

(19)



**Евразийское
патентное
ведомство**

(21) **202490444** (13) **A1**

(12) **ОПИСАНИЕ ИЗОБРЕТЕНИЯ К ЕВРАЗИЙСКОЙ ЗАЯВКЕ**

(43) Дата публикации заявки
2024.05.07

(51) Int. Cl. **C07D 417/12** (2006.01)
A01N 43/82 (2006.01)
A01P 21/00 (2006.01)
A01P 13/00 (2006.01)

(22) Дата подачи заявки
2022.08.12

(54) **ЗАМЕЩЕННЫЕ 1,2,4-ТИАДИАЗОЛИЛНИКОТИНАМИДЫ, ИХ СОЛИ ИЛИ N-ОКСИДЫ И ИХ ПРИМЕНЕНИЕ В КАЧЕСТВЕ ГЕРБИЦИДНО АКТИВНЫХ ВЕЩЕСТВ**

(31) **21191685.3**

(32) **2021.08.17**

(33) **EP**

(86) **PCT/EP2022/072678**

(87) **WO 2023/020964 2023.02.23**

(71) Заявитель:

**БАЙЕР АКЦИЕНГЕЗЕЛЬШАФТ
(DE)**

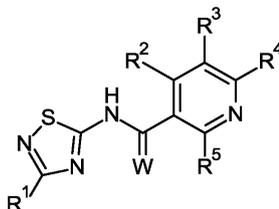
(72) Изобретатель:

**Барбер Дэвид Майкл, Аметовски
Джхи, Шнаттерер Штефан, Шмуцлер
Дирк, Райнгрубер Анна Мария,
Болленбах-Валь Биргит, Асмус
Элизабет, Рот Сина (DE)**

(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)**

(57) Настоящее изобретение относится к замещенным 1,2,4-тиадиазолилникотинамидам общей формулы (I), их солям или N-оксидам



где радикалы в общей формуле (I) соответствуют определениям, приведенным в описании, и к их применению в качестве гербицидов, в частности, для борьбы с широколиственными сорняками и/или сорными травами в посевах полезных растений и/или в качестве регуляторов роста растений для воздействия на рост посевов полезных растений.

A1

202490444

202490444

A1

ЗАМЕЩЕННЫЕ 1,2,4-ТИАДИАЗОЛИЛНИКОТИНАМИДЫ, ИХ СОЛИ ИЛИ N-
ОКСИДЫ И ИХ ПРИМЕНЕНИЕ В КАЧЕСТВЕ ГЕРБИЦИДНО АКТИВНЫХ
5 ВЕЩЕСТВ

Изобретение относится к области техники гербицидов и/или регуляторов
роста растений. В частности, изобретение в первую очередь относится к
замещенным 1,2,4-тиадиазолилникотинамидам и композициям, содержащим
10 указанные замещенные 1,2,4-тиадиазолилникотинамиды.

Кроме того, настоящее изобретение относится к способам получения
указанных замещенных 1,2,4-тиадиазолилникотинамидов и к их применению в
качестве гербицидов и/или регуляторов роста растений.

Известные на сегодняшний день средства защиты растений для
15 избирательной борьбы с вредными растениями в посевах полезных растений или
активные соединения для борьбы с нежелательной растительностью при
применении иногда имеют недостатки, а именно: (а) отсутствие или
недостаточная гербицидная активность в отношении особенно вредных
растений, (б) спектр вредных растений, с которыми можно бороться с помощью
20 активного соединения, недостаточно широк, (в) их селективность в посевах
полезных растений слишком низка и/или (г) они имеют токсикологически
неблагоприятный профиль.

Кроме того, некоторые активные соединения, которые можно использовать
в качестве регуляторов роста ряда полезных растений, вызывают нежелательное
25 снижение урожайности других полезных растений или несовместимы с
сельскохозяйственными растениями, или только в узком диапазоне норм
внесения. Кроме того, некоторые из известных активных соединений не могут
быть экономично произведены в промышленном масштабе из-за
труднодоступности предшественников и реагентов или из-за недостаточной
30 химической стабильности.

В предшествующем уровне техники описано несколько замещенных 1,2,4-
тиадиазолов, которые проявляют полезными свойства и применения. Патенты
US4416683, US4515625, US4636243 и US4801718 относятся к гетероциклическим

замещенным N-бензамидам и их применению в качестве гербицидов для борьбы с нежелательными растениями.

В патенте US4343945 описано, что трихлорметилзамещенные 1,2,4-тиадиазолы пригодны в качестве гербицидов, фунгицидов и инсектицидов.

5 Кроме того, в DE2154852 описано, что 5-замещенные амино-3-изопропил-1,2,4-тиадиазолы являются эффективными пестицидами.

Помимо этого, DE19601139 относится к получению ацилированных 5-амино-1,2,4-тиадиазолов и к их применению в качестве пестицидов.

10 В нескольких документах (WO 01/36415, WO 01/40206, WO 01/40223 и WO 01/46165) описано, что замещенные 1,2,4-тиадиазолы также подходят для борьбы с различными вредителями.

В WO 2017/005717 и WO 2018/108791 показано, что арил- и гетероарилзамещенные 1,2,4-тиадиазолы очень эффективны для борьбы с нежелательными насекомыми в посевах полезных растений.

15 Тем не менее, о замещенных 1,2,4-тиадиазолилникотинамидах, их солях или N-оксидах, несущих орто-циклоалкильные или орто-алкенильные заместители, ранее не сообщалось как о гербицидно активных соединениях. Неожиданно было обнаружено, что замещенные 1,2,4-тиадиазолилникотинамиды, их соли или N-оксиды, несущие орто-циклоалкильные или орто-алкенильные заместители, особенно пригодны в
20 качестве гербицидов.

Известные к настоящему времени гербициды для борьбы с вредными растениями в посевах полезных растений или гербициды для борьбы с нежелательной растительностью при применении иногда имеют недостатки,
25 будь то (а) отсутствие или недостаточная гербицидная активность в отношении особо вредных растений, (б) что спектр вредных растений, с которыми можно бороться с помощью активного соединения, недостаточно широк, и/или (в) что селективность гербицидов и их совместимость с сельскохозяйственными растениями слишком низка, что приводит к нежелательному повреждению и/или
30 нежелательному снижению урожайности сельскохозяйственных культур.

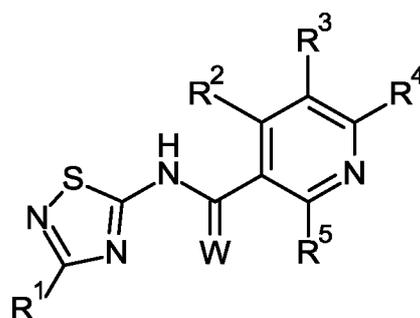
Таким образом, все еще существует потребность в альтернативных гербицидах, в частности высокоактивных гербицидах, которые применимы при низких нормах внесения и/или имеют хорошую совместимость с сельскохозяйственными растениями, для избирательного применения в

растительных культурах или использования на несельскохозяйственных землях. Также желательно предложить альтернативные химически активные соединения, которые можно выгодно использовать в качестве гербицидов или регуляторов роста растений.

5 Поэтому целью настоящего изобретения является создание соединений, обладающих гербицидной активностью, которые высокоэффективны против экономически важных вредных растений даже при относительно низких нормах внесения и которые можно избирательно использовать на одном или нескольких сельскохозяйственных растениях.

10 В настоящее время обнаружено, что соединения следующей формулы (I), их соли или N-оксиды отвечают указанным целям.

Соответственно, в настоящем изобретении предложены замещенные 1,2,4-тиадиазолилникотинамиды общей формулы (I), их соли или N-оксиды



(I)

15 в которой

W представляет собой кислород или серу,

R¹ представляет собой водород, галоген, циано, (C₁-C₄)-алкил, (C₁-C₄)-галогеналкил, (C₃-C₆)-циклоалкил,

20 (C₃-C₆)-галогенциклоалкил, (C₁-C₄)-алкокси, (C₁-C₄)-галогеналкокси, (C₁-C₄)-алкилтио, (C₁-C₄)-алкилсульфинил, (C₁-C₄)-алкилсульфонил, (C₁-C₄)-галогеналкилтио, (C₁-C₄)-галогеналкилсульфинил, (C₁-C₄)-галогеналкилсульфонил или (C₃-C₆)-циклоалкил-(C₁-C₄)-алкил,

25 R² представляет собой (C₂-C₄)-алкенил, (C₂-C₄)-галогеналкенил, (C₁-C₄)-галогеналкил-(C₂-C₄)-алкенил, (C₃-C₆)-циклоалкил, (C₃-C₆)-галогенциклоалкил, (C₁-C₄)-алкил-(C₃-C₆)-циклоалкил, (C₁-C₄)-алкил-(C₃-C₆)-галогенциклоалкил, (C₁-C₄)-галогеналкил-(C₃-C₆)-циклоалкил, (C₁-C₄)-галогеналкил-(C₃-C₆)-галогенциклоалкил или (C₃-C₆)-циклоалкил-(C₃-C₆)-циклоалкил,

R^3 представляет собой водород, галоген, циано, (C₁-C₄)-алкил, (C₁-C₄)-галогеналкил, (C₁-C₄)-алкокси или

(C₁-C₄)-галогеналкокси,

R^4 представляет собой водород, галоген, циано, (C₁-C₄)-алкил, (C₁-C₄)-галогеналкил, (C₁-C₄)-алкокси или

(C₁-C₄)-галогеналкокси,

R^5 представляет собой водород, галоген, циано, (C₁-C₄)-алкил, (C₁-C₄)-галогеналкил, (C₃-C₆)-циклоалкил,

(C₃-C₆)-галогенциклоалкил (C₁-C₄)-алкокси, (C₁-C₄)-галогеналкокси, (C₁-C₄)-алкилтио, (C₁-C₄)-алкил-сульфинил, (C₁-C₄)-алкилсульфонил, (C₁-C₄)-галогеналкилтио, (C₁-C₄)-галогеналкилсульфинил, (C₁-C₄)-галогеналкилсульфонил или (C₃-C₆)-циклоалкил-(C₁-C₄)-алкил.

Соединения общей формулы (I) могут образовывать соли путем присоединения приемлемой неорганической или органической кислоты, например, минеральных кислот, например, HCl, HBr, H₂SO₄, H₃PO₄ или HNO₃, или органических кислот, например, карбоновых кислот, таких как муравьиная кислота, уксусная кислота, пропионовая кислота, щавелевая кислота, молочная кислота или салициловая кислота или сульфоновых кислот, например, *n*-толуолсульфоновой кислоты, к основной группе, например, амино, алкиламино, диалкиламино, пиперидино, морфолино или пиридино. В таком случае эти соли будут содержать сопряженное основание кислоты в качестве аниона. Пригодные заместители в депротонированной форме, например, сульфоновые кислоты, в частности сульфонамиды или карбоновые кислоты, способны образовывать внутренние соли с группами, такими как аминогруппы, которые сами являются протонируемыми. Соли также могут быть образованы действием основания на соединения общей формулы (I). Пригодными основаниями являются, например, органические амины, такие как триалкиламины, морфолин, пиперидин и пиридин, и гидроксиды, карбонаты и гидрокарбонаты аммония, щелочных металлов или щелочноземельных металлов, в особенности гидроксид натрия, гидроксид калия, карбонат натрия, карбонат калия, гидрокарбонат натрия и гидрокарбонат калия. Эти соли представляют собой соединения, в которых кислотный водород заменен на пригодный в сельском хозяйстве катион, например, соли металлов, в особенности соли щелочных металлов или соли щелочноземельных металлов, в особенности соли натрия и калия, или же соли

аммония, соли с органическими аминами или четвертичные соли аммония, например, с катионами формулы $[NR^aR^bR^cR^d]^+$, в которой от R^a до R^d в каждом случае независимо друг от друга представляют собой органический радикал, в особенности алкил, арил, аралкил или алкиларил. Также пригодны соли алкилсульфония и алкилсульфоксония, такие как соли (C₁-C₄)-триалкилсульфония и (C₁-C₄)-триалкилсульфоксония.

Замещенные 1,2,4-тиадиазолилникотинамиды общей формулы (I) в соответствии с изобретением, в зависимости от внешних условий, таких как pH, растворитель и температура, могут присутствовать в различных таутомерных структурах, каждая из которых охватывается общей формулой (I).

Соединения формулы (I), используемые в соответствии с изобретением, и их соли или N-оксиды также в дальнейшем упоминаются как «соединения общей формулы (I)».

Изобретение предпочтительно обеспечивает соединения общей формулы (I), их соли или N-оксиды, где

W представляет собой кислород или серу,

R¹ представляет собой водород, галоген, (C₁-C₄)-алкил, (C₁-C₄)-галогеналкил, (C₃-C₆)-циклоалкил, (C₁-C₄)-алкокси, (C₁-C₄)-галогеналкокси или (C₁-C₄)-алкилтио,

R² представляет собой (C₂-C₄)-алкенил, (C₂-C₄)-галогеналкенил, (C₃-C₆)-циклоалкил, (C₃-C₆)-галогенциклоалкил, (C₁-C₄)-алкил-(C₃-C₆)-циклоалкил или (C₁-C₄)-алкил-(C₃-C₆)-галогенциклоалкил,

R³ представляет собой водород, галоген, (C₁-C₄)-алкил, (C₁-C₄)-галогеналкил или (C₁-C₄)-алкокси,

R⁴ представляет собой водород, галоген, (C₁-C₄)-алкил, (C₁-C₄)-галогеналкил или (C₁-C₄)-алкокси,

R⁵ представляет собой водород, галоген, (C₁-C₄)-алкил, (C₁-C₄)-галогеналкил, (C₃-C₆)-циклоалкил,

(C₁-C₄)-алкокси или (C₁-C₄)-галогеналкокси.

В особенности, изобретение обеспечивает соединения общей формулы (I), их соли или N-оксиды, где

W представляет собой кислород или серу, предпочтительно кислород,

R¹ представляет собой водород, галоген, (C₁-C₄)-алкил или (C₁-C₄)-галогеналкил,

R^2 представляет собой (C_2-C_4) -алкенил, (C_2-C_4) -галогеналкенил, (C_3-C_6) -циклоалкил, (C_3-C_6) -галогенциклоалкил или (C_1-C_4) -алкил- (C_3-C_6) -циклоалкил,

R^3 представляет собой водород, галоген или (C_1-C_4) -алкил,

R^4 представляет собой водород, галоген или (C_1-C_4) -алкил,

5 R^5 представляет собой водород, галоген, (C_1-C_4) -алкил, (C_1-C_4) -галогеналкил, (C_1-C_4) -алкокси или

(C_3-C_6) -циклоалкил.

Более конкретно изобретение обеспечивает соединения общей формулы (I), их соли или N-оксиды, где

10 W представляет собой кислород,

R^1 представляет собой водород, галоген или (C_1-C_4) -алкил,

R^2 представляет собой (C_2-C_4) -алкенил, (C_3-C_6) -циклоалкил, (C_3-C_6) -галогенциклоалкил или (C_1-C_4) -алкил- (C_3-C_6) -циклоалкил,

R^3 представляет собой водород,

15 R^4 представляет собой водород,

R^5 представляет собой водород, галоген, (C_1-C_4) -галогеналкил, (C_1-C_4) -алкокси или (C_3-C_6) -циклоалкил.

В особенности изобретение обеспечивает соединения общей формулы (I), их соли или N-оксиды, где

20 W представляет собой кислород,

R^1 представляет собой водород, хлор, бром, метил, этил или *трет*-бутил,

R^2 представляет собой проп-1-ен-2-ил, циклопропил, 2-метилциклопропил или 2,2-дифторциклопропил,

R^3 представляет собой водород,

25 R^4 представляет собой водород,

R^5 представляет собой водород, фтор, хлор, трифторметил, метокси или циклопропил.

Более конкретно изобретение обеспечивает соединения общей формулы (I), их соли или N-оксиды, где

30 W представляет собой кислород,

R^1 представляет собой водород, хлор, бром или метил,

R^2 представляет собой проп-1-ен-2-ил, циклопропил, 2-метилциклопропил или 2,2-дифторциклопропил,

R^3 представляет собой водород,

R⁴ представляет собой водород,

R⁵ представляет собой водород, фтор, хлор, трифторметил или метокси.

5 Определения радикалов, перечисленные выше, в общих чертах или в пределах областей предпочтения, применимы как к конечным продуктам общей формулы (I), так и, соответственно, к исходным материалам или промежуточным соединениям, необходимым для получения в каждом случае. Эти определения радикалов можно комбинировать друг с другом по желанию, т.е. включая комбинации между данными предпочтительными диапазонами.

10 Прежде всего по причинам более высокой гербицидной активности, лучшей селективности и/или лучшей производительности соединения вышеупомянутой общей формулы (I) в соответствии с изобретением и/или их соли и N-оксиды или их применение в соответствии с изобретением представляют особый интерес, в которых отдельные радикалы имеют одно из предпочтительных значений, уже указанных или указанных ниже, или, в частности, те, в которых одно или
15 несколько из уже определенных или указанных ниже предпочтительных значений встречаются в комбинации.

Что касается соединений в соответствии с изобретением, термины, использованные выше и ниже, будут пояснены. Они известны специалисту в данной области техники и, в частности, имеют определения, поясняемые ниже.

20 Если не указано иное, названия химических групп обычно следует понимать так, что присоединение к скелету или остальной части молекулы происходит через структурный элемент, упомянутый последним, то есть, например, в случае (C₂-C₈)-алкенилокси через атом кислорода, а в случае (C₁-C₈)-алкокси-(C₁-C₄)-алкила или (C₁-C₈)-алкоксикарбонил-(C₁-C₈)-алкила, в
25 каждом случае, через атом углерода алкильной группы.

