано на схеме реакции 11.

Схема реакции 11.



Например, соединение формулы (I-F) можно обрабатывать гидразином $H_2NN(R^{16})_2$ или его солью, необязательно в присутствии основания, такого как триэтиламин, в подходящем растворителе, таком как этанол.

Специалисту в данной области будет понятно, что зачастую можно изменить порядок, в котором проводят описанные выше преобразования, или объединить их альтернативными способами для получения широкого диапазона соединений формулы (I). Несколько стадий также можно объединить в одну реакцию. Все такие варианты входят в объем настоящего изобретения.

Специалисту в данной области также будет понятно, что некоторые реагенты будут несовместимы с определенными значениями или комбинациями заместителей X, Y, Z, R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 , R^7 , R^8 , R^9 , R^{10} , R^{11} , R^{12} , R^{13} , R^{14} , R^{15} и R^{16} , определенных в данном документе, и любые дополнительные стадии, такие как стадии введения защитной группы и/или удаления защитной группы, которые необходимы для достижения желаемого превращения, будут понятны специалисту в данной области.

Соединения в соответствии с настоящим изобретением можно применять в качестве гербицидных средств в немодифицированной форме, но, как правило, их различными способами составляют в композиции с применением вспомогательных веществ для составления, таких как носители, растворители и поверхностно-активные вещества. Составы могут находиться в различных физических формах, например, в форме распыляемых порошков, гелей, смачиваемых порошков, диспергируемых в воде гранул, диспергируемых в воде таблеток, шипучих драже, эмульгируемых концентратов, концентратов микроэмульсий, эмульсий типа "масло в воде", масляных текучих составов, водных дисперсий, масляных дисперсий, суспензий, капсульных суспензий, эмульгируемых гранул, растворимых жидкостей, водорастворимых концентратов (с водой или смешиваемым с водой органическим растворителем в качестве носителя), пропитанных полимерных пленок или в других формах, известных, например, из Manual on Development and Use of FAO and WHO Specifications for Pesticides, United Nations, First Edition, Second Revision (2010). Для водорастворимых соединений являются предпочтительными растворимые жидкости, водорастворимые концентраты или растворимые в воде гранулы. Такие составы можно либо применять непосредственно, либо разбавлять перед применением. Разбавления можно осуществлять, например, с помощью воды, жидких удобрений, питательных микроэлементов, биологических организмов, масла или растворителей.

Составы можно получать, например, путем смешивания активного ингредиента со вспомогательными веществами для составления с получением композиций в форме тонкодисперсных твердых веществ, гранул, растворов, дисперсий или эмульсий. Активные ингредиенты также можно составлять с другими вспомогательными веществами, например, тонкодисперсными твердыми веществами, минеральными маслами, маслами растительного или животного происхождения, модифицированными маслами растительного или животного происхождения, органическими растворителями, водой, поверхностно-активными веществами или их комбинациями.

Активные ингредиенты также могут содержаться в очень мелких микрокапсулах. Микрокапсулы содержат активные ингредиенты в пористом носителе. Это обеспечивает возможность высвобождения активных ингредиентов в окружающую среду в регулируемых количествах (например, медленного высвобождения). Микрокапсулы обычно имеют диаметр от 0,1 до 500 мкм. Они содержат активные ингредиенты в количестве от приблизительно 25 до 95% по весу от веса капсулы. Активные ингредиенты могут находиться в форме монолитного твердого вещества, в форме мелких частиц в твердой или жидкой дисперсии или в форме подходящего раствора. Инкапсулирующие мембраны могут содержать, например, природные и синтетические каучуки, целлюлозу, сополимеры стирола и бутадиена, полиакрилонитрил, полиакрилат, сложные полиэфиры, полиамиды, полимочевины, полиуретан или химически модифицированные полимеры и ксантаты крахмала или другие полимеры, которые известны специалисту в данной области техники. Альтернативно могут быть образованы очень мелкие микрокапсулы, в которых активный ингредиент содержится в форме тонкодисперсных частиц в твердой матрице основного вещества, однако микрокапсулы сами по себе не являются инкапсулированными.

Вспомогательные вещества для составления, которые являются подходящими для получения ком-

позиций в соответствии с настоящим изобретением, являются известными *per se*. В качестве жидких носителей можно применять воду, толуол, ксилол, петролейный эфир, растительные масла, ацетон, метилэтилкетон, циклогексанон, ангидриды кислот, ацетонитрил, ацетофенон, амилацетат, 2-бутанон, бутиленкарбонат, хлорбензол, циклогексан, циклогексанол, алкиловые сложные эфиры уксусной кислоты, диацетоновый спирт, 1,2-дихлорпропан, диэтанолламин, п-диэтилбензол, диэтиленгликоль, абиетат диэтиленгликоля, бутиловый простой эфир диэтиленгликоля, этиловый простой эфир диэтиленгликоля, метиловый простой эфир диэтиленгликоля, N,N-диметилформамид, диметилсульфоксид, 1,4-диоксан, дипропиленгликоль, метиловый эфир дипропиленгликоля, дибензоат дипропиленгликоля, дипрокситол, алкилпирролидон, этилацетат, 2-этилгексанол, этиленкарбонат, 1,1,1-трихлорэтан, 2-гептанон, альфа-пинен, d-лимонен, этиллактат, этиленгликоль, бутиловый простой эфир этиленгликоля, метиловый простой эфир этиленгликоля, гамма-бутиролактон, глицерин, ацетат глицерина, диацетат глицерина, триацетат глицерина, гексадекан, гексиленгликоль, изоамилацетат, изоборнилацетат, изооктан, изофорон, изопропилбензол, изопропилмирилат, молочную кислоту, лауриламид, мезитилоксид, метоксипропанол, метил-изоамилкетон, метил-изобутилкетон, метиллаурат, метилоктаноат, метилолеат, метилхлорид, м-ксилол, н-гексан, н-октиламин, октадекановую кислоту, октиламинацетат, олеиновую кислоту, олеиламин, о-ксилол, фенол, полиэтиленгликоль, пропионовую кислоту, пропиллактат, пропиленкарбонат, пропиленгликоль, метиловый эфир пропиленгликоля, п-ксилол, толуол, триэтилфосфат, триэтиленгликоль, ксилолсульфовую кислоту, парафин, минеральное масло, трихлорэтилен, перхлорэтилен, этилацетат, амилацетат, бутилацетат, метиловый простой эфир пропиленгликоля, метиловый простой эфир диэтиленгликоля, метанол, этанол, изопропанол и высокомолекулярные спирты, такие как амиловый спирт, тетрагидрофуруриловый спирт, гексанол, октанол, этиленгликоль, пропиленгликоль, глицерин, N-метил-2-пирролидон и т.п.

Подходящими твердыми носителями являются, например, тальк, диоксид титана, пирофиллитовая глина, диоксид кремния, аттапульгитовая глина, кизельгур, известняк, карбонат кальция, бентонит, кальциевый монтмориллонит, шелуха семян хлопчатника, пшеничная мука, соевая мука, пемза, древесная мука, измельченная скорлупа грецких орехов, лигнин и подобные вещества.

Большое количество поверхностно-активных веществ можно успешно использовать как в твердых, так и в жидких составах, особенно в тех составах, которые можно разбавлять носителем перед применением. Поверхностно-активные вещества могут быть анионными, катионными, неионогенными или полимерными, и их можно применять в качестве эмульгаторов, смачивающих средств или суспендирующих средств или для других целей. Типичные поверхностно-активные вещества включают, например, соли алкилсульфатов, такие как лаурилсульфат диэтанолламмония; соли алкиларилсульфонатов, такие как додецилбензолсульфонат кальция; продукты присоединения алкилфенола/алкиленоксида, такие как этилоксидат нонилфенола; продукты присоединения спирта/алкиленоксида, такие как этоксидат тридецилового спирта; мыла, такие как стеарат натрия; соли алкилнафталинсульфонатов, такие как дибутилнафталинсульфонат натрия; диалкиловые сложные эфиры сульфосукцинатных солей, такие как ди(2-этилгексил)сульфосукцинат натрия; сложные эфиры сорбита, такие как сорбитолеат; четвертичные амины, такие как хлорид лаурилтриметиламмония, полиэтиленгликолевые сложные эфиры жирных кислот, такие как стеарат полиэтиленгликоля; блок-сополимеры этиленоксида и пропиленоксида и соли моно- и диалкилфосфатных сложных эфиров; а также дополнительные вещества, описанные, например, в *McCutcheon's Detergents and Emulsifiers Annual*, MC Publishing Corp., Ridgewood New Jersey (1981).

Дополнительные вспомогательные вещества, которые можно использовать в пестицидных составах, включают ингибиторы кристаллизации, модификаторы вязкости, суспендирующие средства, красители, антиоксиданты, вспенивающие средства, поглотители света, вспомогательные средства для смешивания, противовспениватели, комплексообразующие средства, нейтрализующие или pH-модифицирующие вещества и буферы, ингибиторы коррозии, отдушки, смачивающие средства, усилители поглощения, питательные микроэлементы, пластификаторы, вещества, способствующие скольжению, смазывающие вещества, диспергирующие вещества, загустители, антифризы, микробициды, а также жидкие и твердые удобрения.

Композиции в соответствии с настоящим изобретением могут включать добавку, предусматривающую масло растительного или животного происхождения, минеральное масло, алкиловые сложные эфиры таких масел или смеси таких масел и производных масел. Количество масляной добавки в композиции в соответствии с настоящим изобретением обычно составляет от 0,01 до 10% в пересчете на смесь, подлежащую применению. Например, масляную добавку можно вносить в резервуар опрыскивателя в требуемой концентрации после получения смеси для опрыскивания. Предпочтительные масляные добавки включают минеральные масла или масло растительного происхождения, например, рапсовое масло, оливковое масло или подсолнечное масло, эмульгированное растительное масло, алкиловые сложные эфиры масел растительного происхождения, например метиловые производные, или масло животного происхождения, такое как рыбий жир или говяжий жир. Предпочтительные масляные добавки включают алкиловые сложные эфиры C₈-C₂₂-жирных кислот, особенно метальные производные C₁₂-C₁₈-жирных кислот, например, метиловые сложные эфиры лауриновой кислоты, пальмитиновой кислоты и олеиновой кислоты (метиллаурат, метилпальмитат и метилолеат соответственно). Многие производные масел из-

вестны из Compendium of Herbicide Adjuvants, 10th Edition, Southern Illinois University, 2010.

Гербицидные композиции, как правило, содержат от 0,1 до 99% по весу, в частности от 0,1 до 95% по весу соединений формулы (I) и от 1 до 99,9% по весу вспомогательного средства для составления, которое предпочтительно включает от 0 до 25% по весу поверхностно-активного вещества. Композиции по настоящему изобретению, как правило, содержат от 0,1 до 99% по весу, в частности от 0,1 до 95% по весу соединений по настоящему изобретению и от 1 до 99,9% по весу вспомогательного вещества для составления, которое предпочтительно включает от 0 до 25% по весу поверхностно-активного вещества. Поскольку коммерческие продукты предпочтительно могут быть составлены в виде концентратов, то конечный потребитель обычно будет использовать разбавленные составы.

Нормы применения варьируются в широких пределах и зависят от свойств почвы, способа применения, культурного растения, вредителя, подлежащего контролю, преобладающих климатических условий и других факторов, определяемых способом применения, временем применения и целевой сельскохозяйственной культурой. В качестве общего руководства, соединения можно применять в норме от 1 до 2000 л/га, в частности, от 10 до 1000 л/га.