В соответствии с изобретением «алкилсульфонил» - отдельно или как часть химической группы - относится к алкилсульфонилю с прямой или разветвленной цепью, предпочтительно имеющему от 1 до 8 или от 1 до 6 атомов углерода, например, (но не ограничиваясь этим) (C₁-C₆)-алкилсульфонил, такой как
30 метилсульфонил, этилсульфонил, пропилсульфонил,

1-метилэтилсульфонил, бутилсульфонил, 1-метилпропилсульфонил, 2-метилпропилсульфонил, 1,1-диметил-этилсульфонил, пентилсульфонил, 1-метилбутилсульфонил, 2-метилбутилсульфонил, 3-метилбутилсульфонил,

1,1-диметилпропилсульфонил, 1,2-диметилпропилсульфонил, 2,2-
диметилпропилсульфонил, 1-этилпропил-сульфонил, гексилсульфонил, 1-
метилпентилсульфонил, 2-метилпентилсульфонил, 3-метилпентилсульфонил,
4-метилпентилсульфонил, 1,1-диметилбутилсульфонил, 1,2-
5 диметилбутилсульфонил, 1,3-диметилбутил-сульфонил, 2,2-
диметилбутилсульфонил, 2,3-диметилбутилсульфонил, 3,3-
диметилбутилсульфонил, 1-этил-бутилсульфонил, 2-этилбутилсульфонил, 1,1,2-
триметилпропилсульфонил, 1,2,2-триметилпропилсульфонил,
1-этил-1-метилпропилсульфонил и 1-этил-2-метилпропилсульфонил.

10 В соответствии с изобретением, «алкилтио» - отдельно или как часть
химической группы - означает неразветвленный или разветвленный S-алкил,
предпочтительно имеющий от 1 до 8 или от 1 до 6 атомов углерода, такой как
(C₁-C₁₀)-, (C₁-C₆)- или (C₁-C₄)-алкилтио, например, (но не ограничиваясь этим)
(C₁-C₆)-алкилтио, такой как метилтио, этилтио, пропилтио,

15 1-метилэтилтио, бутилтио, 1-метилпропилтио, 2-метилпропилтио, 1,1-
диметилэтилтио, пентилтио, 1-метилбутилтио, 2-метилбутилтио, 3-
метилбутилтио, 1,1-диметилпропилтио, 1,2-диметил-пропилтио, 2,2-
диметилпропилтио, 1-этилпропилтио, гексилтио, 1-метилпентилтио, 2-метил-
пентилтио, 3-метилпентилтио, 4-метилпентилтио, 1,1-диметилбутилтио, 1,2-
20 диметилбутилтио, 1,3-диметилбутилтио, 2,2-диметилбутилтио, 2,3-
диметилбутилтио, 3,3-диметилбутилтио, 1-этилбутил-thio, 2-этилбутилтио, 1,1,2-
триметилпропилтио, 1,2,2-триметилпропилтио, 1-этил-1-метилпропилтио и 1-
этил-2-метилпропилтио.

В соответствии с изобретением «алкилсульфинил (алкил-S(=O)-)», если не
25 определено иначе в другом месте, означает алкильные радикалы, которые
прикрепляются к скелету посредством -S(=O)-, такие как (C₁-C₁₀)-, (C₁-C₆)- или
(C₁-C₄)-алкилсульфинил, например, (но не ограничиваясь этим) (C₁-C₆)-
алкилсульфинил, такой как метилсульфинил, этилсульфинил, пропилсульфинил,
1-метилэтилсульфинил, бутилсульфинил, 1-метилпропилсульфинил, 2-
30 метилпропилсульфинил, 1,1-диметилэтилсульфинил, пентилсульфинил, 1-
метилбутилсульфинил, 2-метилбутилсульфинил, 3-метилбутил-сульфинил, 1,1-
диметилпропилсульфинил, 1,2-диметилпропилсульфинил, 2,2-
диметилпропилсульфинил, 1-этилпропилсульфинил, гексилсульфинил, 1-
метилпентилсульфинил, 2-метилпентилсульфинил, 3-метилпентил-сульфинил, 4-

метилпентилсульфинил, 1,1-диметилбутилсульфинил, 1,2-
диметилбутилсульфинил, 1,3-диметил-бутилсульфинил, 2,2-
диметилбутилсульфинил, 2,3-диметилбутилсульфинил, 3,3-
диметилбутилсульфинил, 1-этил-бутилсульфинил, 2-этилбутилсульфинил, 1,1,2-
5 триметилпропилсульфинил, 1,2,2-триметилпропилсульфинил, 1-этил-1-
метилпропилсульфинил и 1-этил-2-метилпропилсульфинил.

«Алкокси» означает алкильный радикал, связанный через атом кислорода,
например, (но не ограничиваясь этим) (C₁-C₆)-алкокси, такой как метокси,
этокси, пропокси, 1-метилэтокси, бутокси, 1-метилпропокси, 2-метилпропокси,
10 1,1-диметилэтокси, пентокси, 1-метилбутокси, 2-метилбутокси, 3-метилбутокси,
1,1-диметилпропокси, 1,2-диметилпропокси, 2,2-диметилпропокси, 1-
этилпропокси, гексокси, 1-метилпентокси, 2-метил-пентокси, 3-метилпентокси,
4-метилпентокси, 1,1-диметилбутокси, 1,2-диметилбутокси, 1,3-диметил-
бутокси, 2,2-диметилбутокси, 2,3-диметилбутокси, 3,3-диметилбутокси, 1-
15 этилбутокси, 2-этилбутокси, 1,1,2-триметилпропокси, 1,2,2-триметилпропокси,
1-этил-1-метилпропокси и 1-этил-2-метил-пропокси. Алкенилокси означает
алкенильный радикал, связанный через атом кислорода, и алкинилокси означает
алкинильный радикал, связанный через атом кислорода, такой как (C₂-C₁₀)-, (C₂-
C₆)- или (C₂-C₄)-алкенокси и (C₃-C₁₀)-, (C₃-C₆)- или (C₃-C₄)-алкинокси.

20 Термин «галоген» означает, например, фтор, хлор, бром или йод. Если
термин используют для радикала, то «галоген» означает, например, атом фтора,
хлора, брома или йода.

В соответствии с изобретением «алкил» означает насыщенный
углеводородный радикал с прямой или разветвленной открытой цепью, который
25 необязательно является моно- или полизамещенным, и в последнем случае его
называют «замещенным алкилом». Предпочтительными заместителями являются
атомы галогена, алкокси, галоалкокси, циано, алкилтио, галогеналкилтио, амино
или нитрогруппы, причем особое предпочтение отдают метокси, метилу,
фторалкилу, циано, нитро, фтору, хлору, бромю или йоду.

30 Приставка «ди» включает в себя комбинацию одинаковых или разных
алкильных радикалов, например, диметил или метил(этил) или этил(метил).

«Галогеналкил», «-алкенил» и «-алкинил» соответственно означают алкил,
алкенил и алкинил, частично или полностью замещенный одинаковыми или
разными атомами галогена, например, моногалогеналкил такие как CH₂CH₂Cl,

$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{Br}$, CHClCH_3 , CH_2Cl , CH_2F ; пергалогеналкил такие как CCl_3 , CClF_2 , CFCl_2 , CF_2CClF_2 , $\text{CF}_2\text{CClFCF}_3$; полигалогеналкил такие как CH_2CHFCl , CF_2CClFH , CF_2CBrFH , CH_2CF_3 ; термин пергалогеналкил также охватывает термин перфторалкил.

5 «Галогеналкокси» представляет собой, например, OCF_3 , OCHF_2 , OCH_2F , OCF_2CF_3 , OCH_2CF_3 и $\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{Cl}$; это относится соответственно к галогеналкенилу и другим галогензамещенным радикалам.

10 Выражение «(C₁-C₄)-алкил», приведенное в данном случае при помощи примера, представляет собой короткое обозначение для неразветвленного или разветвленного алкила с одним - 4 атомами углерода согласно диапазону, указанному для атомов углерода, т.е. охватывает радикалы метила, этила, 1-пропила, 2-пропила, 1-бутила, 2-бутила, 2-метилпропила или *трет*-бутила. Общие алкильные радикалы с более широко определенным диапазоном атомов углерода, например, «(C₁-C₆)-алкил», соответственно также охватывают

15 неразветвленные или разветвленные алкильные радикалы с большим числом атомов углерода, т.е. в соответствии с примером также алкильные радикалы с 5 и 6 атомами углерода.

20 Если не указано конкретно, то предпочтение отдают скелетам с меньшим количеством атомов углерода, например, с от 1 до 6 атомами углерода, или с от 2 до 6 атомами углерода в случае ненасыщенных групп, в случае гидрокарбильных радикалов, таких как алкильные, алкенильные и алкинильные радикалы, в том числе составные радикалы. Алкильные радикалы, в том числе составные радикалы, такие как алкокси, галогеналкил, и т.д., представляют собой, например, метил, этил, *n*-пропил или *и*-пропил, *n*-, *и*-, *т*- или 2-бутил,

25 пентилы, гексилы, такие как *n*-гексил, *и*-гексил и 1,3-диметилбутил, гептилы, такие как *n*-гептил, 1-метилгексил и 1,4-диметилпентил; алкенильные и алкинильные радикалы определены как возможные ненасыщенные радикалы, соответствующие алкильным радикалам, где присутствует по меньшей мере одна двойная связь или тройная связь. Предпочтение отдают радикалам с одной

30 двойной связью или тройной связью.

Термин «алкенил» также включает в себя, в частности, неразветвленные или разветвленные углеводородные радикалы с открытой цепью с более чем одной двойной связью, такие как 1,3-бутадиенил и 1,4-пентадиенил, а также алленильные или кумуленильные радикалы с одной или большим количеством

кумулятивных двойных связей, например, алленил (1,2-пропадиенил), 1,2-бутадиенил и 1,2,3-пентатриенил. Алкенил означает, например, винил, который необязательно может быть замещен другими алкильными радикалами, например (но не ограничиваясь только ними) (C₂-C₆)-алкенил, такой как этенил, 1-пропенил, 2-пропенил, 1-метилэтенил, 1-бутенил, 2-бутенил, 3-бутенил, 1-метил-1-пропенил, 2-метил-1-пропенил, 1-метил-2-пропенил, 2-метил-2-пропенил, 1-пентенил, 2-пентенил, 3-пентенил, 4-пентенил, 1-метил-1-бутенил, 2-метил-1-бутенил, 3-метил-1-бутенил, 1-метил-2-бутенил, 2-метил-2-бутенил, 3-метил-2-бутенил, 1-метил-3-бутенил, 2-метил-3-бутенил, 3-метил-3-бутенил, 1,1-диметил-2-пропенил, 1,2-диметил-1-пропенил, 1,2-диметил-2-пропенил, 1-этил-1-пропенил, 1-этил-2-пропенил, 1-гексенил, 2-гексенил, 3-гексенил, 4-гексенил, 5-гексенил, 1-метил-1-пентенил, 2-метил-1-пентенил, 3-метил-1-пентенил, 4-метил-1-пентенил, 1-метил-2-пентенил, 2-метил-2-пентенил, 3-метил-2-пентенил, 4-метил-2-пентенил, 1-метил-3-пентенил, 2-метил-3-пентенил, 3-метил-3-пентенил, 4-метил-3-пентенил, 1-метил-4-пентенил, 2-метил-4-пентенил, 3-метил-4-пентенил, 4-метил-4-пентенил, 1,1-диметил-2-бутенил, 1,1-диметил-3-бутенил, 1,2-диметил-1-бутенил, 1,2-диметил-2-бутенил, 1,2-диметил-3-бутенил, 1,3-диметил-1-бутенил, 1,3-диметил-2-бутенил, 1,3-диметил-3-бутенил, 2,2-диметил-3-бутенил, 2,3-диметил-1-бутенил, 2,3-диметил-2-бутенил, 2,3-диметил-3-бутенил, 3,3-диметил-1-бутенил, 3,3-диметил-2-бутенил, 1-этил-1-бутенил, 1-этил-2-бутенил, 1-этил-3-бутенил, 2-этил-1-бутенил, 2-этил-2-бутенил, 2-этил-3-бутенил, 1,1,2-триметил-2-пропенил, 1-этил-1-метил-2-пропенил, 1-этил-2-метил-1-пропенил и 1-этил-2-метил-2-пропенил.

Термин «циклоалкил» означает карбоциклическую насыщенную кольцевую систему с предпочтительно 3-8 кольцевыми атомами углерода, например, циклопропил, циклобутил, циклопентил или циклогексил, которая необязательно имеет дополнительное замещение, предпочтительно посредством водорода, алкила, алкокси, циано, нитро, алкилтио, галогеналкилтио, галогена, алкенила, алкинила, галогеналкила, amino, алкиламино, бисалкиламино, алкоксикарбонила, гидроксикарбонила, арилалкоксикарбонила, аминокарбонила, алкиламинокарбонила, циклоалкиламинокарбонила. В случае необязательно замещенного циклоалкила, включены циклические системы с заместителями, также включая заместители с двойной связью на циклоалкильном радикале,

например, алкилиденовая группа, такая как метилиден. В случае необязательно замещенного циклоалкила, также включены полициклические алифатические системы, например, бицикло[1.1.0]бутан-1-ил, бицикло[1.1.0]бутан-2-ил, бицикло[2.1.0]пентан-1-ил, бицикло[1.1.1]пентан-1-ил, бицикло[2.1.0]пентан-2-ил, бицикло[2.1.0]пентан-5-ил, бицикло[2.1.1]гексил, бицикло[2.2.1]гепт-2-ил, бицикло[2.2.2]октан-2-ил, бицикло[3.2.1]октан-2-ил, бицикло[3.2.2]нонан-2-ил, адамантан-1-ил и адамантан-2-ил, а также системы, такие как например, 1,1'-би(циклопропил)-1-ил, 1,1'-би(циклопропил)-2-ил. Термин «(C₃-C₇)-циклоалкил» представляет собой короткое обозначение для циклоалкила, имеющего от трех до 7 атомов углерода, соответствующее диапазону, заданному для атомов углерода.

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

В соответствии с изобретением «галогеналкилтио» - сам по себе или как составная часть химической группы - представляет собой S-галогеналкил с прямой или разветвленной цепью, предпочтительно имеющий от 1 до 8 или имеющий от 1 до 6 атомов углерода, такой как (C₁-C₈)-, (C₁-C₆)- или (C₁-C₄)-галогеналкилтио, например, (но не ограничиваясь ими) трифторметилтио, пентафторэтилтио, дифторметил, 2,2-дифторэт-1-илтио, 2,2,2-дифторэтил-1-илтио, 3,3,3-проп-1-илтио.

«Галогенциклоалкил» означает циклоалкил, который частично или полностью замещен одинаковыми или разными атомами галогена, такими как F, Cl и Br, или галогеналкилом, таким как трифторметил или дифторметил, например, 1-фторциклопроп-1-ил, 2-фторциклопроп-1-ил, 2,2-дифторциклопроп-1-ил, 1-фторциклобут-1-ил, 1-трифторметилциклопроп-1-ил, 2-трифторметилциклопроп-1-ил, 1-хлорциклопроп-1-ил, 2-хлорциклопроп-1-ил, 2,2-дихлорциклопроп-1-ил, 3,3-дифторциклобутил.

Если соединения могут образовывать за счет водородного сдвига таутомеры, структура которых формально не охватывается общей формулой (I), эти таутомеры, тем не менее, подпадают под определение соединений в соответствии с изобретением общей формулы (I), за исключением случаев, когда конкретный таутомер находится на рассмотрении. Например, многие

карбонильные соединения могут присутствовать как в кето-форме, так и в енольной форме, причем обе формы охватываются определением соединения общей формулы (I).

В зависимости от природы заместителей и способа, которым они присоединены, соединения общей формулы (I) могут присутствовать в виде стереоизомеров. Формула (I) охватывает все возможные стереоизомеры, определенные их особой трехмерной формой, такие как энантиомеры, диастереомеры, Z и E изомеры. Если, например, присутствует одна или несколько алкенильных групп, то могут встречаться диастереомеры (Z и E изомеры). Если, например, присутствует один или несколько асимметричных атомов углерода, то могут встречаться энантиомеры и диастереомеры. Стереоизомеры могут быть получены из смесей, полученных при приготовлении обычными способами разделения. Хроматографическое разделение можно осуществлять или на аналитической шкале, чтобы найти энантиомерный избыток или диастереомерный избыток, или же на препаративной шкале, чтобы произвести образец для испытаний для биологического тестирования. Кроме того, возможно селективное получение стереоизомеров, используя стереоселективные реакции с применением оптически активных исходных веществ и/или вспомогательных веществ. Таким образом, изобретение также относится ко всем стереоизомерам, которые охвачены общей формулой (I), но которые не представлены в их специфической стереоизомерной форме и к их смесям.

Если соединения получены в виде твердых веществ, очистку можно также проводить перекристаллизацией или расщеплением. Если отдельные соединения общей формулы (I) не могут быть получены удовлетворительным образом способами, описанными ниже, их можно получить путем дериватизации других соединений общей формулы (I).

Подходящие методы выделения, методы очистки и методы разделения стереоизомеров соединений общей формулы (I) представляют собой методы, общеизвестные специалисту в данной области техники из аналогичных случаев, например, с помощью физических процессов, таких как кристаллизация, хроматографические методы, в частности, колоночная хроматография и ВЭЖХ (жидкостная хроматография высокого давления), перегонка, необязательно при пониженном давлении, экстракция и другие методы, любые оставшиеся смеси

обычно можно разделить хроматографическим разделением, например, на хиральные твердые фазы. Для препаративных количеств или в промышленном масштабе пригодны такие способы, как кристаллизация, например, диастереомерных солей, которые можно получить из смесей диастереомеров с использованием оптически активных кислот и, при необходимости, при наличии кислотных групп, с использованием оптически активных оснований.

Синтез замещенных 1,2,4-тиадиазолилникотинамидов общей формулы (I)

Замещенные 1,2,4-тиадиазолилникотинамиды общей формулы (I) в соответствии с изобретением могут быть получены известными способами.

Используемые и исследованные пути синтеза основаны на коммерчески доступных или легко синтезируемых замещенных 1,2,4-тиадиазолах или их солях (например, гидрохлориде или дигидрохлориде) и замещенных карбоновых кислотах. В следующих схемах группы R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 и W общей формулы (I) имеют значения, определенные выше, если не даны примерные, но не ограничивающие определения. Первый путь синтеза замещенных 1,2,4-тиадиазолилникотинамидов общей формулы (I) протекает через необязательно замещенный аминотиадиазол (II) или его соль и необязательно замещенную карбоновую кислоту (III) (схема 1). С этой целью замещенный аминотиадиазол подвергают взаимодействию с замещенной карбоновой кислотой в присутствии подходящего реагента сочетания (например, тионилхлорида) и подходящего основания (например, 1-метил-1H-имидазол) с получением целевых 1,2,4-тиадиазолилникотинамидов (I) (см. US 2019/0233382). Альтернативно можно использовать соль аминотиадиазола, при этом в реакционной смеси образуется свободный амин. Существует множество реагентов для связывания амидов и оснований, которые можно использовать для проведения этой реакции (см. Chem. Soc. Rev., 2009, 38, 606-631). Другие подходящие реагенты для сочетания амидов включают в себя, помимо прочего, оксалилхлорид, ТЗР (ангидрид пропанфосфоновой кислоты), DIC (1,3-диизопропилкарбодиимид) и HATU (1-[бис(диметиламино)метилен]-1H-1,2,3-триазоло[4,5-b]пиридиний-3-оксид-гексафторфосфат) и другие подходящие основания включают в себя, помимо прочего, триэтиламин, DIPEA (N,N-диизопропил-этиламин) и пиридин. На схеме 1 ниже R^1 , R^2 , R^3 , R^4 и R^5 имеют значения, определенные выше и W = кислород.

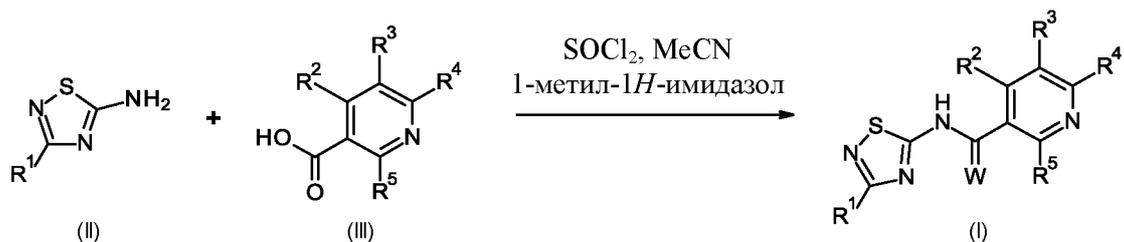
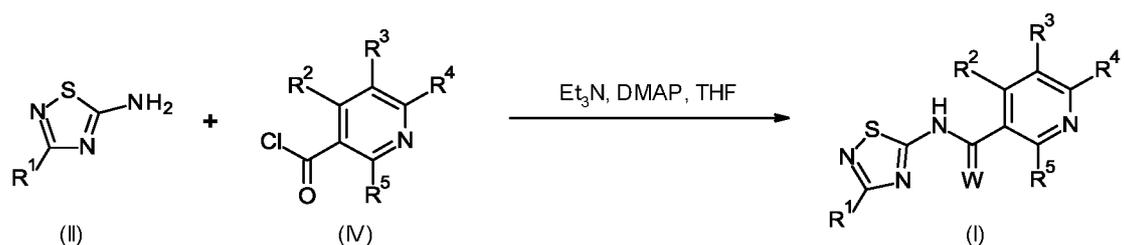


Схема 1.

5 Синтез замещенных 1,2,4-тиадиазолилникотинамидов общей формулы (I) альтернативно может быть завершен путем прямого амидного сочетания
 10 обязательно замещенного хлорангидрида (IV) с обязательно замещенным 1,2,4-тиадиазолом (II) (Схема 2). По этому методу хлорангидрид (IV),
 предварительно полученный из соответствующей карбоновой кислоты (III) с
 15 использованием хлорирующего реагента (например, оксалилхлорида с каталитическими количествами ДМФА = N,N-диметилформамид), подвергают реакции с 1,2,4-тиадиазолом (II) в присутствии основания (например, триэтиламина) и подходящего растворителя (например, ТГФ = тетрагидрофуран) с получением 1,2,4-тиадиазолилникотинамида (I). Для этого превращения можно
 20 использовать широкий спектр реагентов (см. Chem. Soc. Rev., 2009, 38, 606-631), а также использовать подходящий катализатор (например, DMAP = 4-диметиламинопиридин). На схеме 2 ниже R¹, R², R³, R⁴ и R⁵ имеют значения, определенные выше, и W = кислород.



20

Схема 2.

Синтез замещенных 1,2,4-тиадиазолилникотинамидов общей формулы (I) может быть, кроме того, осуществлен путем прямого амидного сочетания
 25 замещенного 1,2,4-тиадиазола (II) с обязательно замещенным сложным эфиром (V) (Схема 3). Для протекания этих реакций необходимы

соответствующий реагент (например, триметилалюминий) и подходящий растворитель (например, дихлорметан или толуол) (см. Chem. Commun., 2008, 1100-1102). Это превращение также можно осуществить с использованием множества других реагентов, известных из литературных источников (см. Tetrahedron Lett., 2006, 47, 5767-5769). На схеме 3 ниже, R¹, R², R³, R⁴ и R⁵ имеют значения, определенные выше, и W = кислород.

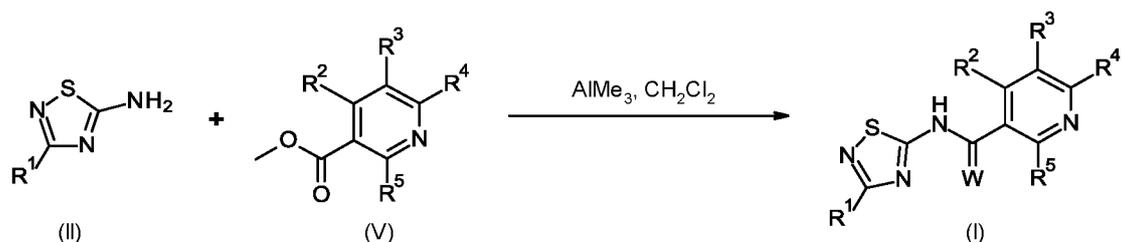


Схема 3.

10

Синтез замещенных 1,2,4-тиадиазолилникотинамидов общей формулы (I) также можно осуществить путем независимого получения необязательно замещенной карбоновой кислоты и последующего проведения ключевого амидного сочетания с замещенным 1,2,4-тиадиазолом. Следуя этому способу (схема 4), метиловый эфир (VI) связывают с замещенной бороновой кислотой (VII) в реакции перекрестного сочетания Сузуки-Мияуры с использованием подходящего комплекса палладия (например, Pd(dppf)Cl₂), подходящего основания (например, карбонат калия) и подходящего апротонного растворителя (например, толуол, 1,4-диоксан или DME = диметоксиэтан) в присутствии воды с получением замещенного сложного эфира (V) (см. WO 2015/123133). В таких реакциях перекрестного сочетания также можно использовать другие эквиваленты бороновой кислоты, такие как соответствующие сложные пинаколовые эфиры или соли трифторбората. Гидролиз сложного эфира подходящим основанием (например, гидроксидом натрия) затем дает карбоновую кислоту (III), которую подвергают взаимодействию с 1,2,4-тиадиазолом (II) с использованием ранее описанных методов (схемы 1 и 2) с получением целевых 1,2,4-тиадиазолилникотинамидов общей формулы (I).

15

20

25

На схеме 4 ниже R², R³, R⁴ и R⁵ имеют значения, определенные выше и X = галоген.

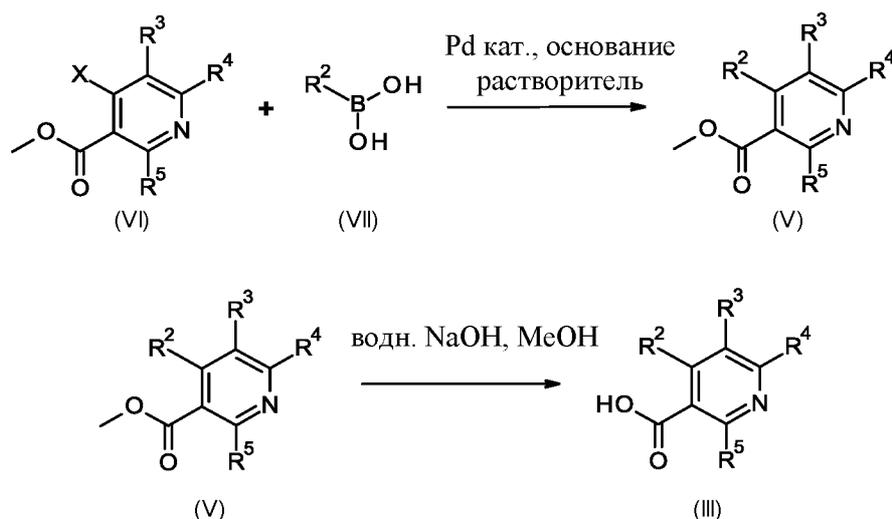
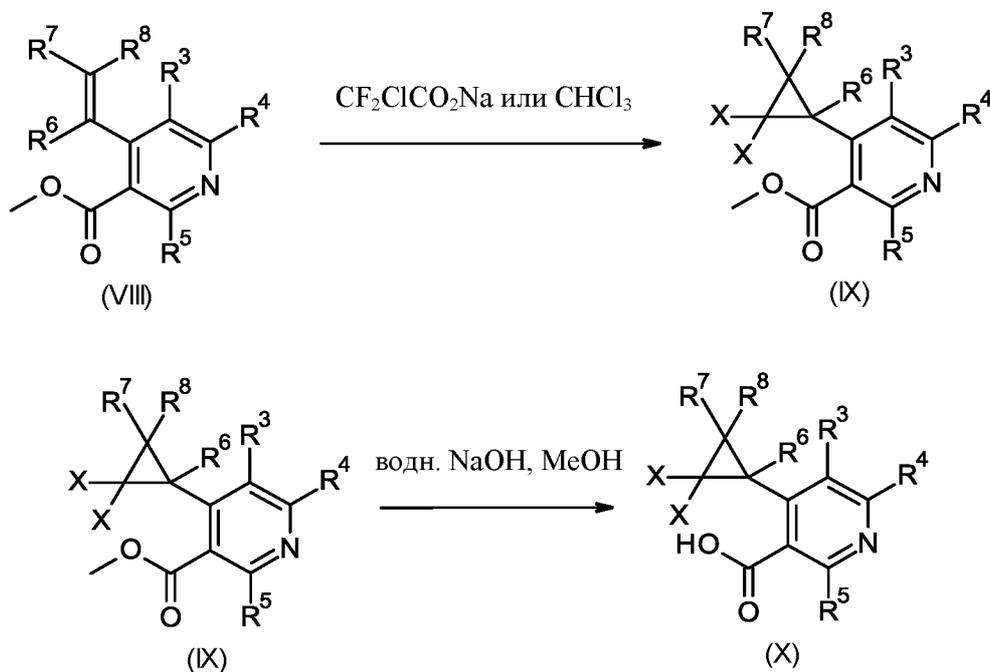


Схема 4.

Синтез замещенных 1,2,4-тиадиазолилникотинамидов общей формулы (I) может быть, кроме того, завершен с использованием других известных реакций перекрестного сочетания для получения необязательно замещенных карбоновых кислот, необходимых для конечной реакции сочетания амида. Такие примеры включают, помимо прочего, реакцию Хека (см. J. Org. Chem., 2011, 76, 8036-8041), перекрестного сочетания Хиямы (см. J. Am. Chem. Soc., 2003, 125, 5616-5617), перекрестного сочетания Стилле (см. Angew. Chem. Int. Ed., 2004, 43, 1132-1136) и перекрестного сочетания Негиши (см. J. Am. Chem. Soc., 2004, 126, 13028-13032).

Алкенилзамещенные фениловые эфиры (VIII) также могут быть дополнительно преобразованы для получения карбоновых кислот, несущих замещенные циклопропильные заместители, которые могут быть использованы для синтеза замещенных 1,2,4-тиадиазолилникотинамидов общей формулы (I). С этой целью (схема 5) алкенилзамещенный фениловый эфир (VIII) подвергают взаимодействию с подходящим реагентом (например, хлордифторацетатом натрия или хлороформом) в присутствии подходящего растворителя (например, ТГФ = тетрагидрофуран) с получением геминально-дигалогенированного циклопропилфенилового эфира (IX) (см. Beilstein J. Org. Chem., 2021, 17, 245-272). Гидролиз сложного эфира подходящим основанием (например, гидроксидом натрия) затем дает карбоновую кислоту (X), которую подвергают взаимодействию с 1,2,4-тиадиазолом (II) с использованием ранее описанных методов (схемы 1, 2 и 3) с получением целевых 1,2,4-тиадиазолилникотинамидов

общей формулы (I). На схеме 5 ниже R^3 , R^4 и R^5 имеют значения, определенные выше, и $X =$ фтор или хлор. R^6 , R^7 и R^8 в качестве примера, а не ограничения, представляют собой водород.



5

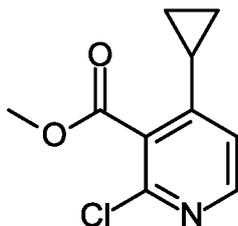
Схема 5.

Ниже приведены избранные подробные примеры синтеза соединений общей формулы (I) в соответствии с изобретением. Упомянутые номера примеров соответствуют схеме нумерации на схемах 1 - 5 и в таблице 1. Данные спектроскопии 1H ЯМР, представленные для химических примеров, описанных в последующих разделах, были получены на приборах Bruker при 600 МГц, 400 МГц или 300 МГц с использованием $CDCl_3$ или d_6 -ДМСО в качестве растворителя с тетраметилсиланом ($\delta = 0.00$ част. на млн.) в качестве внутреннего стандарта. Перечисленные сигналы имеют значения, указанные ниже: br = широкий; s = синглет, d = дублет, t = триплет, dd = дублет дублетов, ddd = дублет дублета дублетов, m = мультиплет, q = квартет, qu = квинтет, sext = секстет, sept = септет, dq = дублет квартетов, dt = дублет триплетов.

20

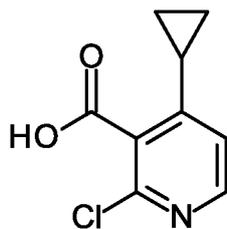
Примеры синтеза

№ Va: Метил 2-хлор-4-циклопропил-пиридин-3-карбоксилат



К перемешиваемой смеси метил 2-хлор-4-йодоникотината (520 мг, 1,74 ммоль, 1,0 экв.) в смеси 1,4-диоксана (18 мл) и воды (6 мл) при КТ добавляли циклопропилбороновую кислоту (150 мг, 1,74 ммоль, 1,0 экв.), K_2CO_3 (483 мг, 3,49 ммоль, 2,0 экв.) и $Pd(dppf)Cl_2$ (128 мг, 0,17 ммоль, 0,10 экв.). Полученную смесь перемешивали при 90 °С в течение 40 ч. Реакционную смесь охлаждали до КТ и фильтровали через подушку из целита, промывали посредством EtOAc. Промывные воды разбавляли водой (10 мл) и экстрагировали EtOAc (3 × 15 мл). Объединенные органические экстракты сушили над безводным $MgSO_4$, фильтровали и концентрировали при пониженном давлении. Полученный остаток очищали методом флэш-хроматографии на колонке с силикагелем, элюируя *n*-гептаном/EtOAc (100:0 → 70:30) с получением соединения Va (114 мг, 30 % выход) в виде бесцветного масла. 1H -ЯМР (400 МГц, $CDCl_3$): δ_H 8.26 (d, $J = 8.0$ Гц, 1H), 6.71 (d, $J = 8.0$ Гц, 1H), 3.99 (s, 3H), 1.90-1.82 (m, 1H), 1.15-1.11 (m, 2H), 0.86-0.83 (m, 2H).

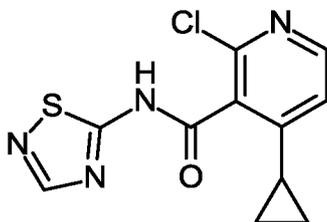
№ IIIa: 2-Хлор-4-циклопропил-пиридин-3-карбоновая кислота



К перемешиваемому раствору соединения Va (113 мг, 0,53 ммоль, 1,0 экв.) в MeOH (4 мл) при КТ добавляли 6 М водн. раствор NaOH (1.78 мл, 10,7 ммоль, 20 экв.). Полученную смесь перемешивали при 50 °С в течение 7 ч. Реакционную смесь охлаждали до КТ и MeOH удаляли при пониженном давлении. Водную фазу подкисляли до pH 1-2 и экстрагировали посредством EtOAc (5 × 10 мл). Объединенные органические экстракты сушили над безводным Na_2SO_4 , фильтровали и концентрировали при пониженном давлении с получением соединения IIIa (113 мг, >99 % выход) в виде твердого вещества белого цвета.

^1H -ЯМР (400 МГц, DMSO- d_6): δ_{H} 8.27 (d, $J = 8.0$ Гц, 1H), 6.97 (d, $J = 8.0$ Гц, 1H), 1.88-1.82 (m, 1H), 1.17-1.10 (m, 2H), 0.91-0.87 (m, 2H).

№ I-003: 2-Хлор-4-циклопропил-N-(1,2,4-тиадиазол-5-ил)пиридин-3-карбоксамид

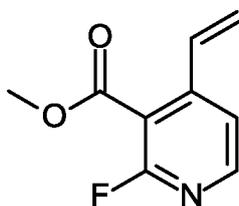


5

К перемешиваемой суспензии соединения IIIa (69 мг, 0,34 ммоль, 1,0 экв.) гидрохлорида и 1,2,4-тиадиазол-5-амина (53 мг, 0,38 ммоль, 1.1 экв.) в MeCN (2 мл) при КТ добавляли 1-метил-1H-имидазол (0,13 мл, 1,67 ммоль, 4,8 экв.). Полученную смесь перемешивали в течение 10 мин., добавляли тионилхлорид (41 мкл, 0,55 ммоль, 1,6 экв.) и реакционную смесь нагревали до 80 °С в течение 16 ч. Реакционную смесь разбавляли водой (5 мл), экстрагировали посредством CH_2Cl_2 (5 мл) и органический экстракт концентрировали при пониженном давлении. Полученный остаток очищали методом флэш-хроматографии на колонке с силикагелем, элюируя *n*-гептаном/EtOAc (100:0 \rightarrow 50:50) с получением соединения I-003 (27 мг, 27 % выход) в виде твердого вещества белого цвета. ^1H -ЯМР (400 МГц, DMSO- d_6): δ_{H} 8.58 (s, 1H), 8.38 (d, $J = 8.0$ Гц, 1H), 7.06 (d, $J = 8.0$ Гц, 1H), 1.75-1.70 (m, 1H), 1.13-1.08 (m, 2H), 0.94-0.90 (m, 2H).