Предпочтительные составы могут характеризоваться следующими композициями (вес.%).

Эмульгируемые концентраты:

активный ингредиент:	1-95%, предпочтительно 60-90%;
поверхностно-активное вещество:	1-30%, предпочтительно 5-20%;
жидкий носитель:	1-80%, предпочтительно 1-35%.

Пылевидные препараты:

активный ингредиент:	0,1-10%, предпочтительно 0,1-5%;
твердый носитель:	99,9-90%, предпочтительно 99,9-99%.

Суспензионные концентраты:

активный ингредиент:	5-75%, предпочтительно 10-50%;
вода:	94-24%, предпочтительно 88-30%;
поверхностно-активное вещество:	1-40%, предпочтительно 2-30%.

Смачиваемые порошки:

активный ингредиент:	0,5-90%, предпочтительно 1-80%;
поверхностно-активное вещество:	0,5-20%, предпочтительно 1-15%;
твердый носитель:	5-95%, предпочтительно 15-90%.

Гранулы:

активный ингредиент:	0,1-30%, предпочтительно 0,1-15%;
твердый носитель:	99,5-70%, предпочтительно 97-85%.

Композиция по настоящему изобретению может дополнительно содержать по меньшей мере один дополнительный пестицид. Например, соединения в соответствии с настоящим изобретением также можно применять в комбинации с другими гербицидами или регуляторами роста растений. В предпочтительном варианте осуществления дополнительным пестицидом является гербицид и/или антидот гербицида.

Таким образом, соединения формулы (I) можно применять в комбинации с одним или несколькими другими гербицидами для обеспечения различных гербицидных смесей. Конкретные примеры таких смесей включают (где "I" представляет собой соединение формулы (I)): I+ацетохлор; I+ацифлуорфен (в том числе ацифлуорфен-натрий); I+аклонифен; I+алахлор; I+аллоксидим; I+аметрин; I+амикарбазон; I+амидосульфурон; I+аминоциклопирахлор; I+аминопиралид; I+амитрол; I+асулам; I+атразин; I+бенсульфурон (в том числе бенсульфурон-метил); I+бентазон; I+бициклопирон; I+биланафос; I+бифенокс; I+биспирибак-натрий; I+бикслон; I+бромацил; I+бромоксинил; I+бутахлор; I+бутафенацил; I+кафенстрол; I+карфентразон (в том числе карфентразон-этил); клорансулам (в том числе клорансулам-метил); I+хлоримурон (в том числе хлоримурон-этил); I+хлоротолурон; I+циносульфурон; I+хлорсульфурон; I+цинметилин; I+клацифос; I+клетодим; I+клодинафоп (в том числе клодинафоп-пропаргил); I+кломазон; I+клопиралид; I+циклопиранил; I+циклопириморат; I+циклосульфамурон; I+цигалофоп (в том числе цигалофоп-бутил); I+2,4-D (в том числе соль холина и ее 2-этилгексилловый сложный эфир); I+2,4-DB; I+даимурон; I+десмедифам; I+дикамба (в том числе ее соли с алюминием, аминопропилом, бис-аминопропилметилом, холином, дихлорпропом, дигликольамином, диметиламином, диметиламмонием, калием и натрием); I+диклофоп-метил; I+диклосулам; I+дифлуфеникан; I+дифензокват; I+дифлуфеникан; I+дифлуфензопир; I+диметахлор; I+диметенамид-Р; I+дикват дибромид; I+диурон; I+эспрокарб; I+эталфлуралин; I+этофумезат; I+феноксапроп (в том числе феноксапроп-Р-этил); I+феноксасульфурон; I+фенквинотрион; I+фентразамид; I+флазасульфурон; I+флорасулам; I+флорпирауоксифен; I+флуазифоп (в том числе флуазифоп-Р-бутил); I+флукарбазон (в том числе флукарбазон-натрий); I+флуфенацет; I+флуметралин; I+флуметсулам; I+флумиоксазин; I+флупирсульфурон (в том числе флупирсульфурон-метил-натрий); I+флуороксипир (в том числе флуороксипир-метил); I+флутиацет-метил; I+фомесафен; I+форамсульфурон; I+глофосинат (в том числе его

аммониевая соль); I+глифосат (в том числе его диаммониевые, изопропиламмониевые и калиевые соли); I+галауоксифен (в том числе галауоксифен-метил); I+галосульфурон-метил; I+галоксифоп (в том числе галоксифоп-метил); I+гексазинон; I+гидантоцидин; I+имазамокс; I+имазапик; I+имазапир; I+имазаквин; I+имазетапир; I+индазифлам; I+йодосульфурон (в том числе йодосульфурон-метил-натрий); I+иофенсульфурон; I+иофенсульфурон-натрий; I+иоксинил; I+ипфенкарбазон; I+изопротурон; I+изоксабен; I+изоксафлютол; I+лактофен; I+ланкотрион; I+линурон; I+МСРА; I+МСРВ; I+мекопроп-Р; I+мефенацет; I+мезосульфурон; I+мезосульфурон-метил; I+мезотрион; I+метамитрон; I+метазахлор; I+метиозолин; I+метобромурон; I+метолахлор; I+метосулам; I+метоксурон; I+метрибузин; I+метсульфурон; I+молинат; I+напропамид; I+никосульфурон; I+нофлуразон; I+ортосульфамурон; I+оксадиаргил; I+оксадиазон; I+оксасульфурон; I+оксифлуорфен; I+паракват дихлорид; I+пендиметалин; I+пеносулам; I+фенмедифам; I+пихлорам; I+пиколинафен; I+пиноксаден; I+претилахлор; I+примисульфурон-метил; I+продиамин; I+прометрин; I+пропахлор; I+пропанил; I+пропаквизафоп; I+профам; I+пропирисульфурон; I+пропизамид; I+просульфокарб; I+просульфурон; I+пираклонил; I+пирافلфен (в том числе пирافلфен-этил); I+пирасульфотол; I+пиразолинат; I+пиразосульфурон-этил; I+пирибензоксим; I+пиридат; I+пирифалид; I+пиримисульфам; I+пиритиобак-натрий; I+пироксасульфон; I+пироксулам; I+квинклолак; I+квинмерак; I+квизалофоп (в том числе квизалофоп-Р-этил и квизалофоп-Р-тефурил); I+ римсульфурон; I+сафлуфенацил; I+сетоксидим; I+симазин; I+S-метолахлор; I+сулькотрион; I+сульфентразон; I+сульфосульфурон; I+тебутиурон; I+тефурилтрион; I+темботрион; I+тербутилазин; I+тербутрин; I+тиенкарбазон; I+тифенсульфурон; I+тиафенацил; I+толпиралат; I+топрамезон; I+тралкоксидим; I+триафамон; I+триаллат; I+триасульфурон; I+трибенурон (в том числе трибенурон-метил); I+трихлопир; I+трифлорисульфурон (в том числе трифлорисульфурон-натрий); I+трифлудимоксазин; I+трифлуралин; I+трифлусульфурон; I+тритосульфурон; I+4-гидрокси-1-метокси-5-метил-3-[4-(трифторметил)-2-пиридил]имидазолидин-2-он; I+4-гидрокси-1,5-диметил-3-[4-(трифторметил)-2-пиридил]имидазолидин-2-он; I+5-этокси-4-гидрокси-1-метил-3-[4-(трифторметил)-2-пиридил]имидазолидин-2-он; I+4-гидрокси-1-метил-3-[4-(трифторметил)-2-пиридил]имидазолидин-2-он; I+4-гидрокси-1,5-диметил-3-[1-метил-5-(трифторметил)пиразол-3-ил]имидазолидин-2-он; I+(4R)1-(5-трет-бутилизоксазол-3-ил)-4-этокси-5-гидрокси-3-метилимидазолидин-2-он; I+3-[2-(3,4-диметоксифенил)-6-метил-3-оксопиридазин-4-карбонил]бицикло[3.2.1]октан-2,4-дион; I+2-[2-(3,4-диметоксифенил)-6-метил-3-оксопиридазин-4-карбонил]-5-метилциклогексан-1,3-дион; I+2-[2-(3,4-диметоксифенил)-6-метил-3-оксопиридазин-4-карбонил]циклогексан-1,3-дион; I+2-[2-(3,4-диметоксифенил)-6-метил-3-оксопиридазин-4-карбонил]-5,5-диметилциклогексан-1,3-дион; I+6-[2-(3,4-диметоксифенил)-6-метил-3-оксопиридазин-4-карбонил]-2,2,4,4-тетраметилциклогексан-1,3,5-трион; I+2-[2-(3,4-диметоксифенил)-6-метил-3-оксопиридазин-4-карбонил]-5-этилциклогексан-1,3-дион; I+2-[2-(3,4-диметоксифенил)-6-метил-3-оксопиридазин-4-карбонил]-4,4,6,6-тетраметилциклогексан-1,3-дион; I+2-[6-циклопропил-2-(3,4-диметоксифенил)-3-оксопиридазин-4-карбонил]бицикло[3.2.1]октан-2,4-дион; I+2-[6-циклопропил-2-(3,4-диметоксифенил)-3-оксопиридазин-4-карбонил]-5,5-диметилциклогексан-1,3-дион; I+6-[6-циклопропил-2-(3,4-диметоксифенил)-3-оксопиридазин-4-карбонил]-2,2,4,4-тетраметилциклогексан-1,3,5-трион; I+2-[6-циклопропил-2-(3,4-диметоксифенил)-3-оксопиридазин-4-карбонил]циклогексан-1,3-дион; I+4-[2-(3,4-диметоксифенил)-6-метил-3-оксопиридазин-4-карбонил]-2,2,6,6-тетраметилтетрагидропиран-3,5-дион и I+4-[6-циклопропил-2-(3,4-диметоксифенил)-3-оксопиридазин-4-карбонил]-2,2,6,6-тетраметилтетрагидропиран-3,5-дион.

Компоненты, смешиваемые с соединением формулы (I), также могут находиться в форме сложных эфиров или солей, как упоминается, например, в The Pesticide Manual, Fourteenth Edition, British Crop Protection Council, 2006.

Соединение формулы (I) также можно применять в смесях с другими агрохимическими средствами, такими как фунгициды, нематоциды или инсектициды, примеры которых приведены в The Pesticide Manual.

Соотношение в смеси соединения формулы (I) и смешиваемого компонента предпочтительно составляет от 1: 100 до 1000:1.

Смеси преимущественно можно применять в упомянутых выше составах (в этом случае выражение "активный ингредиент" относится к соответствующей смеси соединения формулы (I) со смешиваемым компонентом).

Соединения формулы (I) по настоящему изобретению могут также быть объединены с антидотами гербицидов. Предпочтительные комбинации (где "I" представляет собой соединение формулы (I)) включают: I+беноксакор, I+клоквинтосет (в том числе клоквинтосет-мексил); I+ципросульфамид; I+дихлормид; I+фенхлоразол (в том числе фенхлоразол-этил); I+фенклорим; I+флукофеним; I+фуриазол I+изоксадифен (в том числе изоксадифен-этил); I+мефенпир (в том числе мефенпир-диэтил); I+меткаифен; I+N-(2-метоксибензоил)-4-[(метиламинокарбонил)амино]бензолсульфонамид и I+оксабетринил.

В частности, предпочтительными являются смеси соединения формулы (I) с ципросульфамидом,

изоксадифеном (в том числе изоксадифен-этилом), клоквиносетом (в том числе клоквиносет-мексиллом) и/или N-(2-метоксибензоил)-4-[(метиламинокарбонил)амино]бензолсульфонамидом.

Антидоты для соединения формулы (I) также могут находиться в форме сложных эфиров или солей, как упоминается, например, в *The Pesticide Manual*, 14th Edition (BCPC), 2006. Ссылка на клоквиносет-мексил также относится к его соли с литием, натрием, калием, кальцием, магнием, алюминием, железом, аммонием, четвертичным аммонием, сульфонием или фосфонием, как раскрыто в WO 02/34048, а ссылка на фенхлоразол-этил также относится к фенхлоразолу и т.д.

Предпочтительно соотношение в смеси соединения формулы (I) и антидота составляет от 100:1 до 1:10, в частности от 20:1 до 1:1.

Смеси преимущественно можно применять в вышеупомянутых составах (в случае чего выражение "активный ингредиент" относится к соответствующей смеси соединения формулы (I) с антидотом).

Соединения формулы (I) по настоящему изобретению являются пригодными в качестве гербицидов. Следовательно, в настоящем изобретении дополнительно предусмотрен способ контроля нежелательных растений, включающий применение в отношении указанных растений или места произрастания, содержащего их, эффективного количества соединения по настоящему изобретению или гербицидной композиции, содержащей указанное соединение. "Контроль" означает уничтожение, снижение или замедление роста или предупреждение или снижение прорастания. Обычно растениями, подлежащими контролю, являются нежелательные растения (сорняки). "Место произрастания" означает территорию, на которой растения произрастают или будут произрастать.

Нормы применения соединений формулы (I) могут изменяться в широких пределах и зависят от свойств почвы, способа применения (до появления всходов; после появления всходов; применение по отношению к борозде для семян; применение при беспашотной обработке и т.д.), культурного растения, сорняка(сорняков), подлежащего(подлежащих) контролю, преобладающих климатических условий и других факторов, определяемых способом применения, временем применения и целевой сельскохозяйственной культурой. Соединения формулы (I) в соответствии с настоящим изобретением, как правило, применяют при норме от 10 до 2000 г/га, в частности от 50 до 1000 г/га. Предпочтительный диапазон составляет 10-200 г/га.

Применение обычно осуществляют посредством распыления композиции, как правило, с помощью установленного на тракторе опрыскивателя для больших площадей, но также можно применять и другие способы, такие как опыление (для порошков), капельный полив или орошение.

Полезные растения, по отношению к которым можно применять композицию в соответствии с настоящим изобретением, включают сельскохозяйственные культуры, такие как зерновые, например, ячмень и пшеница, хлопчатник, масличный рапс, подсолнечник, маис, рис, соя, сахарная свекла, сахарный тростник и дерновой покров.

Культурные растения могут также включать деревья, такие как плодовые деревья, пальмовые деревья, кокосовые пальмы или другие орехоплодные культуры. Также включены вьющиеся растения, такие как виноград, плодовые кустарники, плодовые растения и овощные культуры.

Следует понимать, что сельскохозяйственные культуры также включают те сельскохозяйственные культуры, которым придали выносливость к гербицидам или классам гербицидов (например, ALS-, GS-, EPSPS-, PPO-, ACCаза- и HPPD-ингибиторы) с помощью традиционных способов селекции или с помощью генетической инженерии. Примером сельскохозяйственной культуры, которой придали выносливость к имидазолинонам, например, имазамоксу, с помощью традиционных способов селекции, является сурепица (канола) Clearfield®. Примеры сельскохозяйственных культур, которым придали выносливость к гербицидам с помощью способов генной инженерии, включают, например, устойчивые к глифосату и глюфосинату сорта маиса, коммерчески доступные под товарными знаками RoundupReady® и LibertyLink®.

Под сельскохозяйственными культурами также следует понимать те, которым с помощью способов генетической инженерии была придана устойчивость к вредным насекомым, например, Bt-маис (устойчивый к мотыльку кукурузному), Bt-хлопчатник (устойчивый к долгоносику хлопковому), а также разновидности Bt-картофеля (устойчивые к колорадскому жуку). Примерами Bt-маиса являются гибриды маиса Bt 176 NK® (Syngenta Seeds). Токсин Bt представляет собой белок, который в природе образуют почвенные бактерии *Bacillus thuringiensis*. Примеры токсинов или трансгенных растений, способных синтезировать такие токсины, описаны в EP-A-451878, EP-A-374753, WO 93/07278, WO 95/34656, WO 03/052073 и EP-A-427529. Примерами трансгенных растений, содержащих один или несколько генов, кодирующих устойчивость к насекомым, и экспрессирующих один или несколько токсинов, являются KnockOut® (маис), Yield Gard® (маис), NuCOTIN33B® (хлопчатник), Bollgard® (хлопчатник), New-Leaf® (разновидности картофеля), NatureGard® и Protexcta®. Растительные культуры или их семенной материал могут быть устойчивыми к гербицидам и в то же время устойчивыми к поеданию насекомыми (трансгенные объекты с "пакетированными" генами). Например, семя может обладать способностью экспрессировать инсектицидный белок Cry3, в то же время будучи выносливым к глифосату.

Также следует понимать, что сельскохозяйственные культуры включают те, которые получены тра-

диционными способами селекции или генетической инженерии и обладают так называемыми привнесенными признаками (например, улучшенной стабильностью при хранении, более высокой питательной ценностью и улучшенным вкусом).

Другие полезные растения включают газонную траву, например, на гольф-площадках, лужайках, в парках и на обочинах дороги или коммерчески выращиваемую для газона, и декоративные растения, такие как цветы или кустарники.

Соединения формулы (I) и композиции по настоящему изобретению, как правило, можно применять для контроля большого разнообразия однодольных и двудольных видов сорняков. Примеры однодольных видов, которые обычно можно контролировать, включают *Alopecurus myosuroides*, *Avena fatua*, *Brachiaria plantaginea*, *Bromus tectorum*, *Cyperus esculentus*, *Digitaria sanguinalis*, *Echinochloa crus-galli*, *Lolium perenne*, *Lolium multiflorum*, *Panicum miliaceum*, *Poa annua*, *Setaria viridis*, *Setaria faberi* и *Sorghum bicolor*. Примеры двудольных видов, которые можно контролировать, включают *Abutilon theophrasti*, *Amaranthus retroflexus*, *Bidens pilosa*, *Chenopodium album*, *Euphorbia heterophylla*, *Galium aparine*, *Ipomoea hederacea*, *Kochia scoparia*, *Polygonum convolvulus*, *Sida spinosa*, *Sinapis arvensis*, *Solarium nigrum*, *Stellaria media*, *Veronica persica* и *Xanthium strumarium*.

Соединения формулы (I) также пригодны для предуборочной десикации сельскохозяйственных культур, например, без ограничения картофеля, сои, сортов подсолнечника и хлопчатника. Предуборочную десикацию применяют для высушивания листьев сельскохозяйственных культур без значительного повреждения самой сельскохозяйственной культуры для способствования сбору урожая.

Соединения/композиции по настоящему изобретению особенно пригодны в неселективных контактных вариантах применения со "сплошным действием" и, как таковые, также могут применяться для контроля самосева или культурных "растений-беглецов".

Различные аспекты и варианты осуществления настоящего изобретения далее будут более подробно проиллюстрированы с помощью примера. Следует понимать, что можно осуществлять модификацию некоторых подробностей без отступления от объема настоящего изобретения.

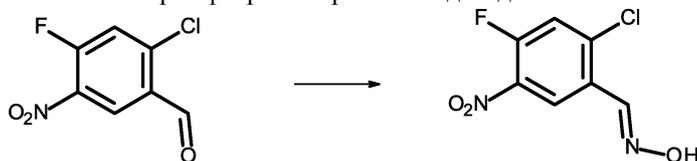
Примеры

Следующие примеры служат для иллюстрации, но не для ограничения настоящего изобретения.

Примеры синтеза

Пример 1. Синтез этил-3-[2-хлор-5-(3,5-диметил-2,6-диоксо-4-тиоксо-1,3,5-триазинан-1-ил)-4-фторфенил]-5-метил-4Н-изоксазол-5-карбоксилата (соединения 47).

Стадия 1. Синтез оксима 2-хлор-4-фтор-5-нитробензальдегида



Гидрохлорид гидроксиламина (6,39 г, 92 ммоль) добавляли к перемешиваемому раствору 2-хлор-4-фтор-5-нитробензальдегида (13 г, 61,3 ммоль) в этаноле (65 мл) при комнатной температуре. Полученный раствор перемешивали при комнатной температуре в течение дополнительных 60 мин. Добавляли воду (125 мл) и полученную смесь фильтровали с получением оксима 2-хлор-4-фтор-5-нитробензальдегида в виде желтого твердого вещества (13,0 г).

¹H ЯМР (400 МГц, CHCl₃) δ 8,65 (d, 1H), 8,5 (s, 1H), 8,1 (br s, 1H), 7,4 (d, 1H) ppm.

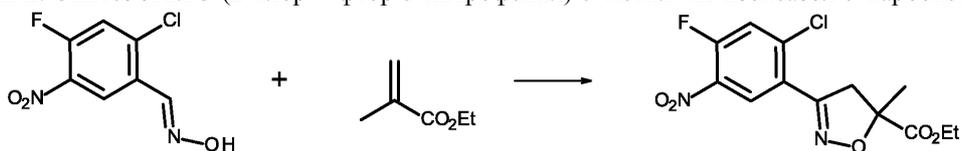
С помощью данного общего способа также были получены:

оксим 2-хлор-5-нитробензальдегида.

¹H ЯМР (400 МГц, CHCl₃) δ 8,75 (s, 1H), 8,55 (s, 1H), 8,15 (m, 1H), 7,9 (s, 1H), 7,6 (m, 1H) ppm.

Оксим 2,4-дихлор-5-нитробензальдегида.

Стадия 2. Синтез этил-3-(2-хлор-4-фтор-5-нитрофенил)-5-метил-4Н-изоксазол-5-карбоксилата



1-Хлорпирролидин-2,5-дион (0,6 мл, 6,6 ммоль) добавляли частями в течение 10 мин к перемешиваемому раствору оксима 2-хлор-4-фтор-5-нитробензальдегида (1,2 г, 5,5 ммоль) в N,N-диметилформамиде (4,8 мл) при 30°C. Полученную смесь перемешивали при 35°C в течение 1 ч, затем охлаждали до комнатной температуры и добавляли дихлорметан (50 мл). Смесь промывали разбавленной хлористоводородной кислотой (15 мл), высушивали и охлаждали до 5°C. К этому перемешиваемому раствору добавляли по каплям смесь триэтиламина (1,33 мл, 9,5 ммоль) и этил-2-метилпроп-2-еноата (1,14 г, 9,5 ммоль). После отстаивания при комнатной температуре в течение 17 часов добавляли разбавленную хлористоводородную кислоту (5 мл), фазы разделяли и органическую фазу высушивали и очищали с помощью хроматографии с получением этил-3-(2-хлор-4-фтор-5-нитрофенил)-5-метил-4Н-изоксазол-5-

карбоксилата (1,0 г).

^1H ЯМР (400 МГц, CHCl_3) δ 8,45 (d, 1H), 7,45 (d, 1H), 4,3 (q, 2H), 4,0 (d, 1H), 3,4 (d, 1H), 1,75 (s, 3H), 1,35 (t, 3H) ppm.