15

№ VIIa: Метил 2-фтор-4-винил-пиридин-3-карбоксилат



20

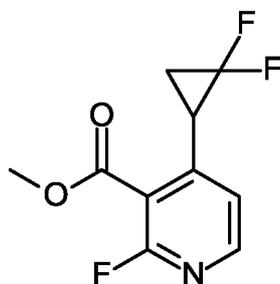
К перемешиваемому раствору метил 2-фтор-4-йодоникотинат (200 мг, 0,71 ммоль, 1,0 экв.) в смеси 1,4-диоксана и воды (6 мл, 3:1) при КТ в атмосфере аргона добавляли K_2CO_3 (196.7 мг, 1,42 ммоль, 2.0 экв.), сложный пинаколовый эфир винилбороновой кислоты (0,12 мл, 0,71 ммоль, 1,0 экв.) и дихлорид [1,1'-бис(дифенилфосфино)ферроцен]палладия(II) (58 мг, 0,07 ммоль, 0,10 экв.). Полученную смесь нагревали до 90 °С в течение 4 ч. и затем оставляли

25

охлаждаться до КТ. Реакционную смесь разбавляли посредством CH_2Cl_2 (10 мл) и водой (10 мл), фазы разделяли. Водную фазу экстрагировали посредством CH_2Cl_2 (3×15 мл) и объединенные органические экстракты сушили над безводным Na_2SO_4 , фильтровали и концентрировали при пониженном давлении.

5 Полученный остаток очищали методом флэш-хроматографии на колонке с силикагелем, элюируя *n*-гептаном/ EtOAc (100:0 \rightarrow 90:10) с получением соединения VIIIa (75 мг, выход 57 %). в виде прозрачного бесцветного масла. ^1H ЯМР (400 МГц, CDCl_3): δ_{H} 8.23 (d, $J = 4.0$ Гц, 1H), 7.38 (d, $J = 4.0$ Гц, 1H), 6.94 (dd, $J = 20.0, 12.0$ Гц, 1H), 5.97 (d, $J = 20.0$ Гц, 1H), 5.63 (d, $J = 12.0$ Гц, 1H), 3.97
10 (s, 3H).

№ IXa: Метил 4-(2,2-дифторциклопропил)-2-фтор-пиридин-3-карбоксилат

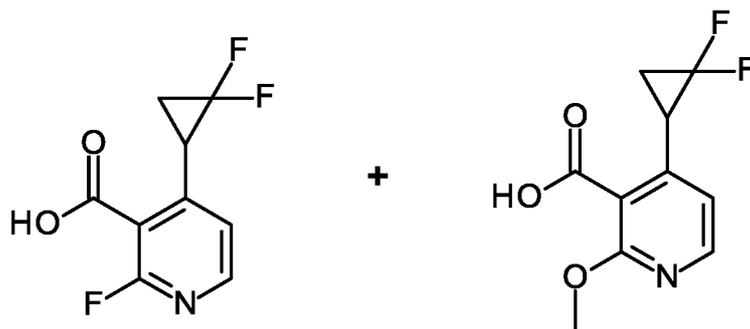


К перемешиваемому раствору соединения VIIIa (321 мг, 1,77 ммоль, 1,0 экв.) в THF (5 мл) при КТ в атмосфере аргона добавляли NaI (93 мг, 0.62 ммоль,
15 0,35 экв.). Полученную смесь нагревали с обратным холодильником и добавляли (трифторметил)триметилсилан (0,92 мл, 6,21 ммоль, 3,5 экв.) 12 порциями в течение 12 ч. Реакционную смесь концентрировали при пониженном давлении и полученный остаток разбавляли с CH_2Cl_2 (10 мл) и водой (10 мл). Водный слой отделяли и экстрагировали посредством CH_2Cl_2 (4×10 мл). Объединенные
20 органические экстракты сушили над безводным Na_2SO_4 , фильтровали и концентрировали при пониженном давлении. Полученный остаток очищали методом флэш-хроматографии на колонке с силикагелем, элюируя *n*-гептаном/ EtOAc (100:0 \rightarrow 50:50) с получением соединения IXa (307 мг, выход 73 %) в виде масла желтого цвета. ^1H -ЯМР (400 МГц, CDCl_3): δ_{H} 8.27 (dd, $J = 5.3, 0.8$ Гц, 1H), 7.08 (dd, $J = 5.3, 0.8$ Гц, 1H), 3.99 (s, 3H), 3.06 (ddd, $J = 12.5, 11.6, 8.4$ Гц, 1H), 1.98 (tdd, $J = 11.5, 8.4, 5.3$ Гц, 1H), 1.68 (dtd, $J = 12.9, 8.4, 3.6$ Гц, 1H).
25

№ Xa: 4-(2,2-дифторциклопропил)-2-фтор-пиридин-3-карбоновая кислота

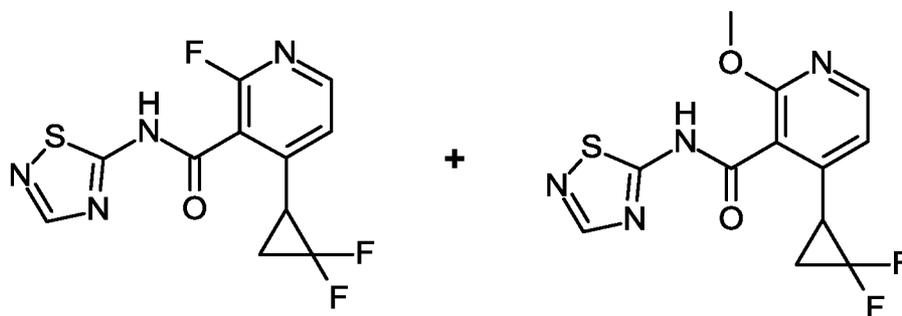
и

№ Xb: 4-(2,2-дифторциклопропил)-2-метокси-пиридин-3-карбоновая кислота



К перемешиваемому раствору соединения IXa (306 мг, 1,32 ммоль, 1,0 экв.)
5 в MeOH (10 мл) при КТ добавляли 6 М водный раствор NaOH (4,41 мл, 26,4 ммоль, 20 экв.). Полученную смесь перемешивали при КТ в течение 3 ч. Реакционную смесь концентрировали при пониженном давлении и полученный остаток разбавляли водой. Смесь подкисляли до pH 1-2 и экстрагировали посредством CH₂Cl₂ (3 × 30 мл). Объединенные органические экстракты сушили над безводным Na₂SO₄, фильтровали и концентрировали при пониженном давлении. Полученный остаток очищали методом флэш-хроматографии на колонке с силикагелем, элюируя *n*-гептаном/EtOAc (100:0 → 50:50) с получением соединений Xa и Xb (162 мг, выход 56 %) в виде неразделяемой смеси. Смесь использовали непосредственно на следующей стадии без
10 дополнительной очистки.
15

№ I-002: 4-(2,2-Дифторциклопропил)-2-фтор-N-(1,2,4-тиадиазол-5-ил)пиридин-3-карбоксамид и № I-001: 4-(2,2-дифторциклопропил)-2-метокси-N-(1,2,4-тиадиазол-5-ил)пиридин-3-карбоксамид

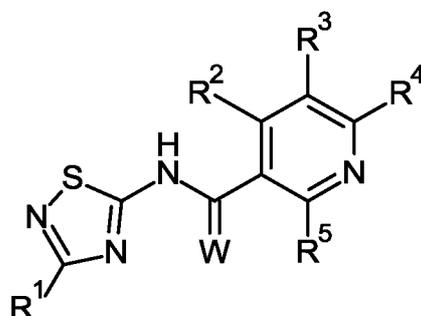


20 К перемешиваемой суспензии смеси соединений Xa и Xb (60 мг, 0,27 ммоль, 1.0 экв.) и 1,2,4-тиадиазол-5-амина (42 мг, 0,30 ммоль, 1,1 экв.) в MeCN (2 мл) при КТ добавляли 1-метил-1H-имидазол (109 мг, 1,33 ммоль, 4,8 экв.).

Полученную смесь перемешивали в течение 5 мин., добавляли тионилхлорид (53 мг, 0,44 ммоль, 1,6 экв.) и реакционную смесь перемешивали при КТ в течение 6 ч. Реакционную смесь разбавляли с CH₂Cl₂ (5 мл) и водой (5 мл). Органическую фазу отделяли с использованием картриджа разделения фаз и органическую фазу концентрировали при пониженном давлении. Полученный остаток очищали посредством обращенно-фазовой ВЭЖХ с получением соединения I-002 (52 мг, выход 24 %) в виде твердого вещества белого цвета и соединения I-001 (44 мг, выход 20 %) в виде твердого вещества белого цвета.

По аналогии с примерами получения, приведенными выше и изложенными в соответствующем месте, и с учетом общих деталей получения замещенных 1,2,4-тиадиазолилникотинамидов получают указанные ниже соединения.

Таблица 1: Примеры предпочтительных соединений общей формулы (I)



(I)

15

№ Пр.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	W
I-001	H	2,2-дифторциклопропил	H	H	OMe	O
I-002	H	2,2-дифторциклопропил	H	H	F	O
I-003	H	циклопропил	H	H	Cl	O
I-004	H	2-метилциклопропил	H	H	Cl	O
I-005	H	циклопропил	H	H	F	O
I-006	H	циклопропил	H	H	CF ₃	O
I-007	H	циклопропил	H	H	OMe	O
I-008	H	циклопропил	H	H	H	O
I-009	H	проп-1-ен-2-ил	H	H	Cl	O
I-010	Br	циклопропил	H	H	Cl	O
I-011	Me	циклопропил	H	H	Cl	O
I-012	H	циклопропил	H	H	циклопропил	O
I-013	Cl	циклопропил	H	H	Cl	O
I-014	Et	циклопропил	H	H	Cl	O
I-015	t-Bu	циклопропил	H	H	Cl	O

Спектроскопические данные избранных примеров таблиц:

Спектроскопические данные, перечисленные ниже для выбранных примеров таблиц, оценивали с помощью традиционной интерпретации ^1H -ЯМР или с помощью методов списка пиков ЯМР.

а) Традиционная интерпретация ^1H -ЯМР

№ I-001: ^1H -ЯМР (400 МГц, DMSO- d_6): δ_{H} 13.51 (br s, 1H), 8.54 (s, 1H), 8.32-8.29 (m, 1H), 7.02-6.99 (m, 1H), 3.91 (s, 3H), 2.97-2.91 (m, 1H), 2.11-2.04 (m, 2H).

№ I-002: ^1H -ЯМР (400 МГц, DMSO- d_6): δ_{H} 13.88 (br s, 1H), 8.60 (s, 1H), 8.44-8.41 (m, 1H), 7.44-7.41 (m, 1H), 3.21-3.11 (m, 1H), 2.26-2.10 (m, 2H).

б) Метод списка пиков ЯМР

Данные ^1H -ЯМР выбранных примеров записаны в виде списков пиков ^1H -ЯМР. Для каждого пика сигнала указано значение δ в част. на млн. и интенсивность сигнала в круглых скобках. Между парами «значение δ – интенсивность сигнала в качестве разделителей используют точки с запятой.

Таким образом, список пиков примера имеет форму:

δ_1 (интенсивность $_1$); δ_2 (интенсивность $_2$);; δ_i (интенсивность $_i$);; δ_n (интенсивность $_n$)

Интенсивность резких сигналов коррелирует с высотой сигналов в печатном примере спектра ЯМР в см и показывает реальные соотношения интенсивностей сигналов. Из широких сигналов можно показать несколько пиков или середину сигнала и их относительную интенсивность по сравнению с наиболее интенсивным сигналом в спектре.

Для калибровки химического сдвига спектров ^1H используют тетраметилсилан и/или химический сдвиг используемого растворителя, особенно в случае спектров, измеренных в ДМСО. Поэтому в списках пиков ЯМР пик тетраметилсилана может встречаться, но не обязательно.

Списки пиков ^1H -ЯМР аналогичны классическим отпечаткам ^1H -ЯМР и поэтому обычно содержат все пики, которые перечислены при классической интерпретации ЯМР.

Кроме того, они могут демонстрировать как классические отпечатки ^1H -ЯМР сигналов растворителей, стереоизомеры целевых соединений, которые также являются объектом изобретения, и/или пики примесей.

Чтобы показать сигналы соединений в дельта-диапазоне растворителей и/или воды, в наших списках пиков ^1H -ЯМР показаны обычные пики растворителей, например пики ДМСО в ДМСО- d_6 и пик воды, которые обычно имеют в среднем высокую интенсивность.

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

10 Такие стереоизомеры и/или примеси могут быть типичными для конкретного процесса получения. Поэтому их пики могут помочь распознать воспроизведение нашего процесса приготовления по «побочным продуктам-отпечаткам пальцев».

15 Эксперт, который рассчитывает пики целевых соединений с помощью известных методов (MestresC, ACD моделирование, а также с эмпирически оцененными ожидаемыми значениями), может при необходимости выделить пики целевых соединений, при необходимости используя дополнительные фильтры интенсивности. Такое выделение будет аналогично выделению соответствующих пиков при классической интерпретации ^1H -ЯМР.

20 Более подробную информацию об описании данных ЯМР со списками пиков можно найти в публикации «Citation of NMR Peaklist Data within Patent Applications» номера базы данных раскрытия информации об исследованиях 564025.

I-003: ^1H -ЯМР (400.6 МГц, CDCl_3): δ = 12.7494 (0.8); 8.7900 (0.8); 8.6731 (0.6); 8.6661 (0.5); 8.6611 (0.5); 8.4462 (14.3); 8.4328 (14.7); 8.2439 (0.7); 8.2253 (0.7); 7.9472 (0.6); 7.6072 (12.5); 7.5302 (0.7); 7.5196 (1.0); 7.5110 (0.6); 7.4990 (0.6); 7.2612 (161.9); 6.9976 (0.9); 6.8204 (16.0); 6.8070 (15.8); 6.4857 (0.6); 4.2552 (0.8); 3.9748 (4.1); 3.4530 (1.5); 3.2754 (0.7); 2.0452 (0.7); 1.9168 (1.4); 1.9042 (2.9); 1.8959 (3.2); 1.8835 (6.0); 1.8710 (3.4); 1.8628 (3.4); 1.8503 (1.7); 1.6679 (0.7); 1.2593 (0.6); 1.1938 (4.0); 1.1810 (9.0); 1.1764 (10.6); 1.1735 (8.3); 1.1639 (6.2); 1.1602 (10.0); 1.1555 (9.4); 1.1432 (4.9); 1.1262 (0.7); 0.8966 (5.0); 0.8842 (13.7); 0.8798 (10.2); 0.8719 (9.6); 0.8672 (13.6); 0.8546 (3.8); 0.8300 (0.6); 0.1566 (0.5); 0.1454 (0.7); 0.0330 (0.5); 0.0080 (5.7); -0.0002 (233.9); -0.0085 (7.1); -0.0266 (0.6); -0.0285 (0.7); -0.1492 (0.8)
--

I-004: ^1H -ЯМР (400.6 МГц, d_6 -DMSO): δ = 13.8225 (2.7); 8.5867 (15.2); 8.3833 (5.2); 8.3700 (5.3); 7.4377 (0.6); 7.0784 (5.1); 7.0649 (5.0); 5.7572 (0.8); 3.3206 (16.0); 2.5251 (1.2); 2.5204 (1.7); 2.5117 (20.2); 2.5072 (44.2); 2.5025 (61.3); 2.4979 (42.8); 2.4934 (18.9); 1.4520 (0.8); 1.4404 (1.7); 1.4298 (1.5); 1.4198 (2.0); 1.4081 (1.1); 1.2348 (0.8); 1.2272 (0.8); 1.2195 (0.9); 1.2159 (0.8); 1.2056 (1.5); 1.1935 (2.6); 1.1814 (3.0); 1.1698 (1.6); 1.1600 (0.8); 1.1476 (0.6); 1.0398 (9.4); 1.0259 (7.8); 0.9446 (1.1); 0.9349 (1.4); 0.9318 (1.3); 0.9239 (1.6); 0.9143 (1.2); 0.9112 (1.3); 0.9001 (0.6); 0.0080 (1.0); -
--