С помощью данного общего способа также были получены:

этил-3-(2-хлор-5-нитрофенил)-5-метил-4Н-изоксазол-5-карбоксилат.

^1H ЯМР (400 МГц, CHCl_3) δ 8,55 (d, 1H), 8,2 (d, 1H), 7,65 (d, 1H), 4,3 (q, 2H), 4,05 (d, 1H), 3,4 (d, 1H), 1,75 (s, 3H), 1,35 (t, 3H) ppm.

Метил-3-(2-хлор-4-фтор-5-нитрофенил)-5-(трифторметил)-4Н-изоксазол-5-карбоксилат.

^1H ЯМР (400 МГц, CHCl_3) δ 8,45 (d, 1H), 7,45 (d, 1H), 4,2 (d, 1H), 3,95 (d, 1H), 3,95 (s, 3H) ppm.

Метил-3-(2-хлор-4-фтор-5-нитрофенил)-4,5-диметил-4Н-изоксазол-5-карбоксилат.

^1H ЯМР (400 МГц, CHCl_3) δ 8,3 (d, 1H), 7,45 (d, 1H), 3,9 (q, 1H), 3,8 (s, 3H), 1,75 (s, 3H), 1,1 (d, 3H) ppm.

[3-(2-Хлор-4-фтор-5-нитрофенил)-5-метил-4Н-изоксазол-5-ил]метанол.

^1H ЯМР (400 МГц, CHCl_3) δ 8,45 (d, 1H), 7,45 (d, 1H), 3,8 (br d, 1H), 3,65 (d, 1H), 3,6 (br d, 1H), 3,2 (d, 1H), 2,1 (m, 1H), 1,5 (s, 3H) ppm.

1-[3-(2-Хлор-4-фтор-5-нитрофенил)-5-метил-4Н-изоксазол-5-ил]этанон.

^1H ЯМР (400 МГц, CHCl_3) δ 8,4 (d, 1H), 7,45 (d, 1H), 3,95 (d, 1H), 3,2 (d, 1H), 2,35 (s, 3H), 1,65 (s, 3H) ppm.

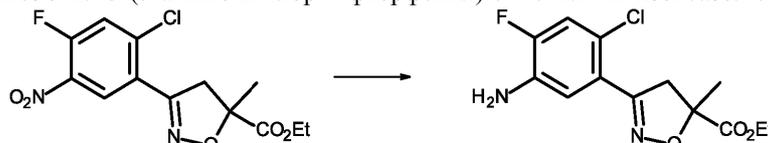
Этил-3-(2,4-дихлор-5-нитрофенил)-5-метил-4Н-изоксазол-5-карбоксилат.

^1H ЯМР (400 МГц, CHCl_3) δ 8,35 (s, 1H), 7,7 (s, 1H), 4,3 (q, 2H), 4,05 (d, 1H), 3,4 (d, 1H), 1,75 (s, 3H), 1,35 (t, 3H) ppm.

Метил-3-(2-хлор-4-фтор-5-нитрофенил)-5-метокси-4Н-изоксазол-5-карбоксилат.

^1H ЯМР (400 МГц, CHCl_3) δ 8,55 (d, 1H), 7,45 (d, 1H), 4,0 (d, 1H), 3,9 (s, 3H), 3,6 (d, 1H), 3,5 (s, 3H) ppm.

Стадия 3. Синтез этил-3-(5-амино-2-хлор-4-фторфенил)-5-метил-4Н-изоксазол-5-карбоксилата



Гидрат дихлорида олова (2,3 г, 12,1 ммоль) добавляли к перемешиваемому раствору этил-3-(2-хлор-4-фтор-5-нитрофенил)-5-метил-4Н-изоксазол-5-карбоксилата (1,0 г, 3,0 ммоль) в этилацетате (60 мл) при комнатной температуре. Через 5 мин смесь нагревали с обратным холодильником в течение 3 ч, охлаждали и выпаривали при пониженном давлении с получением коричневого масла, которое очищали с помощью хроматографии с получением этил-3-(5-амино-2-хлор-4-фторфенил)-5-метил-4Н-изоксазол-5-карбоксилата (800 мг).

^1H ЯМР (400 МГц, CHCl_3) δ 7,15 (d, 1H), 7,05 (d, 1H), 4,3 (q, 2H), 3,95 (d, 1H), 3,4 (d, 1H), 1,7 (s, 3H), 1,3 (t, 3H) ppm (NH_2 не наблюдали).

С помощью данного общего способа также были получены:

этил-3-(5-амино-2-хлорфенил)-5-метил-4Н-изоксазол-5-карбоксилат.

Метил-3-(5-амино-2-хлор-4-фторфенил)-5-(трифторметил)-4Н-изоксазол-5-карбоксилат.

^1H ЯМР (400 МГц, CHCl_3) δ 7,15 (d, 1H), 7,1 (d, 1H), 4,2 (d, 1H), 3,95 (d, 1H), 3,9 (s, 3H), 3,85 (br s, 2H) ppm.

Метил-3-(5-амино-2-хлор-4-фторфенил)-4,5-диметил-4Н-изоксазол-5-карбоксилат.

^1H ЯМР (400 МГц, CHCl_3) δ 7,15 (d, 1H), 6,9 (d, 1H), 3,9 (q, 1H), 3,85 (br s, 2H), 3,8 (s, 3H), 1,75 (s, 3H), 1,0 (d, 3H) ppm.

[3-(5-Амино-2-хлор-4-фторфенил)-5-метил-4Н-изоксазол-5-ил]метилацетат.

1-[3-(5-Амино-2-хлор-4-фторфенил)-5-метил-4Н-изоксазол-5-ил]этанон.

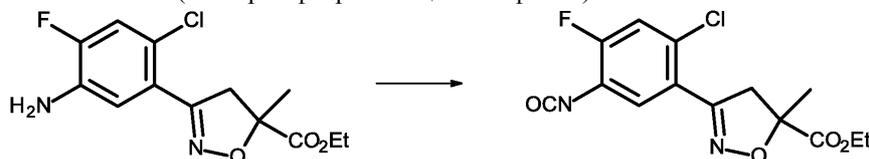
Этил-3-(5-амино-2,4-дихлорфенил)-5-метил-4Н-изоксазол-5-карбоксилат.

^1H ЯМР (400 МГц, CHCl_3) δ 7,35 (s, 1H), 7,3 (s, 1H), 4,3 (q, 2H), 4,1 (br s, 2H), 3,95 (d, 1H), 3,4 (d, 1H), 1,75 (s, 3H), 1,35 (t, 3H) ppm.

Метил-3-(5-амино-2-хлор-4-фторфенил)-5-метокси-4Н-изоксазол-5-карбоксилат.

^1H ЯМР (400 МГц, CHCl_3) δ 7,15 (d, 1H), 7,1 (d, 1H), 3,95 (d, 1H), 3,9 (s, 3H), 3,85 (br s, 2H), 3,6 (d, 1H), 3,45 (s, 3H) ppm.

Стадия 4. Синтез этил-3-(2-хлор-4-фтор-5-изоцианатофенил)-5-метил-4Н-изоксазол-5-карбоксилата



Раствор этил-3-(5-амино-2-хлор-4-фторфенил)-5-метил-4Н-изоксазол-5-карбоксилата (800 мг, 2,66

ммоль) в сухом толуоле (16 мл) добавляли к перемешиваемому дифосгену (0,4 мл, 3,2 ммоль) при комнатной температуре и смесь затем нагревали с обратным холодильником в течение 3 часов, охлаждали и выпаривали при пониженном давлении.

Добавляли толуол (10 мл) и смесь выпаривали при пониженном давлении с получением этил-3-(2-хлор-4-фтор-5-изоцианатофенил)-5-метил-4Н-изоксазол-5-карбоксилата в виде светло-коричневой жидкости (750 мг).

^1H ЯМР (400 МГц, CHCl_3) δ 7,45 (d, 1H), 7,25 (d, 1H), 4,3 (q, 2H), 3,9 (d, 1H), 3,35 (d, 1H), 1,75 (s, 3H), 1,35 (t, 3H) ppm.

С помощью данного общего способа также были получены:

этил-3-(2-хлор-5-изоцианатофенил)-5-метил-4Н-изоксазол-5-карбоксилат.

Метил-3-(2-хлор-4-фтор-5-изоцианатофенил)-5-(трифторметил)-4Н-изоксазол-5-карбоксилат.

^1H ЯМР (400 МГц, CHCl_3) δ 7,45 (d, 1H), 7,3 (d, 1H), 4,15 (d, 1H), 3,95 (d, 1H), 3,95 (s, 3H) ppm.

Метил-3-(2-хлор-4-фтор-5-изоцианатофенил)-4,5-диметил-4Н-изоксазол-5-карбоксилат.

1-[3-(2-Хлор-4-фтор-5-изоцианатофенил)-5-метил-4Н-изоксазол-5-ил]метилацетат.

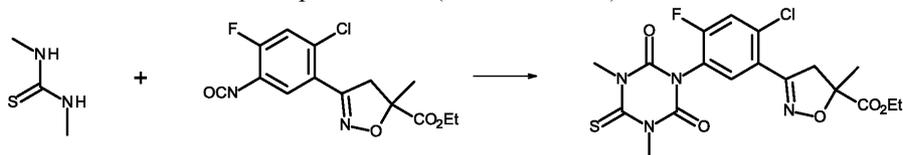
1-[3-(2-Хлор-4-фтор-5-изоцианатофенил)-5-метил-4Н-изоксазол-5-ил]этанон.

Этил-3-(2,4-дихлор-5-изоцианатофенил)-5-метил-4Н-изоксазол-5-карбоксилат.

Метил-3-(2-хлор-4-фтор-5-изоцианатофенил)-5-метокси-4Н-изоксазол-5-карбоксилат.

^1H ЯМР (400 МГц, CHCl_3) δ 7,5 (d, 1H), 7,25 (d, 1H), 3,95 (d, 1H), 3,9 (s, 3H), 3,6 (d, 1H), 3,5 (s, 3H) ppm.

Стадия 5. Получение этил-3-[2-хлор-5-(3,5-диметил-2,6-диоксо-4-тиоксо-1,3,5-триазиан-1-ил)-4-фторфенил]-5-метил-4Н-изоксазол-5-карбоксилата (соединения 47)



Раствор 1,3-диметилтиомочевины (0,31 г, 2,94 ммоль) и триэтиламина (0,45 мл, 3,82 ммоль) в толуоле добавляли к перемешиваемому раствору этил-3-(2-хлор-4-фтор-5-изоцианатофенил)-5-метил-4Н-изоксазол-5-карбоксилата (800 мг, 2,45 ммоль) в толуоле (16 мл) при комнатной температуре. Полученную смесь нагревали до температуры образования флегмы и добавляли порциями карбонилдиимдазол (0,62 г, 3,67 ммоль) в течение 15 мин. Смесь нагревали с обратным холодильником в течение 3,5 ч, охлаждали и выпаривали при пониженном давлении с получением коричневого масла, которое очищали с помощью хроматографии с получением этил-3-[2-хлор-5-(3,5-диметил-2,6-диоксо-4-тиоксо-1,3,5-триазиан-1-ил)-4-фторфенил]-5-метил-4Н-изоксазол-5-карбоксилата (соединения 47) (775 мг).