0.0002 (38.3); -0.0086 (1.2)
I-005: ¹ H-ЯМР (400.6 МГц, CDCl ₃): δ = 13.0601 (1.9); 8.2820 (10.9); 8.2685 (11.0); 7.7036 (16.0); 7.2633 (23.6); 6.7795 (8.4); 6.7771 (8.0); 6.7659 (8.3); 6.7635 (7.8); 5.3007 (2.5); 3.9360 (0.7); 2.2736 (1.2); 2.2612 (2.5); 2.2524 (2.9); 2.2404 (5.1); 2.2283 (2.9); 2.2195 (2.7); 2.2073 (1.3); 1.3327 (0.9); 1.2847 (1.3); 1.2617 (4.6); 1.2495 (10.0); 1.2442 (10.0); 1.2286 (9.5); 1.2235 (9.0); 1.2114 (3.9); 1.1948 (0.5); 0.9427 (4.2); 0.9306 (12.4); 0.9259 (10.0); 0.9184 (9.1); 0.9134 (12.2); 0.9008 (3.3); 0.8790 (0.6); 0.0079 (1.1); -0.0002 (33.9); -0.0084 (1.2)
I-006: ¹ H-ЯМР (400.6 МГц, CDCl ₃): δ = 12.4874 (0.8); 8.7769 (4.3); 8.7637 (10.0); 8.7506 (10.3); 7.8875 (3.3); 7.5345 (16.0); 7.5191 (1.8); 7.2913 (0.7); 7.2606 (215.4); 7.2366 (0.8); 7.2334 (1.2); 7.0989 (10.9); 7.0857 (10.8); 6.9970 (1.2); 3.4839 (0.7); 3.4687 (0.5); 2.4295 (0.5); 1.9211 (1.3); 1.9088 (2.6); 1.9006 (2.8); 1.8881 (5.3); 1.8755 (3.0); 1.8672 (2.9); 1.8549 (1.6); 1.5713 (3.6); 1.3321 (0.7); 1.2841 (1.0); 1.2553 (2.2); 1.1997 (2.4); 1.1867 (8.5); 1.1824 (10.1); 1.1659 (9.3); 1.1616 (8.9); 1.1493 (2.9); 0.9256 (0.5); 0.8999 (3.7); 0.8874 (10.9); 0.8830 (9.0); 0.8751 (8.3); 0.8705 (10.7); 0.8580 (3.1); 0.1458 (1.0); 0.0305 (0.8); 0.0079 (7.8); -0.0002 (308.4); -0.0085 (8.8); -0.0240 (1.2); -0.0273 (1.9); -0.0340 (0.5); -0.1493 (1.0)
I-007: ¹ H-ЯМР (400.6 МГц, d ₆ -DMSO): δ = 8.5330 (1.6); 8.1423 (0.5); 8.1284 (0.5); 6.5979 (0.6); 6.5840 (0.6); 3.8620 (4.4); 3.3228 (16.0); 2.5108 (3.4); 2.5062 (7.6); 2.5016 (10.7); 2.4970 (7.5); 2.4925 (3.4); -0.0002 (6.6)
I-008: ¹ H-ЯМР (400.6 МГц, d ₆ -DMSO): δ = 13.6616 (1.7); 8.7129 (8.6); 8.7115 (8.9); 8.5676 (16.0); 8.5620 (5.1); 8.5485 (4.9); 7.0212 (4.1); 7.0077 (4.1); 4.0384 (1.2); 4.0206 (1.2); 3.3239 (7.0); 2.5252 (0.8); 2.5205 (1.0); 2.5117 (16.4); 2.5071 (36.9); 2.5025 (52.0); 2.4980 (36.6); 2.4934 (16.7); 2.2705 (0.9); 2.2622 (1.0); 2.2583 (0.7); 2.2498 (1.9); 2.2372 (1.0); 2.2289 (1.0); 1.9894 (5.6); 1.2988 (1.0); 1.2588 (1.5); 1.2340 (1.9); 1.1928 (1.6); 1.1751 (3.4); 1.1573 (1.7); 1.1341 (1.3); 1.1230 (3.5); 1.1169 (3.6); 1.1134 (2.0); 1.1066 (2.0); 1.1021 (3.6); 1.0960 (3.6); 1.0858 (1.5); 0.8947 (1.6); 0.8844 (3.7); 0.8786 (3.8); 0.8721 (3.6); 0.8663 (4.2); 0.8549 (1.4); 0.0080 (1.4); 0.0046 (0.5); -0.0002 (50.4); -0.0059 (0.6); -0.0068 (0.5); -0.0085 (1.5)
I-009: ¹ H-ЯМР (400.6 МГц, d ₆ -DMSO): δ = 13.7338 (0.6); 8.5680 (3.9); 8.5530 (2.3); 8.5401 (2.4); 7.5644 (2.2); 7.5514 (2.3); 5.2659 (0.8); 5.2623 (1.2); 5.2588 (0.8); 5.0613 (1.0); 5.0588 (1.4); 5.0562 (1.0); 3.8933 (0.8); 3.3225 (16.0); 2.5201 (0.5); 2.5114 (7.3); 2.5068 (16.2); 2.5022 (22.9); 2.4976 (15.9); 2.4930 (7.1); 2.0457 (2.8); 2.0434 (4.0); 2.0420 (3.9); 2.0397 (2.8); 0.0080 (0.8); 0.0031 (0.5); 0.0024 (1.0); -0.0002 (29.4); -0.0025 (1.5); -0.0041 (0.7); -0.0085 (0.9)
I-010: ¹ H-ЯМР (400.6 МГц, CDCl ₃): δ = 10.2444 (0.9); 8.3895 (3.8); 8.3762 (3.9); 7.5190 (0.5); 7.2606 (98.2); 6.9970 (0.5); 6.7861 (4.0); 6.7726 (4.0); 4.0484 (1.1); 1.8950 (0.7); 1.8871 (0.8); 1.8744 (1.6); 1.8619 (0.8); 1.8537 (0.8); 1.5586 (16.0); 1.2649 (0.9); 1.2203 (1.2); 1.2076 (2.6); 1.2029 (2.9); 1.2000 (2.2); 1.1905 (1.8); 1.1867 (2.8); 1.1821 (2.5); 1.1699 (1.4); 0.9074 (1.5); 0.8952 (4.0); 0.8906 (3.0); 0.8823 (4.0); 0.8782 (3.8); 0.8653 (1.4); 0.1458 (0.5); 0.0080 (4.2); 0.0058 (1.1); -0.0002 (153.1); -0.0085 (4.2)
I-011: ¹ H-ЯМР (400.6 МГц, CDCl ₃): δ = 8.3714 (2.8); 8.3580 (2.8); 7.2633 (9.4); 6.7548 (3.1); 6.7413 (3.0); 3.8783 (0.6); 2.3618 (1.2); 2.2954 (0.5); 2.2709 (0.7); 2.2042 (16.0); 2.1180 (0.7); 2.0439 (0.5);

<p>1.8929 (0.5); 1.8845 (0.6); 1.8722 (1.1); 1.8598 (0.6); 1.8515 (0.6); 1.2644 (0.9); 1.2580 (0.7); 1.1801 (0.8); 1.1674 (1.8); 1.1627 (2.0); 1.1599 (1.5); 1.1502 (1.2); 1.1466 (1.9); 1.1419 (1.8); 1.1297 (0.9); 0.8989 (0.6); 0.8819 (1.8); 0.8642 (0.7); 0.8549 (0.9); 0.8426 (2.5); 0.8381 (1.9); 0.8303 (1.8); 0.8256 (2.5); 0.8130 (0.7); - 0.0002 (14.2)</p>
<p>I-012: ¹H-ЯМР (400.6 МГц, d₆-DMSO): δ= 13.7689 (1.6); 8.5649 (1.0); 8.5586 (16.0); 8.3750 (4.7); 8.3616 (4.9); 6.7943 (4.6); 6.7808 (4.6); 2.5627 (0.6); 2.5488 (1.4); 2.5349 (0.8); 2.5250 (1.2); 2.5203 (1.7); 2.5115 (26.6); 2.5070 (58.7); 2.5024 (82.8); 2.4978 (59.0); 2.4933 (27.3); 1.8185 (0.9); 1.8104 (1.0); 1.7990 (1.9); 1.7870 (1.1); 1.7789 (1.0); 1.7670 (0.5); 1.7085 (0.8); 1.7001 (1.0); 1.6879 (1.8); 1.6756 (1.1); 1.6673 (1.0); 1.0495 (1.1); 1.0383 (3.1); 1.0322 (3.5); 1.0219 (2.2); 1.0177 (3.9); 1.0114 (3.9); 1.0074 (3.2); 1.0010 (5.4); 0.9950 (3.2); 0.9892 (3.6); 0.9823 (1.9); 0.9660 (0.5); 0.9606 (0.6); 0.9518 (1.5); 0.9449 (3.7); 0.9379 (2.0); 0.9320 (2.2); 0.9250 (3.4); 0.9177 (2.0); 0.9128 (1.0); 0.9073 (0.8); 0.8509 (1.4); 0.8405 (3.4); 0.8348 (3.4); 0.8285 (3.3); 0.8228 (3.8); 0.8113 (1.1); 0.0080 (1.8); -0.0002 (66.6); -0.0085 (2.2)</p>
<p>I-013: ¹H-ЯМР (400.6 МГц, CDCl₃): δ= 11.5633 (1.0); 8.3815 (5.9); 8.3681 (6.0); 7.2627 (21.2); 6.7944 (6.8); 6.7809 (6.7); 5.3010 (16.0); 2.0428 (1.2); 1.9121 (0.5); 1.8997 (1.2); 1.8913 (1.3); 1.8875 (0.9); 1.8790 (2.6); 1.8705 (0.9); 1.8665 (1.4); 1.8582 (1.4); 1.8457 (0.7); 1.6338 (3.6); 1.2566 (1.2); 1.2033 (1.7); 1.1906 (4.0); 1.1859 (4.5); 1.1831 (3.5); 1.1735 (2.6); 1.1698 (4.2); 1.1651 (4.0); 1.1529 (2.0); 0.8945 (2.1); 0.8822 (5.8); 0.8777 (4.4); 0.8698 (4.1); 0.8651 (5.8); 0.8526 (1.6); 0.0080 (0.8); -0.0002 (27.8); -0.0085 (0.8)</p>
<p>I-014: ¹H-ЯМР (400.6 МГц, CDCl₃): δ= 8.3673 (3.2); 8.3539 (3.3); 7.5190 (0.8); 7.2606 (148.2); 7.2352 (0.6); 7.2228 (0.5); 6.9969 (0.8); 6.7563 (3.6); 6.7429 (3.6); 2.8216 (1.8); 2.8026 (6.0); 2.7838 (6.1); 2.7649 (2.0); 2.3378 (1.1); 1.9161 (0.6); 1.9081 (0.7); 1.8957 (1.4); 1.8829 (0.7); 1.8749 (0.7); 1.5522 (8.5); 1.3629 (7.4); 1.3440 (16.0); 1.3251 (7.4); 1.3068 (0.5); 1.2646 (1.0); 1.2149 (1.0); 1.2022 (2.1); 1.1975 (2.5); 1.1945 (1.9); 1.1851 (1.4); 1.1813 (2.4); 1.1767 (2.2); 1.1644 (1.2); 0.8995 (1.6); 0.8873 (3.3); 0.8822 (4.2); 0.8750 (2.4); 0.8703 (3.2); 0.8644 (1.0); 0.8578 (0.9); 0.0080 (4.3); 0.0057 (0.8); 0.0049 (0.8); -0.0002 (171.0); -0.0085 (5.0); -0.0256 (0.8); -0.0380 (0.6); - 0.1496 (0.5)</p>
<p>I-015: ¹H-ЯМР (400.6 МГц, CDCl₃): δ= 8.3619 (0.8); 8.3486 (0.8); 7.2606 (27.5); 6.7496 (0.8); 6.7363 (0.8); 1.5693 (2.2); 1.4145 (16.0); 1.3576 (11.6); 1.2209 (0.6); 1.2157 (0.6); 1.2001 (0.7); 0.9071 (0.8); 0.9017 (0.8); 0.8952 (0.7); 0.8897 (0.9); 0.8827 (0.6); 0.0079 (1.8); -0.0002 (40.6); - 0.0068 (1.2)</p>

Настоящее изобретение, кроме того, обеспечивает применение одного или нескольких соединений общей формулы (I), их солей или N-оксидов, как определено выше, предпочтительно в одном из вариантов осуществления, определенных как предпочтительные или особенно предпочтительные, в частности, одного или нескольких соединений формул (I-001) - (I-015), их солей или N-оксидов, в каждом случае, как определено выше, в качестве гербицида

и/или регулятора роста растений, предпочтительно в посевах полезных растений и/или декоративных растений.

Настоящее изобретение, кроме того, обеспечивает способ борьбы с вредными растениями и/или регулирования роста растений, отличающийся тем, что эффективное количество

- одного или нескольких соединений общей формулы (I), их солей или N-оксидов, как определено выше, предпочтительно в одном из вариантов осуществления, определенных как предпочтительные или особенно предпочтительные, в частности одного или нескольких соединений формул (I-001) - (I-015), их солей или N-оксидов, в каждом случае как определено выше, или

- композиции в соответствии с изобретением, как определено ниже, наносят на (вредные) растения, семена (вредных) растений, почву, в которой или на которой растут (вредные) растения или возделываемую площадь.

Настоящее изобретение также предлагает способ борьбы с нежелательными растениями, предпочтительно в посевах полезных растений, отличающийся тем, что эффективное количество

- одного или нескольких соединений общей формулы (I), их солей или N-оксидов, как определено выше, предпочтительно в одном из вариантов осуществления, определенных как предпочтительные или особенно предпочтительные, в частности одного или нескольких соединений формул (I-001) - (I-015), их солей или N-оксидов, в каждом случае как определено выше, или

- композиции в соответствии с изобретением, как определено ниже, наносят на нежелательные растения (например, вредные растения, такие как одно- или двудольные сорняки или нежелательные сельскохозяйственные растения), семена нежелательных растений (т.е. семена растений, например, зерна, семена или органы вегетативного размножения, такие как клубни или части побегов с почками), почву, в которой или на которой растут нежелательные растения (например, почва сельскохозяйственных угодий или непахотных земель) или возделываемую площадь (т. е. площадь, на которой будут расти нежелательные растения).

Настоящее изобретение, кроме того, предлагает способы регулирования роста растений, предпочтительно полезных растений, отличающиеся тем, что эффективное количество

5 - одного или нескольких соединений общей формулы (I), их солей или N-оксидов, как определено выше, предпочтительно в одном из вариантов осуществления, определенных как предпочтительные или особенно предпочтительные, в частности одного или нескольких соединений формул (I-001) - (I-015), их солей или N-оксидов, в каждом случае как определено выше, или

10 - композиции в соответствии с изобретением, как определено ниже, наносят на растения, семена растений (т.е. семена растений, например, зерна, семена или органы вегетативного размножения, такие как клубни или части побегов с почками), почву, в которой или на которой растут растения (например, почва сельскохозяйственных угодий или непахотных земель) или
15 возделываемую площадь (т. е. площадь, на которой будут расти растения).

В этом контексте соединения в соответствии с изобретением или композиции в соответствии с изобретением можно применять, например, путем предпосевной обработки (при необходимости также путем внесения в почву), довсходовой и/или послевсходовой обработки. Конкретные примеры некоторых
20 представителей флоры однодольных и двудольных сорняков, с которыми можно бороться с помощью соединений в соответствии с изобретением, являются следующими, хотя нет намерения ограничивать перечисление конкретными видами.

В соответствии с изобретением в способе борьбы с вредными растениями или для регулирования роста растений предпочтительно используют одно или
25 несколько соединений общей формулы (I), их соли или N-оксиды для борьбы с вредными растениями или для регулирования роста в посевах полезных растений или декоративных растений, при этом в предпочтительном варианте осуществления полезные растения или декоративные растения представляют
30 собой трансгенные растения.

Соединения общей формулы (I) согласно изобретению и/или их соли и N-оксиды пригодны для борьбы со следующими родами однодольных и двудольных вредных растений:

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

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

Когда соединения в соответствии с изобретением наносят на поверхность
почвы до прорастания вредных растений (сорных трав и/или широколистных
сорняков) (довсходовый метод), то всходы сорных трав или широколистных
сорняков не могут полностью появиться или растут до стадии семядоли, а затем
20 перестают расти и в конце концов, по прошествии трех-четырёх недель,
полностью погибают.

Если активные соединения наносят после всходов на зеленые части
растений, то после обработки рост прекращается, а вредные растения остаются
на стадии роста на момент применения или через определенное время полностью
25 погибают, так что таким образом очень рано и надолго устраняется конкуренция
со стороны сорняков, вредная для сельскохозяйственных растений.

Хотя соединения в соответствии с изобретением проявляют
исключительную гербицидную активность против однодольных и двудольных
сорняков, сельскохозяйственные растения экономически важных культур,
30 например, двудольные культуры рода *Arachis*, *Beta*, *Brassica*, *Cucumis*, *Cucurbita*,
Helianthus, *Daucus*, *Glycine*, *Gossypium*, *Ipomoea*, *Lactuca*, *Linum*, *Lycopersicon*,
Miscanthus, *Nicotiana*, *Phaseolus*, *Pisum*, *Solanum*, *Vicia*, или однодольные
культуры рода *Allium*, *Ananas*, *Asparagus*, *Avena*, *Hordeum*, *Oryza*, *Panicum*,
Saccharum, *Secale*, *Sorghum*, тритикале, тритикум, *Zea* повреждаются лишь в

незначительной степени или не повреждаются совсем, в зависимости от структуры соответствующего соединения в соответствии с изобретением и норм его применения. По этим причинам данные соединения весьма пригодны для избирательного контроля нежелательного роста растений в

5 сельскохозяйственных культурах, таких как полезные в сельском хозяйстве растения или декоративные растения.

К тому же, соединения в соответствии с изобретением (в зависимости от их конкретной структуры и применяемой нормы внесения) обладают исключительными свойствами регулирования роста сельскохозяйственных растений. Они вмешиваются в собственный метаболизм растений с регулирующим эффектом и, таким образом, могут быть использованы для контролируемого воздействия на компоненты растений и для облегчения сбора урожая, например, вызывая высыхание и задержку роста. Кроме того, они также подходят для общего контроля и подавления нежелательного вегетативного

10 роста, не убивая при этом растения. Ингибирование вегетативного роста играет важную роль для многих одно- и двудольных культур, поскольку это может, например, уменьшить или полностью предотвратить полегание.

Благодаря своим гербицидным и регулирующим рост растений свойствам активные соединения также могут быть использованы для борьбы с вредными растениями в посевах генетически модифицированных растений или растений, модифицированных традиционным мутагенезом. В общем, трансгенные растения характеризуются особыми полезными свойствами, например, устойчивостью к определенным пестицидам, в частности, некоторым гербицидам, устойчивостью к болезням растений или возбудителям болезней

20 растений, таким как определенные насекомые или микроорганизмы, такие как грибы, бактерии или вирусы. Другие специфические характеристики относятся, например, к собранному материалу в отношении количества, качества, сохраняемости, состава и конкретных компонентов. Например, известны трансгенные растения с повышенным содержанием крахмала или измененным

25 качеством крахмала или растения с другим составом жирных кислот в собранном материале.

С точки зрения трансгенных культур предпочтительно использовать соединения в соответствии с изобретением и/или их соли и N-оксиды в экономически важных трансгенных культурах полезных растений и

декоративных растений, например зерновых, таких как пшеница, ячмень, рожь, овес, просо, рис и кукуруза или посева сахарной свеклы, хлопчатника, соевых бобов, масличного рапса, картофеля, томатов, гороха и других овощных культур.

5 Предпочтительно применять соединения в соответствии с изобретением в качестве гербицидов для посевов полезных растений, которые устойчивы или стали устойчивыми с помощью рекомбинантных средств к фитотоксическому действию гербицидов.

10 Благодаря своим гербицидным свойствам и свойствам, регулирующим рост растений, активные соединения также можно применять для борьбы с вредными растениями в культурах генетически модифицированных растений, которые известны или которые еще предстоит разработать. В целом, трансгенные растения характеризуются особыми полезными свойствами, например, устойчивостью к определенным пестицидам, в частности, к определенным гербицидам, устойчивостью к болезням растений или патогенам болезней

15 растений, таким как определенные насекомые или микроорганизмы, такие как грибы, бактерии или вирусы. Другие конкретные характеристики относятся, например, к собранному материалу в отношении количества, качества, возможности хранения, состава и конкретных компонентов. Например, известны трансгенные растения с повышенным содержанием крахмала или измененным

20 качеством крахмала, или растения с другим составом жирных кислот в собранном материале. К другим особым свойствам относят устойчивость или резистентность к факторам абиотического стресса, например, к жаре, холоду, засухе, засолённости и ультрафиолетовому излучению.