^1H ЯМР (400 МГц, CHCl_3) δ 7,75 (d, 1H), 7,35 (d, 1H), 4,25 (q, 2H), 4,0 (d, 1H), 3,75 (s, 6H), 3,4 (d, 1H), 1,7 (s, 3H), 1,3 (t, 3H) ppm.

Отдельные энантиомеры соединения 47 получали с помощью хиральной хроматографии (^1H ЯМР как указано выше).

С помощью данного общего способа также были получены:

этил-3-[2-хлор-5-(3,5-диметил-2,6-диоксо-4-тиоксо-1,3,5-триазиан-1-ил)фенил]-5-метил-4Н-изоксазол-5-карбоксилат (соединение 36).

^1H ЯМР (400 МГц, CHCl_3) δ 7,7 (d, 1H), 7,55 (d, 1H), 7,25 (m, 1H), 4,25 (q, 2H), 4,0 (d, 1H), 3,75 (s, 6H), 3,4 (d, 1H), 1,7 (s, 3H), 1,3 (t, 3H) ppm.

Метил-3-[2-хлор-5-(3,5-диметил-2,6-диоксо-4-тиоксо-1,3,5-триазиан-1-ил)-4-фторфенил]-5-трифторметил-4Н-изоксазол-5-карбоксилат (соединение 262).

^1H ЯМР (400 МГц, CHCl_3) δ 7,8 (d, 1H), 7,45 (d, 1H), 4,2 (d, 1H), 4,0 (d, 1H), 3,95 (s, 3H), 3,8 (s, 6H), ppm.

Метил-3-[2-хлор-5-(3,5-диметил-2,6-диоксо-4-тиоксо-1,3,5-триазиан-1-ил)-4-фторфенил]-4,5-диметил-4Н-изоксазол-5-карбоксилат (соединение 145).

^1H ЯМР (400 МГц, CHCl_3) δ 7,5 (d, 1H), 7,4 (d, 1H), 3,95 (q, 1H), 3,8 (s, 3H), 3,75 (s, 6H), 1,75 (s, 3H), 1,1 (d, 3H) ppm.

[3-[2-Хлор-5-(3,5-диметил-2,6-диоксо-4-тиоксо-1,3,5-триазиан-1-ил)-4-фторфенил]-5-метил-4Н-изоксазол-5-ил]метилацетат (соединение 51).

^1H ЯМР (400 МГц, CHCl_3) δ 7,75 (d, 1H), 7,35 (d, 1H), 4,2 (q, 2H), 3,75 (s, 6H), 3,5 (d, 1H), 3,25 (d, 1H), 2,1 (s, 3H), 1,5 (s, 3H) ppm.

3-[5-(5-Ацетил-5-метил-4Н-изоксазол-3-ил)-4-хлор-2-фторфенил]-1,5-диметил-6-тиоксо-1,3,5-триазиан-2,4-дион (соединение 290).

^1H ЯМР (400 МГц, CHCl_3) δ 7,7 (d, 1H), 7,4 (d, 1H), 3,95 (d, 1H), 3,75 (s, 6H), 3,2 (d, 1H), 2,35 (s, 3H), 1,55 (s, 3H) ppm.

Этил-3-[2,4-дихлор-5-(3,5-диметил-2,6-диоксо-4-тиоксо-1,3,5-триазиан-1-ил)фенил]-5-метил-4Н-изоксазол-5-карбоксилат (соединение 58).

^1H ЯМР (400 МГц, CHCl_3) δ 7,8 (s, 1H), 7,65 (s, 1H), 4,4 (q, 2H), 4,0 (d, 1H), 3,75 (s, 6H), 3,4 (d, 1H), 1,7 (s, 3H), 1,3 (t, 3H) ppm.

Метил-3-[2-хлор-5-(3,5-диметил-2,6-диоксо-4-тиоксо-1,3,5-триазиан-1-ил)-4-фторфенил]-5-метокси-4Н-изоксазол-5-карбоксилат (соединение 311).

^1H ЯМР (400 МГц, CHCl_3) δ 7,8 (d, 1H), 7,4 (d, 1H), 3,95 (d, 1H), 3,9 (s, 3H), 3,8 (s, 6H), 3,6 (d, 1H), 3,45 (s, 3H) ppm.

Пример 2. Получение 3-[2-хлор-5-(3,5-диметил-2,6-диоксо-4-тиоксо-1,3,5-триазиан-1-ил)-4-фторфенил]-5-метил-4Н-изоксазол-5-карбоновой кислоты (соединения 45).

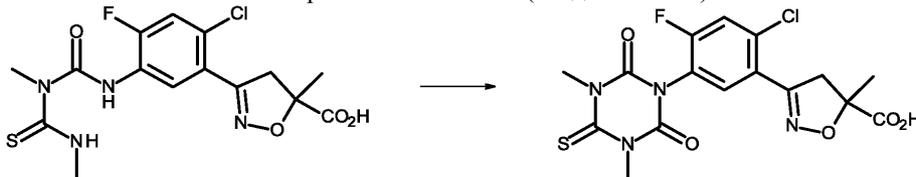
Стадия 1. Получение 3-[2-хлор-4-фтор-5-[[метил(метилкарбамотиоил)карбамоил]амино]фенил]-5-метил-4Н-изоксазол-5-карбоновой кислоты



Водный раствор гидроксида натрия (2 н.; 0,87 мл, 1,75 ммоль) добавляли к перемешиваемой суспензии этил-3-[2-хлор-5-(3,5-диметил-2,6-диоксо-4-тиоксо-1,3,5-триазиан-1-ил)-4-фторфенил]-5-метил-4Н-изоксазол-5-карбоксилата (400 мг, 0,87 ммоль) в этаноле (5 мл) при комнатной температуре. Полученную смесь перемешивали в течение 30 мин, добавляли воду (5 мл) с последующим добавлением разбавленной водной хлористоводородной кислоты (2 мл). Смесь фильтровали и твердое вещество высушивали с получением 3-[2-хлор-4-фтор-5-[[метил(метилкарбамотиоил)карбамоил]амино]фенил]-5-метил-4Н-изоксазол-5-карбоновой кислоты в виде белого твердого вещества (260 мг).

^1H ЯМР (400 МГц, DMSO) δ 13,3 (br s, 1H), 10,15 (s, 2H), 7,95 (d, 1H), 7,7 (d, 1H), 3,85 (d, 1H), 3,55 (s, 3H), 3,4 (d, 1H), 3,0 (s, 3H), 1,6 (s, 3H) ppm.

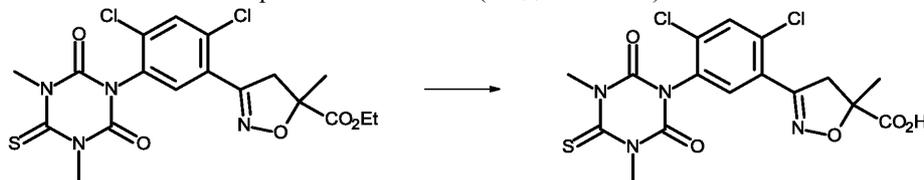
Стадия 2. Получение 3-[2-хлор-5-(3,5-диметил-2,6-диоксо-4-тиоксо-1,3,5-триазиан-1-ил)-4-фторфенил]-5-метил-4Н-изоксазол-5-карбоновой кислоты (соединение 45)



Триэтиламин (0,068 мл, 0,48 ммоль), затем карбонилдиимидазол (93 мг, 0,56 ммоль) добавляли к перемешиваемому раствору 3-[2-хлор-4-фтор-5-[[метил(метилкарбамотиоил)карбамоил]амино]фенил]-5-метил-4Н-изоксазол-5-карбоновой кислоты (150 мг, 0,37 ммоль) в толуоле (3 мл) при комнатной температуре. Затем смесь нагревали с обратным холодильником в течение 3 часов, охлаждали и выпаривали при пониженном давлении с получением остатка, который очищали с помощью хроматографии с получением 3-[2-хлор-5-(3,5-диметил-2,6-диоксо-4-тиоксо-1,3,5-триазиан-1-ил)-4-фторфенил]-5-метил-4Н-изоксазол-5-карбоновой кислоты (соединения 45) в виде белого твердого вещества (35 мг).

^1H ЯМР (400 МГц, CHCl_3) δ 7,7 (d, 1H), 7,3 (d, 1H), 5,2 (br s, 1H), 3,75 (d, 1H), 3,7 (s, 6H), 3,2 (d, 1H), 1,5 (s, 3H) ppm.

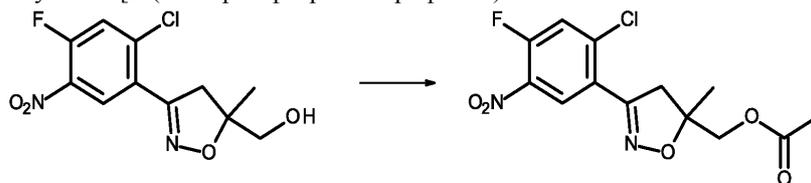
Пример 3. Получение 3-[2,4-дихлор-5-(3,5-диметил-2,6-диоксо-4-тиоксо-1,3,5-триазиан-1-ил)-фенил]-5-метил-4Н-изоксазол-5-карбоновой кислоты (соединения 56)



Концентрированную серную кислоту (0,75 мл, 13 ммоль) добавляли к перемешиваемому раствору этил-3-[2,4-дихлор-5-(3,5-диметил-2,6-диоксо-4-тиоксо-1,3,5-триазиан-1-ил)фенил]-5-метил-4Н-изоксазол-5-карбоксилата (полученного как описано в примере 1, стадия 5; 300 мг, 0,63 ммоль) в ледяной уксусной кислоте (3 мл) и полученную смесь нагревали при 100°C в течение 1 ч. Смесь охлаждали до температуры окружающей среды, выливали в воду и полученную смесь экстрагировали с помощью дихлорметана. Органический экстракт высушивали над сульфатом магния, фильтровали и выпаривали при пониженном давлении с получением остатка, который очищали с помощью хроматографии с получением 3-[2,4-дихлор-5-(3,5-диметил-2,6-диоксо-4-тиоксо-1,3,5-триазиан-1-ил)-фенил]-5-метил-4Н-изоксазол-5-карбоновой кислоты (соединения 56) в виде масла (200 мг).

^1H ЯМР (400 МГц, CHCl_3) δ 7,75 (s, 1H), 7,65 (s, 1H), 5,75 (br s, 1H), 4,0 (d, 1H), 3,75 (s, 6H), 3,4 (d, 1H), 1,7 (s, 3H) ppm.

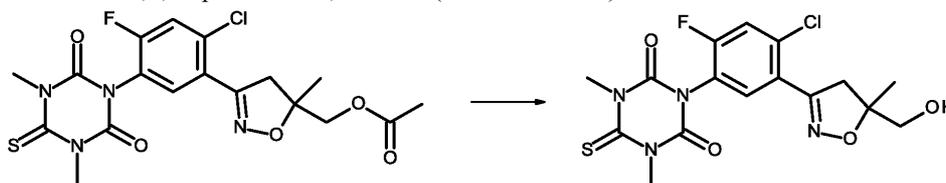
Пример 4. Получение [3-(2-хлор-4-фтор-5-нитрофенил)-5-метил-4Н-изоксазол-5-ил]метилацетата



Смесь [3-(2-хлор-4-фтор-5-нитрофенил)-5-метил-4Н-изоксазол-5-ил]метанола (полученного как описано в примере 1, стадия 2; 150 мг, 0,52 ммоль) и уксусного ангидрида (60 мг, 0,57 ммоль) нагревали при 90°C в течение 2 ч, затем обеспечивали охлаждение и выпаривали при пониженном давлении с получением [3-(2-хлор-4-фтор-5-нитрофенил)-5-метил-4Н-изоксазол-5-ил]метилацетата в виде масла (160 мг).

¹H ЯМР (400 МГц, CHCl₃) δ 8,45 (d, 1H), 7,45 (d, 1H), 4,3 (d, 1H), 4,15 (d, 1H), 3,5 (d, 1H), 3,25 (d, 1H), 2,1 (s, 3H), 1,5 (s, 3H) ppm.

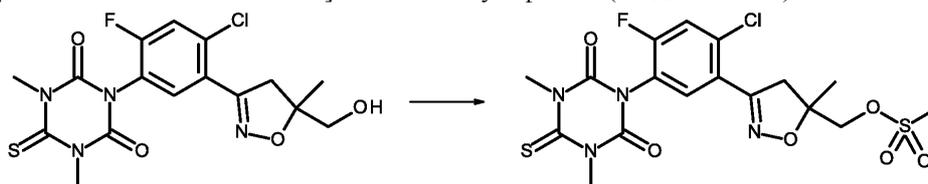
Пример 5. Получение 3-[4-хлор-2-фтор-5-[5-(гидроксиметил)-5-метил-4Н-изоксазол-3-ил]фенил]-1,5-диметил-6-тиоксо-1,3,5-триазинан-2,4-диона (соединения 49)



Насыщенный водный раствор гидрокарбоната натрия (76 мг, 0,89 ммоль) добавляли к перемешиваемому раствору [3-[2-хлор-5-(3,5-диметил-2,6-диоксо-4-тиоксо-1,3,5-триазинан-1-ил)-4-фторфенил]-5-метил-4Н-изоксазол-5-ил]метилацетата (полученного как описано в примере 1, стадия 5; 250 мг, 0,55 ммоль) в метаноле (25 мл). Смесь перемешивали при комнатной температуре в течение 17 ч, концентрировали при пониженном давлении и экстрагировали дихлорметаном. Органические экстракты высушивали и выпаривали при пониженном давлении с получением остатка, который очищали с помощью хроматографии с получением 3-[4-хлор-2-фтор-5-[5-(гидроксиметил)-5-метил-4Н-изоксазол-3-ил]фенил]-1,5-диметил-6-тиоксо-1,3,5-триазинан-2,4-диона (соединения 49) в виде стеклообразного твердого вещества (138 мг).

¹H ЯМР (400 МГц, CHCl₃) δ 7,75 (d, 1H), 7,55 (d, 1H), 3,75 (s, 6H), 3,65 (d, 1H), 3,55 (d, 1H), 3,3 (d, 1H), 3,2 (d, 1H), 1,45 (s, 3H) ppm (ОН не наблюдали).

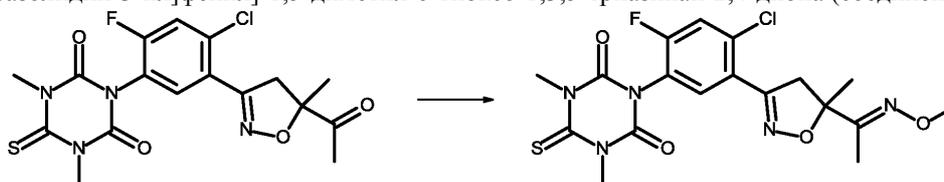
Пример 6. Получение [3-[2-хлор-5-(3,5-диметил-2,6-диоксо-4-тиоксо-1,3,5-триазинан-1-ил)-4-фторфенил]-5-метил-4Н-изоксазол-5-ил]метилметансульфоната (соединения 53)



Метансульфонилхлорид (0,1 мл, 1,0 ммоль) добавляли к перемешиваемому раствору 3-[4-хлор-2-фтор-5-[5-(гидроксиметил)-5-метил-4Н-изоксазол-3-ил]фенил]-1,5-диметил-6-тиоксо-1,3,5-триазинан-2,4-диона (полученного как описано в примере 5; 38 мг, 0,077 ммоль) в толуоле (3 мл). Полученный раствор перемешивали при комнатной температуре в течение 2 часов, выпаривали при пониженном давлении и остаток экстрагировали с помощью дихлорметана. Экстракты высушивали и выпаривали при пониженном давлении с получением остатка, который очищали с помощью хроматографии с получением [3-[2-хлор-5-(3,5-диметил-2,6-диоксо-4-тиоксо-1,3,5-триазинан-1-ил)-4-фторфенил]-5-метил-4Н-изоксазол-5-ил]метилметансульфоната (соединения 53) в виде смолы (40 мг).

¹H ЯМР (400 МГц, CHCl₃) δ 7,7 (d, 1H), 7,35 (d, 1H), 4,3 (q, 2H), 3,75 (s, 6H), 3,65 (d, 1H), 3,25 (d, 1H), 3,1 (s, 3H), 1,4 (s, 3H) ppm.

Пример 7. Получение 3-[4-хлор-2-фтор-5-[5-[N-метокси-С-метилкарбонимидоил]-5-метилизоксазолидин-3-ил]фенил]-1,5-диметил-6-тиоксо-1,3,5-триазинан-2,4-диона (соединения 293)



Гидрохлорид О-метилгидроксиламина (12 мг, 0,14 ммоль) добавляли к перемешиваемому раствору 3-[5-(5-ацетил-5-метил-4Н-изоксазол-3-ил)-4-хлор-2-фторфенил]-1,5-диметил-6-тиоксо-1,3,5-триазинан-

2,4-диона (полученного как описано в примере 1, стадия 5; 51 мг, 0,12 ммоль) в этаноле (2,5 мл) и дихлорметане (2 мл). Полученный раствор перемешивали при комнатной температуре в течение 17 ч, выпаривали при пониженном давлении и остаток разделяли между дихлорметаном и водой. Фазы разделяли и органическую фазу высушивали и выпаривали при пониженном давлении с получением остатка, который очищали с помощью хроматографии с получением 3-[4-хлор-2-фтор-5-[5-[N-метокси-С-метилкарбонимидоил]-5-метилизоксазолидин-3-ил]фенил]-1,5-диметил-6-тиоксо-1,3,5-триазиан-2,4-диона (соединения 293) в виде рыхлого твердого вещества (52 мг).

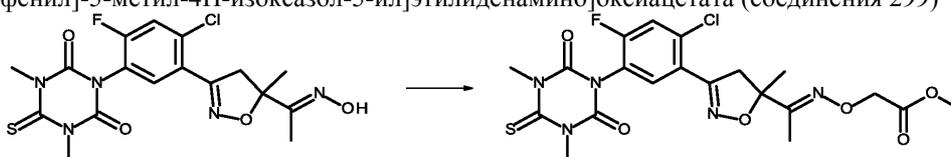
^1H ЯМР (400 МГц, CHCl_3) δ 7,7 (d, 1H), 7,35 (d, 1H), 4,1 (d, 1H), 3,85 (s, 3H), 3,8 (s, 6H), 3,2 (d, 1H), 1,95 (s, 3H), 1,6 (s, 3H) ppm.

С помощью данного общего способа также был получен:

3-[4-хлор-2-фтор-5-[5-[N-гидрокси-С-метилкарбонимидоил]-5-метилизоксазолидин-3-ил]фенил]-1,5-диметил-6-тиоксо-1,3,5-триазиан-2,4-дион (соединение 296).

^1H ЯМР (400 МГц, CHCl_3) δ 7,7 (d, 1H), 7,35 (d, 1H), 5,7 (br s, 1H), 3,9 (d, 1H), 3,75 (s, 6H), 3,3 (d, 1H), 2,0 (s, 3H), 1,65 (s, 3H) ppm.

Пример 8. Получение метил-2-[1-[3-[2-хлор-5-(3,5-диметил-2,6-диоксо-4-тиоксо-1,3,5-триазиан-1-ил)-4-фторфенил]-5-метил-4Н-изоксазол-5-ил]этилиденамино]оксиацетата (соединения 299)

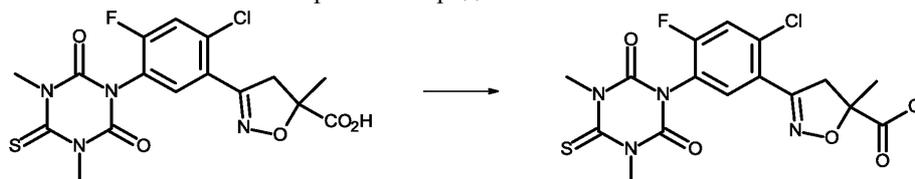


Метилбромацетат (0,01 мл, 0,1 ммоль), затем карбонат калия (12,5 мг, 0,09 ммоль) и йодид калия (каталитическое количество) добавляли к раствору 3-[4-хлор-2-фтор-5-[5-[N-гидрокси-С-метилкарбонимидоил]-5-метилизоксазолидин-3-ил]фенил]-1,5-диметил-6-тиоксо-1,3,5-триазиан-2,4-диона (полученного как описано в примере 7; 40 мг, 0,09 ммоль) в 4-метилпентан-2-оне (2 мл). Полученную смесь нагревали в микроволновой печи в течение 1 ч при 100°C, обеспечивали охлаждение и растворитель выпаривали при пониженном давлении с получением твердого вещества, которое очищали с помощью хроматографии с получением метил-2-[1-[3-[2-хлор-5-(3,5-диметил-2,6-диоксо-4-тиоксо-1,3,5-триазиан-1-ил)-4-фторфенил]-5-метил-4Н-изоксазол-5-ил]этилиденамино]оксиацетата (соединения 299) в виде смолы (20 мг).

^1H ЯМР (400 МГц, CHCl_3) δ 7,7 (d, 1H), 7,35 (d, 1H), 4,6 (s, 2H), 4,0 (d, 1H), 3,8 (s, 6H), 3,7 (s, 3H), 3,2 (d, 1H), 2,0 (s, 3H), 1,6 (s, 3H) ppm.

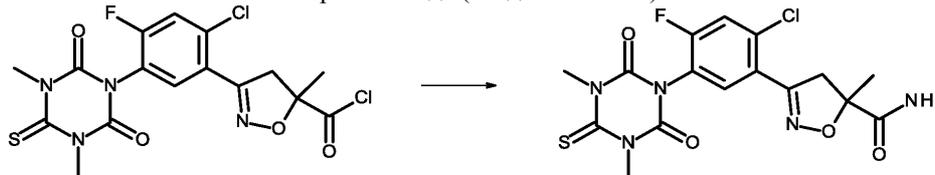
Пример 9. Получение 3-[2-хлор-5-(3,5-диметил-2,6-диоксо-4-тиоксо-1,3,5-триазиан-1-ил)-4-фторфенил]-5-метил-4Н-изоксазол-5-карбоксамид (соединения 308).