25 Предпочтение отдают применению соединений общей формулы (I) в соответствии с изобретением и/или их солей и N-оксидов в экономически важных трансгенных культурах полезных растений и декоративных растений, например зерновых, таких как пшеница, ячмень, рожь, овес, тритикале, просо, рис, маниока и кукуруза, а также посевах сахарной свеклы, хлопчатника, соевых бобов, масличного рапса, картофеля, томатов, гороха и других овощных культур.

30 Соединения общей формулы (I) предпочтительно можно использовать в качестве гербицидов для посевов полезных растений, которые устойчивы или стали устойчивыми с помощью рекомбинантных средств к фитотоксическому действию гербицидов.

Обычные способы получения новых растений, свойства которых изменены по сравнению с существующими растениями, заключаются, например, в традиционных методах выращивания и получении мутантов. Альтернативно, новые растения с измененными свойствами можно получить с помощью рекомбинантных методов.

Специалистам в данной области известно большое количество молекулярно-биологических методов, с помощью которых можно создавать новые трансгенные растения с измененными свойствами. Для проведения таких рекомбинантных манипуляций в плазмиды могут быть введены молекулы нуклеиновых кислот, которые обеспечивают мутагенез или изменения последовательности с помощью рекомбинации последовательностей ДНК. С помощью стандартных способов можно, например, выполнять обмены основаниями, удалять частичные последовательности, или добавлять природные или синтетические последовательности. Для соединения фрагментов ДНК друг с другом к фрагментам могут быть добавлены адаптеры или линкеры.

Например, получение растительных клеток со сниженной активностью генного продукта может быть достигнуто путем экспрессии по меньшей мере одной соответствующей антисмысловой РНК, смысловой РНК для достижения эффекта косупрессии или путем экспрессии по меньшей мере одного сконструированного соответствующим образом рибозима, который специфически расщепляет транскрипты вышеупомянутого генного продукта.

С этой целью, во-первых, можно использовать молекулы ДНК, которые охватывают всю кодирующую последовательность генного продукта, включая любые фланкирующие последовательности, которые могут присутствовать, а также молекулы ДНК, которые охватывают только части кодирующей последовательности, и в этом случае необходимо, чтобы эти порции были достаточно длинными, чтобы оказывать антисмысловое действие на клетки. Также возможно использовать последовательности ДНК, которые имеют высокую степень гомологии с кодирующими последовательностями генного продукта, но не полностью им идентичны.

При экспрессии молекул нуклеиновых кислот в растениях синтезированный белок может быть локализован в любом желательном компартменте клетки растения. Тем не менее, чтобы достичь локализации в конкретном компартменте, возможно, например, соединить кодирующую область с

последовательностями ДНК, которые обеспечивают локализацию в конкретном компартменте. Такие последовательности известны специалистам в данной области техники (см., например, Braun и соавт., EMBO J. 11 (1992), 3219-3227).

5 Экспрессия молекул нуклеиновых кислот также может происходить в органеллах клеток растений.

Клетки трансгенных растений могут быть регенерированы в соответствии с известными технологиями, чтобы получить целые растения. В принципе, трансгенные растения могут представлять собой растения любого целевого вида растений, т.е. как однодольных, так и двудольных растений.

10 Таким образом, можно получить трансгенные растения, имеющие измененные свойства вследствие сверхэкспрессии, супрессии или ингибирования гомологичных (= природных) генов или последовательностей генов, или экспрессии гетерологичных (= чужеродных) генов или последовательностей генов.

15 Предпочтительно применять соединения (I) в соответствии с изобретением в трансгенных культурах, которые устойчивы к регуляторам роста, таким как например, дикамба или к гербицидам, которые ингибируют основные растительные ферменты, например, ацетолактатсинтазы (ALS), EPSP синтазы, глутаминсинтазы (GS) или гидроксифенилпируват диоксигеназы (HPPD), или к
20 гербицидам из группы сульфонилмочевин, глифосата, глюфосината или бензоилизоксазолов и аналогичных активных соединений.

При применении активных соединений в соответствии с изобретением в трансгенных культурах проявляются не только эффекты в отношении вредных растений, наблюдаемые в других культурах, но также часто эффекты, которые
25 специфичны для применения в соответствующих трансгенных культурах, например, измененный или специально расширенный спектр сорняков, с которым можно вести борьбу, измененные нормы применения, которые могут быть использованы для применения, предпочтительно хорошая совместимость с гербицидами, по отношению к которым трансгенная культура устойчива, а также
30 влияние на рост и урожайность трансгенных культурных растений.

Изобретение также относится к применению соединений общей формулы (I) в соответствии с изобретением и/или их солей и N-оксидов в качестве гербицидов для борьбы с вредными растениями в посевах полезных растений или декоративных растений, необязательно в посевах трансгенных растений.

Предпочтение отдают использованию в зерновых культурах, предпочтительно в кукурузе, пшенице, ячмене, ржи, овсе, просе или рисе, довсходовым или послевсходовым способом.

5 Предпочтение также отдают использованию на соевых бобах довсходовым или послевсходовым способом.

10 Применение в соответствии с изобретением для борьбы с вредными растениями или для регулирования роста растений также включает случай, в котором активное соединение общей формулы (I) или его соль образуется из вещества-предшественника («пролекарства») только после нанесения на растение, в растение или в почву.

15 Изобретение также предусматривает применение одного или нескольких соединений общей формулы (I), их солей или N-оксидов или композиции в соответствии с изобретением (как определено ниже) (в способе) для борьбы с вредными растениями или для регулирования роста растений, которое включает нанесение эффективного количества одного или нескольких соединений общей формулы (I), их солей или N-оксидов на растения (вредные растения, при необходимости, вместе с полезными растениями), семена растений, почву, в которой или на которой растут растения, или обрабатываемую площадь.

20 Изобретение также обеспечивает гербицидную и/или регулируемую рост растений композицию, отличающуюся тем, что композиция содержит:

25 (а) одно или несколько соединений общей формулы (I), их соли или N-оксиды, как определено выше, предпочтительно в одном из вариантов осуществления, определенных как предпочтительные или особенно предпочтительные, в частности одно или несколько соединений формул (I-001) - (I-015), их соли или N-оксиды, в каждом случае как определено выше, и

(б) одно или несколько дополнительных веществ, выбранных из групп (i) и/или (ii):

30 (i) одно или несколько дополнительных агрохимически активных веществ, предпочтительно выбранных из группы, состоящей из инсектицидов, акарицидов, нематоцидов, дополнительных гербицидов (т.е. тех, которые не соответствуют общей формуле (I), определенной выше), фунгицидов, сафенеров, удобрений и/или дополнительных регуляторов роста,

(ii) одно или несколько вспомогательных веществ, обычно применяемых в средствах защиты растений.

При этом дополнительные агрохимически активные вещества компонента (i) композиции в соответствии с изобретением предпочтительно выбирают из группы веществ, упомянутых в «The Pesticide Manual», 16-е издание, The British Crop Protection Council and the Royal Soc. of Chemistry, 2012.

5 Гербицидная или регулирующая рост растений композиция в соответствии с изобретением предпочтительно содержит один, два, три или более вспомогательных веществ (ii), обычных для защиты растений, выбранных из группы, включающей в себя поверхностно-активные вещества, эмульгаторы, диспергаторы, пленкообразователи, загустители, неорганические соли, средства
10 для опудривания, твердые носители при 25 °С и 1013 мбар, предпочтительно адсорбенты, гранулированные инертные материалы, смачивающие средства, антиоксиданты, стабилизаторы, буферные вещества, антивспенивающие средства, воду, органические растворители, предпочтительно органические растворители, смешиваемые с водой в любом соотношении при 25 °С и 1013
15 мбар.

Соединения общей формулы (I) согласно изобретению можно использовать в виде смачиваемых порошков, эмульгируемых концентратов, распыляемых растворов, продуктов для опудривания или гранул в обычных составах. Таким образом, изобретение также предлагает гербицидные и регулирующие рост
20 растений композиции, которые содержат соединения общей формулы (I), их соли или N-оксиды.

Соединения общей формулы (I), их соли или N-оксиды могут быть приготовлены различными способами, в зависимости от необходимых биологических и/или физико-химических параметров. Возможные составы
25 включают в себя, например: смачиваемые порошки (WP), растворимые в воде порошки (SP), растворимые в воде концентраты, эмульгируемые концентраты (EC), эмульсии (EW), такие как эмульсии масло-в-воде и вода-в-масле, растворы или эмульсии для опрыскивания, суспензионные концентраты (SC), дисперсии на масляной или водной основе, смешиваемые с маслом растворы, капсульные
30 суспензии (CS), продукты для опудривания (DP), протравливающие средства, гранулы для разбрасывания и внесения в почву, гранулы (GR) в виде микрогранул, распыляемые гранулы, абсорбционные и адсорбционные гранулы, диспергируемые в воде гранулы (WG), растворимые в воде гранулы (SG), составы ULV, микрокапсулы и воски.

Эти отдельные типы составов и вспомогательные средства для составов, такие как инертные материалы, поверхностно-активные вещества, растворители и дополнительные добавки, известны специалисту в данной области техники и описаны, например, в: Watkins, «Handbook of Insecticide Dust Diluents and Carriers», 2-е изд., Darland Books, Caldwell N.J.; H.v. Olphen, «Introduction to Clay Colloid Chemistry», 2-е изд., J. Wiley & Sons, N.Y.; C. Marsden, «Solvents Guide», 2-е изд., Interscience, N.Y. 1963; McCutcheon's «Detergents and Emulsifiers Annual», MC Publ. Corp., Ridgewood N.J.; Sisley and Wood, «Encyclopedia of Surface Active Agents», Chem. Publ. Co. Inc., N.Y. 1964; Schönfeldt, «Grenzflächenaktive Äthylenoxidaddukte» [Interface-active Ethylene Oxide Adducts], Wiss. Verlagsgesellschaft, Stuttgart 1976; Winnacker-Küchler, «Chemische Technologie» [Химические технологии], том 7, C. Hanser Verlag Munich, 4-е изд. 1986.

Смачиваемые порошки представляют собой однородно диспергируемые в воде препараты, которые, в дополнение к активному соединению, и кроме разбавителя или инертного вещества, также содержат поверхностно-активные вещества ионной и/или неионной природы (смачиваемые средства, диспергируемые средства), например, полиоксиэтилированные алкилфенолы, полиоксэтилированные жирные спирты, полиоксэтилированные жирные амины, сульфаты простых эфиров жирных спиртов с полигликолями, алкансульфонаты, алкилбензолсульфонаты, лигносульфонат натрия, 2,2'-динафтилметан-6,6'-дисульфонат натрия, дибутилнафталинсульфонат натрия или же олеилметилтаурат натрия. Для получения смачиваемых порошков гербицидно активные соединения мелко размалывают, например, с помощью обычных аппаратов, таких как молотковые мельницы, воздушодувные мельницы и воздушоструйные мельницы, и одновременно или после этого смешивают со вспомогательными веществами для приготовления составов.

Эмульгируемые концентраты получают растворением активного соединения в органическом растворителе, например, таком как бутанол, циклогексанон, диметилформамид, ксилол, или также высококипящих ароматических соединениях или углеводородах, или смесях органических растворителей, с добавлением одного или нескольких ионных и/или неионогенных поверхностно-активных веществ (эмульгаторов). Примеры используемых эмульгаторов могут представлять собой: алкиларилсульфонаты

кальция, такие как додецилбензилсульфонат кальция, или неионогенные эмульгаторы, такие как сложные полигликолевые эфиры жирных кислот, простые алкиларилполигликолевые эфиры, простые полигликолевые эфиры жирного спирта, продукты конденсации пропиленоксида/этиленоксида, простые алкиловые полиэфиры, сложные эфиры сорбита, например, сложные эфира сорбита и жирной кислоты, или полиоксиэтиленовые сложные эфиры сорбита, например, полиоксиэтиленовые сложные эфиры сорбита и жирной кислоты.

Продукты для опудривания получают посредством размола активного соединения с тонко распределенными твердыми веществами, например, тальком, природными глинами, такими как каолин, бентонит и пиррофиллит, или диатомовая земля.

Суспензионные концентраты могут иметь водную или масляную основу. Они могут быть изготовлены, например, посредством мокрого размола с помощью коммерчески доступных бисерных мельниц с необязательным добавлением поверхностно-активных веществ, которые уже были приведены выше, например, для других типов составов.

Эмульсии, например, эмульсии масло-в-воде (EW), могут быть получены, например, с помощью мешалок, коллоидных мельниц и/или статических смесителей с применением водных органических растворителей и при необходимости поверхностно-активных веществ, которые уже были приведены выше, например, для других типов составов.

Гранулы могут быть получены или распылением активного соединения на адсорбирующий гранулированный инертный материал или нанесением концентратов активного соединения на поверхность носителей, таких как песок, каолиниты или гранулированный инертный материал, при помощи клеящих веществ, например, поливинилового спирта, полиакрилатов натрия или также минеральных масел. Пригодные активные соединения также могут быть гранулированы способом, обычным для изготовления гранул удобрений – при необходимости в смеси с удобрениями.

Диспергируемые в воде гранулы, как правило, изготавливают обычными способами, такими как распылительная сушка, грануляция псевдооживленным слоем, тарельчатая грануляция, смешивание высокоскоростными смесителями и экструзия без твердого инертного вещества.

Для изготовления гранул тарельчатым гранулированием, гранулированием в псевдооживленном слое, экструзией и распылением, см., например, способы в «Spray Drying Handbook» 3-е изд. 1979, G. Goodwin Ltd., London, J.E. Browning, «Agglomeration», Chemical and Engineering 1967, сс. и на др. сс.; «Perry's
5 Chemical Engineer's Handbook», 5-е изд., McGraw-Hill, New York 1973, сс. 8-57.

Относительно других подробностей, касающихся составления композиций для защиты растений, см., например, G.C. Klingman, «Weed Control as a Science», John Wiley and Sons, Inc., New York, 1961, сс. 81-96 и J.D. Freyer, S.A. Evans, «Weed Control Handbook», 5-е изд., Blackwell Scientific Publications, Oxford,
10 1968, сс. 101-103.

Агрохимические препараты, предпочтительно гербицидные или регулирующие рост растений композиции в соответствии с настоящим изобретением предпочтительно содержат общее количество от 0,1 до 99 мас. %, в особенности от 0,1 до 95 мас. %, особенно предпочтительно от 1 до 90 мас. %, в особенности предпочтительно от 2 до 80 мас. % активных соединений общей формулы (I), их солей или N-оксидов.
15

В смачиваемых порошках концентрация активных соединений составляет, например, приблизительно от 10 до 90 мас. %, остаток до 100 мас. % состоит из стандартных компонентов для составов. В эмульгируемых концентратах
20 концентрация активного соединения может составлять примерно от 1 до 90 % и предпочтительно от 5 до 80 мас. %. Составы в виде тонких порошков содержат от 1 до 30 мас. % активного соединения, предпочтительно, как правило, от 5 до 20 мас. % активного соединения; растворы для разбрызгивания содержат примерно от 0,05 до 80 предпочтительно от 2 до 50 мас. % активного
25 соединения. В случае диспергируемых в воде гранул содержание активного соединения частично зависит от того, находится ли активное соединение в жидком или твердом виде и какие применяют вспомогательные вещества для грануляции, наполнители и т.п. В диспергируемых в воде гранулах содержание активного соединения находится, например, между 1 и 95 мас. %, предпочтительно между 10 и 80 мас. %
30

Кроме того, указанные выше составы активных соединений необязательно содержат стандартные промоторы адгезии, смачиваемые средства, диспергаторы, эмульгаторы, средства, улучшающие проникновение, консерванты, антифризы и растворители, наполнители, носители и красители,

антивспениватели, ингибиторы испарения и средства, влияющие на значение pH и вязкость.

Примеры вспомогательных веществ в составах описаны в том числе и в «Chemistry and Technology of Agrochemical Formulations», изд. D.A. Knowles, Kluwer Academic Publishers (1998).

Соединения общей формулы (I), их соли или N-оксиды можно использовать как таковые или в виде их препаратов (составов) в сочетании с другими пестицидно активными веществами, например, инсектицидами, акарицидами, нематоцидами, гербицидами, фунгицидами, сафенерами, удобрениями и/или регуляторами роста, например, в форме готового состава или баковой смеси. Комбинированные составы могут быть приготовлены на основе вышеупомянутых составов, принимая во внимание физические свойства и стабильность соединяемых активных соединений.

Активные соединения, которые можно использовать в комбинации с соединениями общей формулы (I) в соответствии с изобретением в смешанных составах или в баковых смесях, представляют собой, например, известные активные вещества, действие которых основано на ингибировании, например, ацетолактатсинтазы, ацетил-CoA карбоксилазы, целлюлозосинтазы, енолпирувилшикимат-3-фосфатсинтазы, глутаминсинтетазы, *n*-гидроксифенилпируватдиоксигеназы, фитоендесатуразы, фотосистемы I, фотосистемы II, протопорфириногенаоксидазы, как описано, например, в Weed Research 26 (1986) 441-445 или «The Pesticide Manual», 16-е издание, The British Crop Protection Council and the Royal Soc. of Chemistry, 2012 и в процитированных там литературных источниках.

Особый интерес представляет селективная борьба с вредными растениями в посевах полезных и декоративных растений. Хотя соединения общей формулы (I) в соответствии с изобретением уже продемонстрировали селективность от очень хорошей до адекватной в отношении большого количества культур, в принципе, в отношении некоторых культур и, в частности, также в случае смесей с другими, менее селективными гербицидами, может возникнуть фитотоксичность для сельскохозяйственных растений. В этой связи особый интерес представляют комбинации соединений общей формулы (I) в соответствии с изобретением, которые содержат соединения общей формулы (I) или их комбинации с другими гербицидами или пестицидами и сафенерами.

Сафенеры, которые используют в антитоксически эффективном количестве, уменьшают фитотоксические побочные эффекты применяемых гербицидов/пестицидов, например, на экономически важных культурах, таких как зерновые (пшеница, ячмень, рожь, кукуруза, рис, просо), сахарная свекла, сахарный тростник, рапс, хлопчатник и соевые бобы, предпочтительно зерновые.

Массовые соотношения гербицида (смеси) к сафенеру зависят, как правило, от нормы внесения гербицида и эффективности рассматриваемого сафенера и могут варьироваться в широких пределах, например в диапазоне от 200:1 до 1:200, предпочтительно 100:1. до 1:100, в частности от 20:1 до 1:20. Аналогично соединениям (I) или их смесям сафенеры могут быть составлены с дополнительными гербицидами/пестицидами и предоставлены и использованы в виде готового препарата или баковой смеси с гербицидами.

Для применения гербицидные или гербицидно/саферные составы, имеющиеся в коммерческой форме, при необходимости разбавляют водой обычным способом, например, в случае смачиваемых порошков, эмульгируемых концентратов, дисперсий и диспергируемых в воде гранулятов. Препараты для опудривания, гранулы для внесения в почву или гранулы для распыления и распыляемые растворы перед применением обычно не разбавляют другими инертными веществами.

На норму внесения соединений общей формулы (I), их солей или N-оксидов в определенной степени влияют внешние условия, такие как температура, влажность и т.д. При этом норма внесения может варьироваться в широких пределах. Для применения в качестве гербицида для борьбы с вредными растениями общее количество соединений общей формулы (I), их солей или N-оксидов предпочтительно находится в диапазоне от 0,001 до 10,0 кг/га, предпочтительно в диапазоне от 0,005 до 5 кг/га, более предпочтительно в диапазоне от 0,01 до 1,5 кг/га, особенно предпочтительно в диапазоне от 0,05 до 1 кг/га. Это касается как довсходового, так и послевсходового применения.

Когда соединения общей формулы (I), их соли или N-оксиды используют в качестве регуляторов роста растений, например, в качестве стабилизатора стеблей для сельскохозяйственных растений, подобных упомянутым выше, предпочтительно зерновых растений, такие как пшеница, ячмень, рожь, тритикале, просо, рис или кукуруза, общая норма внесения предпочтительно находится в диапазоне от 0,001 до 2 кг/га, предпочтительно в диапазоне от 0,005

до 1 кг/га, в частности в диапазоне от 10 до 500 г/га. га, особенно в пределах от 20 до 250 г/га. Это касается как довсходового, так и послевсходового применения.

5 Применение в качестве стабилизатора стеблей можно осуществлять на различных стадиях роста растений. Предпочтительным является, например, применение после фазы обработки почвы, в начале продольного роста.

10 В качестве альтернативы, применение в качестве регулятора роста растений также возможно путем обработки семян, что включает в себя различные методы протравливания и покрытия семян. Здесь норма применения зависит от конкретных методов и может быть определена в предварительных тестах.

15 Активные соединения, которые можно использовать в комбинации с соединениями общей формулы (I) в соответствии с изобретением в композициях в соответствии с изобретением (например, в смешанных составах или в баковых смесях) представляют собой, например, известные активные соединения, действие которых основано на ингибировании, например, ацетолактатсинтазы, ацетил-СоА карбоксилазы, целлюлозосинтазы, енолпирувилшикимат-3-фосфатсинтазы, глутаминсинтетазы, *n*-гидроксифенилпируватдиоксигеназы, фитоендесатуразы, фотосистемы I, фотосистемы II или протопорфириногеноксидазы, как описано, например, в Weed Research 26 (1986) 20 441-445 или «The Pesticide Manual», 16-е издание, The British Crop Protection Council and the Royal Soc. of Chemistry, 2012 и процитированных в данном документе литературных источниках.

25 Известные гербициды или регуляторы роста растений, которые можно комбинировать с соединениями в соответствии с изобретением, представляют собой, например, приведенные ниже, где указанные активные вещества обозначены или своим «общим названием» в соответствии с Международной организацией по стандартизации (ISO), или химическим названием или кодовым номером. Они всегда охватывают все формы применения, такие как, например, кислоты, соли, сложные эфиры, а также все изомерные формы, такие как 30 стереоизомеры и оптические изомеры, даже если они не упоминаются явно.

Примерами таких гербицидных компонентов смеси являются:

ацетохлор, ацифторфен, ацифторфен-метил, ацифторфен-натрий, аклонифен, алахлор, аллидохлор, аллоксидим, аллоксидим-натрий, аметрин, амикарбазон, амидохлор, амидосульфурон, 4-амино-3-хлор-6-(4-хлор-2-фтор-3-

метилфенил)-5-фторпиридин-2-карбоновая кислота, аминоклопирахлор, аминоклопирахлор-калий, аминоклопирахлор-метил, аминоклопиралид, аминоклопиралид-диметиламмоний, аминоклопиралид-трипромин, амитрол, аммонийсульфамат, анилофос, асулам, асулам-калий, асулам-натрий, атразин, 5 азафенидин, азимсульфурон, бефлубутамид, (S)-(-)-бефлубутамид, бефлубутамид-M, беназолин, беназолин-этил, беназолин-диметиламмоний, беназолин-калий, бенфлуралин, бенфурезат, бенсульфурон, бенсульфурон-метил, бенсулид, бентазон, бентазон-натрий, бензобициклон, бензофенап, бициклопирон, бифенокс, биланафос, биланафос-натрий, биспирибак, 10 биспирибак-натрий, бикслохон, бромацил, бромацил-литий, бромацил-натрий, бромбутид, бромфеноксим, бромоксинил, бромоксинил-бутират, -калий, -гептаноат и -октаноат, бусоксинон, бутахлор, бутафенацил, бутамифос, бутенахлор, бутралин, бутроксидим, бутилат, кафенстрол, камбендихлор, карбетамид, карфентразон, карфентразон-этил, хлорамбен, хлорамбен-аммоний, 15 хлорамбен-диоламин, хлорамбен-метил, хлорамбен-метиламмоний, хлорамбен-натрий, хлорбромурон, хлорфенак, хлорфенак-аммоний, хлорфенак-натрий, хлорфенпроп, хлорфенпроп-метил, хлорфлуренол, хлорфлуренол-метил, хлоридазон, хлоримурон, хлоримурон-этил, хлорфталим, хлортолурун, хлорсульфурон, хлортал, хлортал-диметил, хлортал-монометил, цинидон, 20 цинидон-этил, цинметилин, экзо-(+)-цинметилин, т.е. (1R,2S,4S)-4-изопропил-1-метил-2-[(2-метилбензил)окси]-7-оксабицикло[2.2.1]гептан, экзо-(-)-цинметилин, т.е. (1R,2S,4S)-4-изопропил-1-метил-2-[(2-метилбензил)окси]-7-оксабицикло[2.2.1]гептан, циносульфурон, клацифос, клетодим, клодинафоп, клодинафоп-этил, клодинафоп-пропаргил, кломазон, кломепроп, клопиралид, 25 клопиралид-метил, клопиралид-оламин, клопиралид-калий, клопиралид-трипромин, клорансулам, клорансулам-метил, кумилурон, цианамид, цианазин, циклоат, циклопиранил, циклопириморат, циклосульфамурон, циклоксидим, цигалофоп, цигалофоп-бутил, ципразин, 2,4-D (включая аммоний, бутотил, -бутил, холин, диэтиламмоний, -диметиламмоний, -диоламин, -добоксил, -додэциламмоний, этексил, этил, 2-этилгексил, гептиламмоний, изобутил, 30 изооктил, изопропил, изопропиламмоний, литий, мептил, метил, калий, тетрадециламмоний, триэтиламмоний, триизопропаноламмоний, трипромин и его троламиновая соль), 2,4-DB, 2,4-DB-бутил, -диметиламмоний, изооктил, -калий и -натрий, даимурон (димрон), далапон, далапон-кальций, далапон-

магний, далапон-натрий, дазомет, дазомет-натрий, *n*-деканол, 7-деокси-D-седогептулоза, десмедифам, детозил-пиразолат (DTP), дикамба и его соли, например, дикамба-бипроамин, дикамба-N,N-Бис(3-аминопропил)метиламин, дикамба-бутотил, дикамба-холин, дикамба-дигликольамин, дикамба-

5 диметиламмоний, дикамба-диэтаноламин аммоний, дикамба-диэтиламмоний, дикамба-изопропиламмоний, дикамба-метил, дикамба-моноэтаноламин, дикамба-оламин, дикамба-калий, дикамба-натрий, дикамба-триэтаноламин, дихлобенил, 2-(2,4-дихлорбензил)-4,4-диметил-1,2-оксазолидин-3-он, 2-(2,5-

10 дихлорбензил)-4,4-диметил-1,2-оксазолидин-3-он, дихлорпроп, дихлорпроп-бутотил, дихлорпроп-диметиламмоний, дихлорпроп-этексил, дихлорпроп-этиламмоний, дихлорпроп-изооктил, дихлорпроп-метил, дихлорпроп-калий, дихлорпроп-натрий, дихлорпроп-Р, дихлорпроп-Р-диметиламмоний, дихлорпроп-Р-этексил, дихлорпроп-Р-калий, дихлорпроп-натрий, диклофоп, диклофоп-метил, диклофоп-Р, диклофоп-Р-метил, диклосулам, дифензокват,

15 дифензокват-метилсульфат, дифлуфеникан, дифлуфензопир, дифлуфензопир-натрий, димефурон, димепиперат, димесульфазет, диметахлор, диметаметрин, диметенамид, диметенамид-Р, диметрасульфурон, динитрамин, динотерб, динотерб-ацетат, дифенамид, дикват, дикват-дибромид, дикват-дихлорид, дитиопир, диурон, DNOC, DNOC-аммоний, DNOC-калий, DNOC-натрий,

20 эндотал, эндотал-диаммоний, эндотал-дикалий, эндотал-динатрий, эпирифенацил (S-3100), ЕРТС, эспрокарб, эталфлуралин, этаметсульфурон, этаметсульфурон-метил, этиозин, этофумесат, этоксифен, этоксифен-этил, этокисульфурон, этобензанид, F-5231, т. е. N-[2-хлор-4-фтор-5-[4-(3-

25 фторпропил)-4,5-дигидро-5-оксо-1H-тетразол-1-ил]-фенил]-этансульфонамид, F-7967, т.е. 3-[7-Хлор-5-фтор-2-(трифторметил)-1H-бензимидазол-4-ил]-1-метил-6-(трифторметил)пиримидин-2,4(1H,3H)-дион, феноксапроп, феноксапроп-Р, феноксапроп-этил, феноксапроп-Р-этил, феноксасульфон, фенпиразон, фенквинотрион, фентразамид, флампроп, флампроп-изопропил, флампроп-метил, флампроп-М-изопропил, флампроп-М-метил, флазасульфурон,

30 флорасулам, флорпирауксифен, флорпирауксифен-бензил, флуазифоп, флуазифоп-бутил, флуазифоп-метил, флуазифоп-Р, флуазифоп-Р-бутил, флукарбазон, флукарбазон-натрий, флуцетосульфурон, флухлоралин, флуфенацет, флуфенпир, флуфенпир-этил, флуметсулам, флумиклорак, флумиклорак-пентил, флумиоксазин, флуометурон, флуренол, флуренол-бутил, -

диметиламмоний и -метил, фторгликофен, фторгликофен-этил, флупропанат, флупропанат-натрий, флупирсульфурон, флупирсульфурон-метил, флупирсульфурон-метил-натрий, флуридон, флуорохлоридон, флуороксибир, флуороксибир-бутометил, флуороксибир-метил, флуртамон, флутиацет, 5 флутиацет-метил, фомесафен, фомесафен-натрий, форамсульфурон, натриевая соль форамсульфурана, фозамин, фозамин-аммоний, глуфосинат, глуфосинат-аммоний, глуфосинат-натрий, L-глуфосинат-аммоний, L-глуфосинат-натрий, глуфосинат-Р-натрий, глуфосинат-Р-аммоний, глифосат, глифосат-аммоний, -изопропиламмоний, -диаммоний, -диметиламмоний, -калий, -натрий, 10 полуторный натрий и -тримезий, Н-9201, т.е. О-(2,4-Диметил-6-нитрофенил)-О-этил-изопропилфосфорамидотиоат, галауксифен, галауксифен-метил, галосафен, галосульфурон, галосульфурон-метил, галоксифоп, галоксифоп-Р, галоксифоп-этоксиэтил, галоксифоп-Р-этоксиэтил, галоксифоп-метил, галоксифоп-Р-метил, галоксифоп-натрий, гексазинон, HNPC-A8169, т.е. проп-2-ин-1-ил (2S)-2-{3-[(5- 15 *трет*-бутилпиридин-2-ил)окси]фенокси} пропаноат, HW-02, т.е. 1-(диметоксифосфорил)-этил-(2,4-дихлорфенокси)ацетат, гидантоцидин, имазаметабенз, имазаметабенз-метил, имазамокс, имазамокс-аммоний, имазапик, имазапик-аммоний, имазапир, имазапир-изопропиламмоний, имазаквин, имазаквин-аммоний, имазаквин-метил, имазетапир, имазетапир-аммоний, 20 имазосульфурон, инданофан, индазифлам, йодосульфурон, йодосульфурон-метил, йодосульфурон-метил-натрий, иоксинил, иоксинил-литий, -октаноат, -калий и натрий, ипфенкарбазон, изопротурон, изоурон, изоксабен, изоксафлутол, карбутилат, КУН-043, т.е. 3-({[5-(дифторметил)-1-метил-3-(трифторметил)-1Н-пиразол-4-ил]метил}сульфонил)-5,5-диметил-4,5-дигидро-1,2-оксазол, 25 кетоспирадокс, кетоспирадокс-калий, лактофен, ланкотрион, ленацил, линурон, МСРА, МСРА-бутотил, -бутил, -диметиламмоний, -диоламин, -2-этилгексил, -этил, -изобутил, изооктил, -изопропил, -изопропиламмоний, -метил, оламин, -калий, -натрий и -троламин, МСРВ, МСРВ-метил, -этил и -натрий, мекопроп, мекопроп-бутотил, мекопроп-диметиламмоний, мекопроп-диоламин, мекопроп-этексил, мекопроп-этадил, мекопроп-изоктил, мекопроп-метил, мекопроп-калий, 30 мекопроп-натрий, и мекопроп-троламин, мекопроп-Р, мекопроп-Р-бутотил, -диметиламмоний, -2-этилгексил и -калий, мефенацет, мефлуидид, мефлуидид-диоламин, мефлуидид-калий, мезосульфурон, мезосульфурон-метил, мезосульфурона натриевая соль, мезотрион, метабензтиазурон, метам,

метаифоп, метамитрон, метазахлор, метазосульфурон, метабензтиазурон, метиопирсульфурон, метиозолин, метил изотиоцианат, метобромурон, метолахлор, S-метолахлор, метосулам, метоксурон, метрибузин, метсульфурон, метсульфурон-метил, молинат, монолинурон, моноссульфурон, моноссульфурон-метил, МТ-5950, т.е. N-[3-хлор-4-(1-метилэтил)-фенил]-2-метилпентанамид, NGGC-011, напропамид, NC-310, т.е. 4-(2,4-дихлорбензоил)-1-метил-5-бензилоксипиразол, NC-656, т.е. 3-[(изопропилсульфонил)метил]-N-(5-метил-1,3,4-оксадиазол-2-ил)-5-(трифторметил)[1,2,4]триазоло[4,3-а]пиридин-8-карбоксамид, небурон, никосульфурон, нонановая кислота (пеларгоновая кислота), норфлуразон, олеиновая кислота (кислоты жирного ряда), орбенкарб, ортосульфамурон, оризалин, оксадиаргил, оксадиазон, оксасульфурон, оксацикломефон, оксифлуорфен, паракват, паракват-дихлорид, паракват-диметилсульфат, пебулат, пендиметалин, пенокосулам, пентахлорфенол, пентоксазон, петоксамид, нефтяные масла, фенмедифам, фенмедифам-этил, пиклорам, пиклорам-диметиламмоний, пиклорам-этексил, пиклорам-изоктил, пиклорам-метил, пиклорам-оламин, пиклорам-калий, пиклорам-триэтиламмоний, пиклорам-трипромин, пиклорам-троламин, пиколинафен, пиноксаден, пиперофос, претилахлор, примисульфурон, примисульфурон-метил, продиамин, профоксидим, прометон, прометрин, пропахлор, пропанил, пропаквизафоп, пропазин, профам, пропизохлор, пропоксикарбазон, пропоксикарбазон-натрий, пропирисульфурон, пропизамид, просульфокарб, просульфурон, пираклонил, пирафлуфен, пирафлуфен-этил, пирасульфотол, пиразолинат (пиразолат), пиразосульфурон, пиразосульфурон-этил, пиразоксифен, пирибамбенз, пирибамбенз-изопропил, пирибамбенз-пропил, пирибензоксим, пирибутикарб, пиридафол, пиридат, пирифталид, пириминобак, пириминобак-метил, пиримисульфам, пиритиобак, пиритиобак-натрий, пироксасульфон, пирокосулам, квинклорак, квинклорак-диметиламмоний, квинклорак-метил, квинмерак, квинокламин, квизалофоп, квизалофоп-этил, квизалофоп-Р, квизалофоп-Р-этил, квизалофоп-Р-тефурил, QYM201, т.е. 1-{2-хлор-3-[(3-циклопропил-5-гидрокси-1-метил-1H-пиразол-4-ил)карбонил]-6-(трифторметил)фенил}пиперидин-2-он, римсульфурон, сафлуфенацил, сетоксидим, сидурон, симазин, симетрин, SL-261, сультотрион, сультентразон, сультфометурон, сультфометурон-метил, сультфосульфурон, SYP-249, т.е. 1-этокси-3-метил-1-оксобут-3-ен-2-ил-5-[2-хлор-4-(трифторметил)феноксид]-2-нитробензоат, SYP-300, т.е. 1-[7-фтор-3-оксо-