Стадия 1. Получение 3-[2-хлор-5-(3,5-диметил-2,6-диоксо-4-тиоксо-1,3,5-триазиан-1-ил)-4-фторфенил]-5-метил-4Н-изоксазол-5-карбонилхлорида



Оксалилхлорид (0,01 мл, 0,11 ммоль), затем диметилформамид (каплю) добавляли к перемешиваемому раствору 3-[2-хлор-5-(3,5-диметил-2,6-диоксо-4-тиоксо-1,3,5-триазиан-1-ил)-4-фторфенил]-5-метил-4Н-изоксазол-5-карбоновой кислоты (полученной как описано в примере 3; 42 мг, 0,10 ммоль) в дихлорметане (2 мл) при 0°C. Полученный раствор перемешивали в течение 5 мин, затем обеспечивали нагревание до температуры окружающей среды и непосредственно использовали.

Стадия 2. Получение 3-[2-хлор-5-(3,5-диметил-2,6-диоксо-4-тиоксо-1,3,5-триазиан-1-ил)-4-фторфенил]-5-метил-4Н-изоксазол-5-карбоксамид (соединения 308)



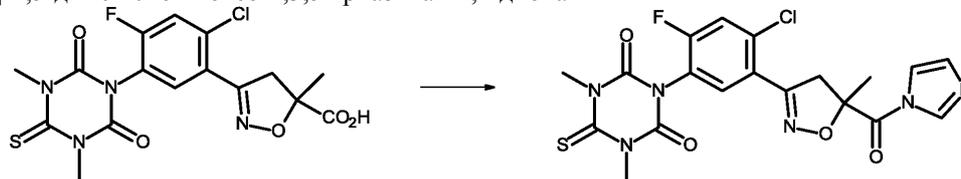
Концентрированный водный аммиак (0,5 мл, 30 ммоль) добавляли к перемешиваемому раствору 3-[2-хлор-5-(3,5-диметил-2,6-диоксо-4-тиоксо-1,3,5-триазиан-1-ил)-4-фторфенил]-5-метил-4Н-изоксазол-5-карбонилхлорида в дихлорметане (2 мл) при 0°C. Полученный раствор перемешивали в течение 30 мин, затем выпаривали при пониженном давлении с получением белого твердого вещества, которое растирали с водой с получением 3-[2-хлор-5-(3,5-диметил-2,6-диоксо-4-тиоксо-1,3,5-триазиан-1-ил)-4-фторфенил]-5-метил-4Н-изоксазол-5-карбоксамид (соединения 308) в виде белого твердого вещества

(35 мг).

^1H ЯМР (400 МГц, d_6 -DMSO) δ 7,9 (m, 2H), 7,6 (br s, 1H), 7,4 (br s, 1H), 3,8 (d, 1H), 3,65 (s, 6H), 1,6 (s, 3H) ppm (1 CH не наблюдали из-за подавления сигнала воды).

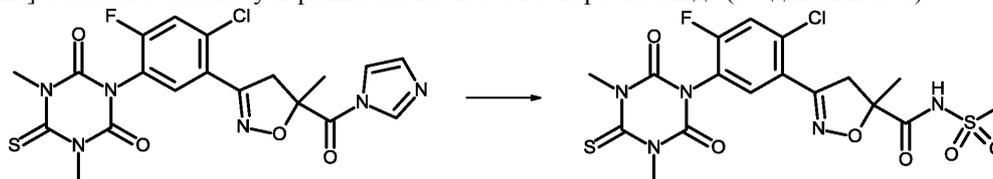
Пример 10. Получение 3-[2-хлор-5-(3,5-диметил-2,6-диоксо-4-тиоксо-1,3,5-триазинан-1-ил)-4-фторфенил]-5-метил-N-метилсульфонил-4Н-изоксазол-5-карбоксамид (соединения 284).

Стадия 1. Получение 3-[4-хлор-2-фтор-5-[5-(имидазол-1-карбонил)-5-метил-4Н-изоксазол-3-ил]фенил]-1,5-диметил-6-тиоксо-1,3,5-триазинан-2,4-диона



Карбонилимидазол (234 мг, 1,4 ммоль) добавляли к перемешиваемому раствору 3-[2-хлор-5-(3,5-диметил-2,6-диоксо-4-тиоксо-1,3,5-триазинан-1-ил)-4-фторфенил]-5-метил-4Н-изоксазол-5-карбоновой кислоты (полученной как описано в примере 3; 400 мг, 0,93 ммоль) и триэтиламина (0,17 мл, 0,93 ммоль) в дихлорметане (5 мл) при температуре окружающей среды. Полученный раствор перемешивали в течение 45 минут, затем растворитель выпаривали при пониженном давлении с получением 3-[4-хлор-2-фтор-5-[5-(имидазол-1-карбонил)-5-метил-4Н-изоксазол-3-ил]фенил]-1,5-диметил-6-тиоксо-1,3,5-триазинан-2,4-диона, который непосредственно использовали.

Стадия 2. Получение 3-[2-хлор-5-(3,5-диметил-2,6-диоксо-4-тиоксо-1,3,5-триазинан-1-ил)-4-фторфенил]-5-метил-N-метилсульфонил-4Н-изоксазол-5-карбоксамид (соединения 284)



DBU (0,13 мл, 0,84 ммоль) добавляли к перемешиваемому раствору 3-[4-хлор-2-фтор-5-[5-(имидазол-1-карбонил)-5-метил-4Н-изоксазол-3-ил]фенил]-1,5-диметил-6-тиоксо-1,3,5-триазинан-2,4-диона (200 мг, 0,42 ммоль) и метансульфонамида (82 мг, 0,84 ммоль) в дихлорметане (5 мл) при температуре окружающей среды. Полученный раствор перемешивали в течение 40 ч, затем выпаривали при пониженном давлении с получением желтого масла, которое очищали с помощью хроматографии с получением 3-[2-хлор-5-(3,5-диметил-2,6-диоксо-4-тиоксо-1,3,5-триазинан-1-ил)-4-фторфенил]-5-метил-N-метилсульфонил-4Н-изоксазол-5-карбоксамид (соединения 284) в виде белого твердого вещества (52 мг).

^1H ЯМР (400 МГц, CHCl_3) δ 9,1 (br s, 1H), 7,7 (d, 1H), 7,4 (d, 1H), 4,0 (d, 1H), 3,75 (s, 6H), 3,45 (d, 1H), 3,3 (s, 3H), 1,75 (s, 3H) ppm.

С помощью данного общего способа также был получен:

3-[2-хлор-5-(3,5-диметил-2,6-диоксо-4-тиоксо-1,3,5-триазинан-1-ил)-4-фторфенил]-N-диметилсульфамид-5-метил-4Н-изоксазол-5-карбоксамид (соединения 305).

^1H ЯМР (400 МГц, CHCl_3) δ 8,95 (br s, 1H), 7,7 (d, 1H), 7,4 (d, 1H), 4,0 (d, 1H), 3,75 (s, 6H), 3,45 (d, 1H), 2,95 (s, 6H), 1,75 (s, 3H) ppm.

Примеры составов

Смачиваемые порошки	a)	b)	c)
Активные ингредиенты	25 %	50 %	75 %
Лигносульфат натрия	5 %	5 %	-
Лаурилсульфат натрия	3 %	-	5 %
Диизобутилнафталинсульфонат натрия	-	6 %	10 %
Феноловый эфир полиэтиленгликоля (7-8 моль этиленоксида)	-	2 %	-
Высокодисперсная кремниевая кислота	5 %	10 %	10 %
Каолин	62 %	27 %	-

Комбинацию тщательно смешивают со вспомогательными веществами и смесь тщательно измельчают в подходящей мельнице с получением смачиваемых порошков, которые можно разбавлять водой с получением суспензии с необходимой концентрацией.

Эмульгируемый концентрат.

Активные ингредиенты	10 %
Октилфеноловый эфир полиэтиленгликоля (4-5 моль этиленоксида)	3 %
Додецилбензолсульфонат кальция	3 %
Полигликолевый эфир касторового масла (35 моль этиленоксида)	4 %
Циклогексанон	30 %
Смесь ксилолов	50 %

Из этого концентрата путем разбавления водой можно получить эмульсии любого необходимого разбавления, которые можно применять для защиты растений.

Пылевидные препараты	a)	b)	c)
Активные ингредиенты	5 %	6 %	4 %
Тальк	95 %	-	-
Каолин	-	94 %	-
Минеральный наполнитель	-	-	96 %

Готовые к применению пылевидные препараты получают путем смешивания комбинации с носителем и измельчения смеси в подходящей мельнице.

Экструдированные гранулы.

Активные ингредиенты	15 %
Лигносulfонат натрия	2 %
Карбоксиметилцеллюлоза	1 %
Каолин	82 %

Комбинацию смешивают и измельчают со вспомогательными веществами и смесь увлажняют водой. Смесь экструдировать и затем высушивают в потоке воздуха.

Покрытые оболочкой гранулы.

Активные ингредиенты	8 %
Полиэтиленгликоль (молекулярная масса 200)	3 %
Каолин	89 %

Тонкоизмельченную комбинацию в перемешивающем устройстве равномерно наносят на увлажненный полиэтиленгликолем каолин. Таким способом получают непылевидные покрытые оболочкой гранулы.

Суспензионный концентрат.

Активные ингредиенты	40 %
Пропиленгликоль	10 %
Полиэтиленгликолевый эфир нонилфенола (15 моль этиленоксида)	6 %
Лигносulfонат натрия	10 %
Карбоксиметилцеллюлоза	1 %
Силиконовое масло (в виде 75% эмульсии в воде)	1 %
Вода	32 %

Тонкоизмельченную комбинацию тщательно смешивают со вспомогательными веществами с получением суспензионного концентрата, из которого путем разбавления водой можно получать суспензии любого требуемого разбавления.

Капсульная суспензия медленного высвобождения.

Смешивают 28 частей комбинации с 2 частями ароматического растворителя и 7 частями смеси толуолдиизоцианат/полиметилениполифенил-изоцианат (8:1). Эту смесь эмульгируют в смеси 1,2 части поливинилового спирта, 0,05 части пеногасителя и 51,6 части воды до получения частиц необходимого размера. К этой эмульсии добавляют смесь 2,8 части 1,6-диаминогексана в 5,3 части воды. Смесь перемешивают до завершения реакции полимеризации.

Полученную капсульную суспензию стабилизируют путем добавления 0,25 части загустителя и 3 частей диспергирующего средства. Состав капсульной суспензии содержит 28% активных ингредиентов. Средний диаметр капсул составляет 8-15 мкм.

Полученный состав применяют в виде водной суспензии в отношении семян в устройстве, подхо-

данием для этой цели.

Биологические примеры.

Биологическая эффективность до появления всходов.

Семена сорняков и/или сельскохозяйственных высевали в стандартную почву в горшках. После культивирования в течение одного дня при контролируемых условиях в теплице (при 24/16°C, день/ночь; 14-часовой световой период; 65% влажность) растения опрыскивали водным раствором для опрыскивания, полученным из состава технического активного ингредиента в растворе ацетон/вода (50:50), содержащем 0,5% Tween 20 (полиоксиэтиленсорбитанмонолаурат, CAS RN 9005-64-5), с получением необходимой конечной дозы тестируемого соединения.

Затем тестируемые растения выращивали при контролируемых условиях в теплице (при 24/16°C, день/ночь; 14 часов светового периода; 65% влажность) и поливали дважды в сутки. Через 13 дней проводили оценку результатов тестирования (100=повреждение всего растения; 0=отсутствие повреждения у растения). Результаты показаны в табл. 2 ниже.

Таблица 2

Соединение	Норма применения (г/га)	Виды					
		АМАРА	LOLPE	ЕРННЛ	SETFA	ЕСНСГ	ІРОНЕ
36	250	70	10	70	90	90	40
45	250	100	100	100	100	100	100
47	250	100	70	100	100	100	100
47 (энантиомер А)	250	100	50	100	100	60	90
47 (энантиомер В)	250	100	40	100	100	50	80
49	250	100	90	100	100	90	90
51	250	100	90	100	100	90	80
53	250	100	70	-	100	60	0
56	250	90	10	10	10	0	30
58	250	90	0	0	0	0	60
145	250	100	90	100	100	90	100
262	250	-	30	0	50	30	0
284	250	100	40	100	70	30	100
290	250	100	90	100	100	90	100
293	250	100	90	100	100	90	50
296	250	100	80	90	100	80	90
299	250	100	60	90	60	0	80
305	250	100	30	60	90	30	80
308	250	100	60	80	90	10	50
311	250	100	10	50	90	10	70

Биологическая эффективность после появления всходов.

Семена сорняков и/или сельскохозяйственных высевали в стандартную почву в горшках. После культивирования в течение 8 дней при контролируемых условиях в теплице (при 24/16°C, день/ночь; 14-часовой световой период; 65% влажность) растения опрыскивали водным раствором для опрыскивания, полученным из состава технического активного ингредиента в растворе ацетон/вода (50:50), содержащем 0,5% Tween 20 (полиоксиэтиленсорбитанмонолаурат, CAS RN 9005-64-5), с получением необходимой конечной дозы тестируемого соединения.

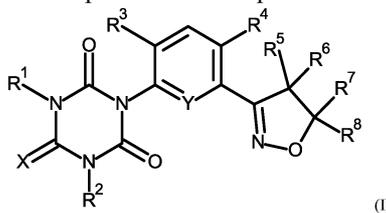
Затем тестируемые растения выращивали при контролируемых условиях в теплице (при 24/16°C, день/ночь; 14 ч светового периода; 65% влажность) и поливали дважды в сутки. Через 13 дней проводили оценку результатов тестирования (100=повреждение всего растения; 0=отсутствие повреждения у растения). Результаты показаны в табл. 3 ниже.

Таблица 3

Соединение	Норма применения (г/га)	Виды								
		АМАР А	СНЕА L	ЕРНН L	ІРОН E	ЕЛЕІ N	LOLP E	DIGS A	SETF A	ЕНСС G
36	250	100	90	90	70	50	50	100	100	100
45	250	100	100	100	100	100	100	100	100	100
47	250	100	100	100	100	100	100	100	100	100
47 (энантиомер А)	250	100	100	90	100	90	70	100	100	100
47 (энантиомер В)	250	100	100	100	100	100	100	100	100	100
49	250	100	100	100	100	90	60	90	100	70
51	250	100	100	100	90	80	50	100	100	30
53	250	90	90	90	80	80	40	70	40	30
56	250	100	90	80	90	80	30	80	90	90
58	250	90	90	70	100	90	30	80	90	90
145	250	100	100	100	100	100	100	100	100	100
262	250	40	30	60	50	40	0	50	30	20
284	250	100	100	90	100	100	80	100	100	100
290	250	100	100	100	100	100	90	100	90	90
293	250	100	100	100	100	90	60	100	90	30
296	250	100	100	80	90	90	70	70	80	30
299	250	100	100	90	90	90	90	80	100	100
305	250	100	100	100	100	100	100	100	100	100
308	250	100	100	90	100	100	90	100	100	100
311	250	90	90	90	90	90	50	80	100	90

ФОРМУЛА ИЗОБРЕТЕНИЯ

1. Соединение формулы (I) или его агрономически приемлемая соль



где X выбран из группы, состоящей из кислорода и серы;

Y представляет собой C-H;

R¹ выбран из группы, состоящей из водорода и C₁-C₆-алкила;

R² выбран из группы, состоящей из водорода, amino, C₁-C₆-алкила, C₃-C₆-алкенила и C₃-C₆-алкинила;

R³ выбран из группы, состоящей из водорода, галогена, C₁-C₄-алкила, C₁-C₄-галогеналкила, C₁-C₄-алкокси, C₁-C₄-галогеналкокси и C₁-C₄-алкилсульфонила;

R⁴ выбран из группы, состоящей из водорода, галогена, циано, аминокарбонила, аминотиокарбонила, C₁-C₄-алкила, C₁-C₄-галогеналкила, C₁-C₄-алкокси, C₁-C₄-галогеналкокси и C₁-C₄-алкилсульфонила;

каждый из R⁵ и R⁶ независимо выбран из группы, состоящей из водорода, циано, C₁-C₆-алкила, C₁-C₆-галогеналкила, C₁-C₄-алкилсульфонила, CO₂R⁹, CONR¹⁰R¹¹ и CH₂OR¹²;

каждый из R⁷ и R⁸ независимо выбран из группы, состоящей из водорода, циано, C₁-C₆-алкила, C₁-C₆-галогеналкила, C₁-C₄-алкокси, C₁-C₄-алкилсульфонила, C(=Z)R¹⁵, CO₂R⁹, CONR¹⁰R¹¹ и CH₂OR¹²;

Z выбран из группы, состоящей из кислорода, NOR¹⁶ и NN(R¹⁶)₂;

R⁹ выбран из группы, состоящей из водорода, C₁-C₁₀-алкила, C₁-C₁₀-галогеналкила, C₃-C₆-алкенила, C₃-C₆-галогеналкенила, C₃-C₆-алкинила, C₁-C₄-алкоксиC₁-C₆-алкила, C₁-C₄-галогеналкоксиC₁-C₆-алкила, C₆-C₁₀-арилC₁-C₃-алкила, C₆-C₁₀-арилC₁-C₃-алкила, замещенного 1-4 группами R¹³, гетероарилC₁-C₃-алкила и гетероарилC₁-C₃-алкила, замещенного 1-3 группами R¹³, где каждый гетероарильный фрагмент представляет собой 5- или 6-членное моноциклическое ароматическое кольцо, которое содержит 1, 2, 3 или 4 гетероатома, по отдельности выбранные из азота, кислорода и серы; R¹⁰ выбран из группы, состоящей из водорода, C₁-C₆-алкила и SO₂R¹⁴;

R¹¹ выбран из группы, состоящей из водорода и C₁-C₆-алкила; или

R¹⁰ и R¹¹ вместе с атомом азота, к которому они присоединены, образуют 3-6-членное гетероциклическое кольцо, которое необязательно содержит атом кислорода;

R¹² выбран из группы, состоящей из водорода, C₁-C₄-алкила, C₁-C₄-галогеналкила, C₁-C₄-алкилсульфонила, C₁-C₄-галогеналкилсульфонила, фенилсульфонила, фенилсульфонила, замещенного 1-2 группами R¹³; C₁-C₄-алкилкарбонила, C₁-C₄-галогеналкилкарбонила, C₆-C₁₀-арилкарбонила, C₆-C₁₀-

арилкарбонила, замещенного 1-4 группами R^{13} , гетероарилкарбонила, гетероарилкарбонила, замещенного 1-3 группами R^{13} , C_6-C_{10} -арил C_1-C_3 -алкилкарбонила, C_6-C_{10} -арил C_1-C_3 -алкилкарбонила, замещенного 1-4 группами R^{13} , гетероарил C_1-C_3 -алкилкарбонила и гетероарил C_1-C_3 -алкилкарбонила, замещенного 1-3 группами R^{13} ;

каждая R^{13} независимо выбрана из группы, состоящей из галогена, C_1-C_4 -алкила, C_1-C_4 -галогеналкила, C_1-C_4 -алкокси, C_1-C_4 -галогеналкокси, циано и C_1-C_4 -алкилсульфонила; где

каждый гетероарильный фрагмент представляет собой 5- или 6-членное моноциклическое ароматическое кольцо, которое содержит 1, 2, 3 или 4 гетероатома, по отдельности выбранные из азота, кислорода и серы;

R^{14} выбран из группы, состоящей из C_1-C_4 -алкила, C_1-C_4 -галогеналкила и C_1-C_4 -алкил(C_1-C_4 -алкил)амино;

R^{15} выбран из группы, состоящей из водорода, C_1-C_4 -алкила и C_1-C_4 -галогеналкила;

R^{16} выбран из группы, состоящей из водорода, C_1-C_4 -алкила, C_1-C_4 -галогеналкила и C_1-C_4 -алкоксикарбонил C_1-C_4 -алкила.

2. Соединение по п.1, в котором X представляет собой серу.

3. Соединение по п.1 или 2, в котором R^1 выбран из группы, состоящей из водорода и C_1-C_4 -алкила.

4. Соединение по любому из пп.1-3, в котором R^2 выбран из группы, состоящей из водорода, C_1-C_4 -алкила и C_3-C_4 -алкинила.

5. Соединение по любому из пп.1-4, в котором R^3 выбран из группы, состоящей из водорода, хлора и фтора.

6. Соединение по любому из пп.1-5, в котором R^4 выбран из группы, состоящей из водорода, хлора, циано и аминотиокарбонила.

7. Соединение по любому из пп.1-6, в котором каждый из R^5 и R^6 независимо выбран из группы, состоящей из водорода, C_1-C_4 -алкила, CO_2R^9 и CH_2OR^{12} .

8. Соединение по любому из пп.1-7, в котором каждый из R^7 и R^8 независимо выбран из группы, состоящей из водорода, C_1-C_4 -алкила, C_1-C_6 -галогеналкила, CO_2R^9 , $CONR^{10}R^{11}$ и CH_2OR^{12} .

9. Соединение по любому из пп.1-8, в котором R^9 выбран из группы, состоящей из водорода, C_1-C_4 -алкила, C_1-C_4 -галогеналкила, C_1-C_2 -алкокси C_1-C_2 -алкила, фенил C_1-C_2 -алкила и фенил C_1-C_2 -алкила, замещенного 1-2 группами R^{13} .

10. Соединение по любому из пп.1-9, в котором R^{10} выбран из группы, состоящей из водорода и SO_2R^{14} .

11. Соединение по любому из пп.1-10, в котором R^{11} представляет собой водород.

12. Соединение по любому из пп.1-11, в котором R^{12} выбран из группы, состоящей из водорода, C_1-C_2 -алкила, C_1-C_2 -алкилсульфонила, C_1-C_2 -галогеналкилсульфонила, C_1-C_4 -алкилкарбонила, фенилкарбонила, фенилкарбонила, замещенного 1-2 группами R^{13} , фенил C_1-C_2 -алкилкарбонила и фенил C_1-C_2 -алкилкарбонила, замещенного 1-2 группами R^{13} .

13. Соединение по любому из пп.1-12, в котором R^{13} выбран из группы, состоящей из галогена, C_1-C_4 -алкила, C_1-C_4 -галогеналкила, C_1-C_4 -алкокси, C_1-C_4 -галогеналкокси, циано и C_1-C_4 -алкилсульфонила.

14. Соединение по любому из пп.1-13, в котором R^{14} выбран из группы, состоящей из C_1-C_4 -алкила и C_1-C_4 -алкил(C_1-C_4 -алкил)амино.

15. Агрехимическая композиция, содержащая гербицидно эффективное количество соединения формулы (I) по любому из пп.1-14 и агрохимически приемлемый разбавитель или носитель.

16. Способ контроля или предупреждения роста нежелательных растений, где гербицидно эффективное количество соединения формулы (I) по любому из пп.1-14, или композиции по п.15, применяют в отношении растений, их частей или места их произрастания.