4-(проп-2-ин-1-ил)-3,4-дигидро-2Н-1,4-бензоксазин-6-ил]-3-пропил-2-
тиоксоимидазолидин-4,5-дион, 2,3,6-ТВА, ТСА (трихлоруксусная кислота) и ее
соли, например, ТСА-аммоний, ТСА-кальций, ТСА-этил, ТСА-магний, ТСА-
натрий, тебутиурон, тефурилтрион, темботрион, тепралоксидим, тербацил,
5 тербукарб, тербуметон, тербутилазин, тербутрин, тетфлупиролимет, такстомин,
тенилхлор, тиазопир, тиенкарбазон, тиенкарбазон-метил, тифенсульфурон,
тифенсульфурон-метил, тиобенкарб, тиафенацил, толпиралат, топрамезон,
тралкоксидим, триафамон, три-аллат, триасульфурон, триазифлам, трибенурон,
трибенурон-метил, триклопир, триклопир-бутотил, триклопир-холин,
10 триклопир-этил, триклопир-триэтиламмоний, триэтазин, трифлорисульфурон,
трифлорисульфурон-натрий, трифлудимоксазин, трифлуралин,
трифлусульфурон, трифлусульфурон-метил, тритосульфурон, мочевины сульфат,
вернолат, XDE-848, ZJ-0862, т.е. 3,4-дихлор-N-{2-[(4,6-диметоксипиримидин-2-
ил)окси]бензил}анилин, 3-(2-хлор-4-фтор-5-(3-метил-2,6-диоксо-4-
15 трифторметил-3,6-дигидропиримидин-1 (2Н)-ил)фенил)-5-метил-4,5-
дигидроизоксазол-5-карбоновая кислота этиловый эфир, этил-[(3-{2-хлор-4-
фтор-5-[3-метил-2,6-диоксо-4-(трифторметил)-3,6-дигидропиримидин-1(2Н)-
ил]фенокси} пиридин-2-ил)окси]ацетат, простой 3-хлор-2-[3-
(дифторметил)изоксазол-5-ил]фенил-5-хлорпиримидин-2-иловый эфир, 2-(3,4-
20 диметоксифенил)-4-[(2-гидрокси-6-оксоциклогекс-1-ен-1-ил)карбонил]-6-
метилпиридазин-3(2Н)-он, 2-({2-[(2-метоксиэтокси)метил]-6-метилпиридин-3-
ил}карбонил)циклогексан-1,3-дион, (5-гидрокси-1-метил-1Н-пиразол-4-
ил)(3,3,4-триметил-1,1-диоксидо-2,3-дигидро-1-бензотиофен-5-ил)метанон, 1-
метил-4-[(3,3,4-триметил-1,1-диоксидо-2,3-дигидро-1-бензотиофен-5-
25 ил)карбонил]-1Н-пиразол-5-ил пропан-1-сульфонат, 4-{2-хлор-3-[(3,5-диметил-
1Н-пиразол-1-ил)метил]-4-(метилсульфонил)бензоил}-1-метил-1Н-пиразол-5-ил-
1,3-диметил-1Н-пиразол-4-карбоксилат; цианометил 4-амино-3-хлор-5-фтор-6-
(7-фтор-1Н-индол-6-ил)пиридин-2-карбоксилат, проп-2-ин-1-ил 4-амино-3-хлор-
5-фтор-6-(7-фтор-1Н-индол-6-ил)пиридин-2-карбоксилат, метил 4-амино-3-хлор-
30 5-фтор-6-(7-фтор-1Н-индол-6-ил)пиридин-2-карбоксилат, 4-амино-3-хлор-5-
фтор-6-(7-фтор-1Н-индол-6-ил)пиридин-2-карбоновая кислота, бензил 4-амино-
3-хлор-5-фтор-6-(7-фтор-1Н-индол-6-ил)пиридин-2-карбоксилат, этил 4-амино-
3-хлор-5-фтор-6-(7-фтор-1Н-индол-6-ил)пиридин-2-карбоксилат, метил 4-амино-
3-хлор-5-фтор-6-(7-фтор-1-изобутирил-1Н-индол-6-ил)пиридин-2-карбоксилат,

метил 6-(1-ацетил-7-фтор-1Н-индол-6-ил)-4-амино-3-хлор-5-фторпиридин-2-карбоксилат, метил 4-амино-3-хлор-6-[1-(2,2-диметилпропаноил)-7-фтор-1Н-индол-6-ил]-5-фторпиридин-2-карбоксилат, метил 4-амино-3-хлор-5-фтор-6-[7-фтор-1-(метоксиацетил)-1Н-индол-6-ил]пиридин-2-карбоксилат, 4-амино-3-хлор-5-фтор-6-(7-фтор-1Н-индол-6-ил)пиридин-2-карбоксилат калия, 4-амино-3-хлор-5-фтор-6-(7-фтор-1Н-индол-6-ил)пиридин-2-карбоксилат натрия, бутил 4-амино-3-хлор-5-фтор-6-(7-фтор-1Н-индол-6-ил)пиридин-2-карбоксилат, 4-гидрокси-1-метил-3-[4-(трифторметил)пиридин-2-ил]имидазолидин-2-он, 3-(5-*трет*-бутил-1,2-оксазол-3-ил)-4-гидрокси-1-метилимидазолидин-2-он, 3-[5-хлор-4-(трифторметил)пиридин-2-ил]-4-гидрокси-1-метилимидазолидин-2-он, 4-гидрокси-1-метокси-5-метил-3-[4-(трифторметил)пиридин-2-ил]имидазолидин-2-он, 6-[(2-гидрокси-6-оксоциклогекс-1-ен-1-ил)карбонил]-1,5-диметил-3-(2-метилфенил)хиназолин-2,4(1Н,3Н)-дион, 3-(2,6-диметилфенил)-6-[(2-гидрокси-6-оксоциклогекс-1-ен-1-ил)карбонил]-1-метилхиназолин-2,4(1Н,3Н)-дион, 2-[2-хлор-4-(метилсульфонил)-3-(морфолин-4-илметил)бензоил]-3-гидроксициклогекс-2-ен-1-он, соль 1-(2-карбоксиэтил)-4-(пиримидин-2-ил)пиридазин-1-иния (с такими анионами, как хлорид, ацетат или трифторацетат), соль 1-(2-карбоксиэтил)-4-(пиридазин-3-ил)пиридазин-1-иния (с такими анионами, как хлорид, ацетат или трифторацетат), соль 4-(пиримидин-2-ил)-1-(2-сульфоэтил)пиридазин-1-иния (с такими анионами, как хлорид, ацетат или трифторацетат), соль 4-(пиридазин-3-ил)-1-(2-сульфоэтил)пиридазин-1-иния (с такими анионами, как хлорид, ацетат или трифторацетат), 1-(2-карбоксиэтил)-4-(1,3-тиазол-2-ил)пиридазин-1-иния соль (с такими анионами, как хлорид, ацетат или трифторацетат), 1-(2-карбоксиэтил)-4-(1,3-тиазол-2-ил)пиридазин-1-иния соль (с такими анионами, как хлорид, ацетат или трифторацетат).

Примерами регуляторов роста растений в качестве компонентов для смешивания являются:

абсцизовая кислота, ацибензолар, ацибензолар-S-метил, 1-аминоциклопро-1-илкарбоновая кислота и ее производные, 5-аминолевулиновая кислота, анцимидол, 6-бензиламинопурин, бикинин, брассинолид, брассинолид-этил, катехин, хитоолигосахариды (CO; CO отличаются от LCO тем, что у них отсутствует подвешенная цепь жирной кислоты, характерная для LCO. CO, иногда называемые N-ацетилхитоолигосахаридами, также состоят из остатков GlcNAc, но имеют структуры боковой цепи, которые отличают их от молекул

хитина [(C₈H₁₃NO₅)_n, CAS № 1398-61-4] и молекул хитозана [(C₅H₁₁NO₄)_n, CAS № 9012-76-4]), хитиновые соединения, хлормекват хлорид, клопроп, цикланилид, 3-(Циклопроп-1-енил)пропионовая кислота, даминозид, дазомет, дазомет-натрий, *n*-деканол, дикегулак, дикегулак-натрий, эндотал, эндотал-дикалий, -динатрий, и моно(N,N-диметилалкиламмоний), этефон, флуметралин, флуренол, флуренол-бутил, флуренол-метил, флурпримидол, форхлорфенурон, гибберелловая кислота, инабенфид, индол-3-уксусная кислота (IAA), 4-индол-3-илмасляная кислота, изопротиолан, пробеназол, жасмоновая кислота, жасмоновая кислота или их производные (например, метиловый эфир жасмоновой кислоты), липохитоолигосахариды (LCO, иногда называемые сигналами симбиотического клубнеобразования (Nod) (или факторами Nod) или факторами Muc, состоят из олигосахаридного остова, состоящего из β-1,4-связанных остатков *N*-ацетил-D-глюкозамина («GlcNAc») с *N*-связанной жирной ацильной цепью, конденсированной на невозстанавливаемом конце.

15 Как понятно в данной области, LCO различаются по количеству остатков GlcNAc в основной цепи, по длине и степени насыщения жирной ацильной цепи, а также по заменам восстанавливающих и невозстанавливающих остатков сахара), линолевой кислоты или ее производных, линоленовая кислота или ее производные, гидразид малеиновой кислоты, хлорид мепиквата, пентаборат мепиквата, 1-метилциклопропен, 3'-метил абсцизовая кислота, 2-(1-нафтил)ацетамид, 1-нафтилуксусная кислота, 2-нафтилоксиуксусная кислота, смесь нитрофенолятов, 4-Оксо-4[(2-фенилэтил)амино]масляная кислота, паклобутразол, 4-фенилмасляная кислота, *N*-фенилфталаминовая кислота, прогексадион, прогексадион-кальций, прогидрожасмон, салициловая кислота, метиловый эфир салициловой кислоты, стриголактон, текназен, тидиазурон, триаконтанол, тринексапак, тринексапак-этил, тситодеф, униканазол, униканазол-Р, 2-фтор-*N*-(3-метоксифенил)-9*H*-пурин-6-амин.

Пригодные компоненты для комбинации для соединений общей формулы (I) в соответствии с изобретением также включают в себя, например, следующие сафенеры:

S1) Соединения из группы производных гетероциклических карбоновых кислот:

S1^a) Соединения типа дихлорфенилпиразолин-3-карбоновой кислоты (S1^a), предпочтительно соединения, такие как

1-(2,4-дихлорфенил)-5-(этоксикарбонил)-5-метил-2-пиразолин-3-карбоновая кислота, этил 1-(2,4-дихлорфенил)-5-(этоксикарбонил)-5-метил-2-пиразолин-3-карбоксилат (S1-1) («мефенпир-диэтил»), и родственные соединения, как описано в WO-A-91/07874;

5 S1^b) Производные дихлорфенилпиразолкарбоновой кислоты (S1^b), предпочтительно соединения, такие как этил 1-(2,4-дихлорфенил)-5-метилпиразол-3-карбоксилат (S1-2), этил 1-(2,4-дихлорфенил)-5-изопропилпиразол-3-карбоксилат (S1-3), этил 1-(2,4-дихлорфенил)-5-(1,1-диметилэтил)пиразол-3-карбоксилат (S1-4) и родственные соединения, как
10 описано в EP-A-333131 131 и EP-A-269806;

S1^c) Производные 1,5-дифенилпиразол-3-карбоновой кислоты (S1^c), предпочтительно соединения, такие как этил 1-(2,4-дихлорфенил)-5-фенилпиразол-3-карбоксилат (S1-5), метил 1-(2-хлорфенил)-5-фенилпиразол-3-карбоксилат (S1-6) и родственные соединения, как описано, например, в EP-A-
15 268554;

S1^d) Соединения типа триазолкарбоновой кислоты (S1^d), предпочтительно соединения, такие как фенхлоразол (сложный этиловый эфир), т.е. этил 1-(2,4-дихлорфенил)-5-трихлорметил-1H-1,2,4-триазол-3-карбоксилат (S1-7), и родственные соединения, как описано в EP-A-174562 и EP-A-346620;

20 S1^e) Соединения 5-бензил- или 5-фенил-2-изоксазолин-3-карбоновой кислоты или типа 5,5-дифенил-2-изоксазолин-3-карбоновой кислоты (S1^e), предпочтительно соединения, такие как этил 5-(2,4-дихлорбензил)-2-изоксазолин-3-карбоксилат (S1-8) или этил 5-фенил-2-изоксазолин-3-карбоксилат (S1-9) и родственные соединения, как описано в WO-A-91/08202,
25 или 5,5-дифенил-2-изоксазолинкарбоновая кислота (S1-10) или этил 5,5-дифенил-2-изоксазолин-3-карбоксилат (S1-11) («изоксадифен-этил») или *n*-пропил 5,5-дифенил-2-изоксазолин-3-карбоксилат (S1-12) или этил 5-(4-фторфенил)-5-фенил-2-изоксазолин-3-карбоксилат (S1-13), как описано в патентной заявке WO-A-95/07897.

30 S2) Соединения из группы производных 8-хинолинокси (S2):

S2^a) Соединения типа 8-хинолиноксиуксусной кислоты (S2^a), предпочтительно 1-метилгексил (5-хлор-8-хинолинокси)ацетат («клоквинтоцет-мексил») (S2-1), 1,3-диметилбут-1-ил (5-хлор-8-хинолинокси)ацетат (S2-2), 4-аллилоксибутил (5-хлор-8-хинолинокси)ацетат (S2-3), 1-аллилоксипроп-2-ил (5-

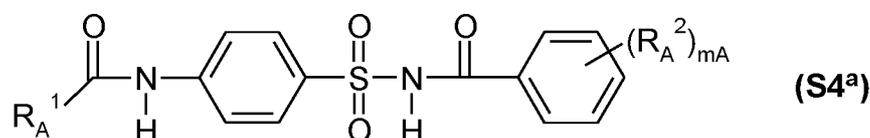
хлор-8-хинолинокси)ацетат (S2-4), этил (5-хлор-8-хинолинокси)ацетат (S2-5), метил 5-хлор-8-хинолиноксиацетат (S2-6), аллил (5-хлор-8-хинолинокси)ацетат (S2-7), 2-(2-пропилидениминокси)-1-этил (5-хлор-8-хинолинокси)ацетат (S2-8), 2-оксопроп-1-ил (5-хлор-8-хинолинокси)ацетат (S2-9) и родственные
5 соединения, как описано в EP-A-86750, EP-A-94349 и EP-A-191736 или EP-A-0 492 366, и также (5-хлор-8-хинолинокси)уксусная кислота (S2-10), ее гидраты и соли, например, ее соли лития, натрия, калия, кальция, магния, алюминия, железа, аммония, четвертичного аммония, сульфония или фосфония, как описано в WO-A-2002/34048;

10 S2^b) Соединения типа (5-хлор-8-хинолинокси)малоновой кислоты (S2^b), предпочтительно соединения, такие как диэтил (5-хлор-8-хинолинокси)малонат, диаллил (5-хлор-8-хинолинокси)малонат, метил этил (5-хлор-8-хинолинокси)малонат и родственные соединения, как описано в EP-A-0 582 198.

S3) Активные соединения типа дихлорацетамида (S3), которые часто
15 применяют в качестве довсходовых сафенеров (действующих в почве сафенеров), например, «дихлормид» (N,N-диаллил-2,2-дихлорацетамид) (S3-1), «R-29148» (3-дихлорацетил-2,2,5-триметил-1,3-оксазолидин) от Stauffer (S3-2), «R-28725» (3-дихлорацетил-2,2-диметил-1,3-оксазолидин) от Stauffer (S3-3), «беноксакор» (4-дихлорацетил-3,4-дигидро-3-метил-2H-1,4-бензоксазин) (S3-4),
20 «PPG-1292» (N-аллил-N-[(1,3-диоксолан-2-ил)метил]дихлорацетамид) от PPG Industries (S3-5), «DKA-24» (N-аллил-N-[(аллиламинокарбонил)метил]дихлорацетамид) от Sagro-Chem (S3-6), «AD-67» или «MON 4660» (3-дихлорацетил-1-окса-3-азаспиро[4.5]декан) от Nitrokemia или Monsanto (S3-7), «TI-35» (1-дихлорацетилазепан) от TRI-Chemical RT (S3-8),
25 «Диклонон» (Дициклонон) или «BAS145138» или «LAB145138» (S3-9) ((RS)-1-дихлорацетил-3,3,8a-триметилреггидропирроло[1,2-a]пиримидин-6-он) от BASF, «фурилазол» или «MON 13900» ((RS)-3-дихлорацетил-5-(2-фурил)-2,2-диметил-оксазолидин) (S3-10) и его (R) изомер (S3-11).

S4) Соединения из класса ацилсульфонамидов (S4):

30 S4^a) N-Ацилсульфонамиды формулы (S4^a) и их соли, как описано в WO-A-97/45016,



в которой

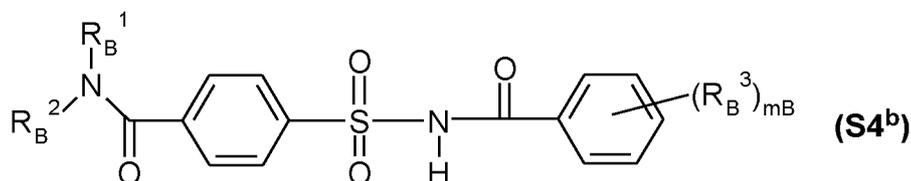
R_A^1 представляет собой (C_1 - C_6)-алкил, (C_3 - C_6)-циклоалкил, где два последних радикала замещены посредством v_A заместителей из группы галогена, (C_1 - C_4)-алкокси, (C_1 - C_6)-галогеналкокси и (C_1 - C_4)-алкилтио и, в случае циклических радикалов, также посредством (C_1 - C_4)-алкила и (C_1 - C_4)-галогеналкила;

R_A^2 представляет собой галоген, (C_1 - C_4)-алкил, (C_1 - C_4)-алкокси, CF_3 ;

m_A представляет собой 1 или 2;

v_A означает 0, 1, 2 или 3;

$S4^b$) Соединения типа 4-(бензоилсульфамоил)бензамида формулы ($S4^b$) и их соли, как описано в WO-A-99/16744,



в которой

R_B^1 , R_B^2 независимо представляют собой водород, (C_1 - C_6)-алкил, (C_3 - C_6)-циклоалкил, (C_3 - C_6)-алкенил, (C_3 - C_6)-алкинил,

R_B^3 представляет собой галоген, (C_1 - C_4)-алкил, (C_1 - C_4)-галогеналкил или (C_1 - C_4)-алкокси и

m_B означает 1 или 2,

например, те, в которых

$R_B^1 =$ циклопропил, $R_B^2 =$ водород и $(R_B^3) = 2$ -ОМе («ципрсульфамид», $S4$ -1),

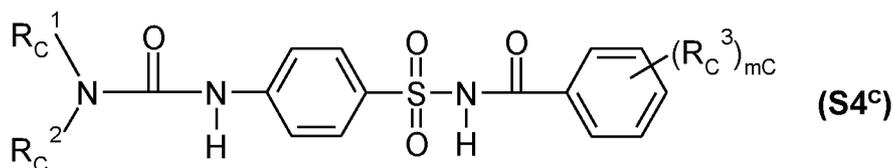
$R_B^1 =$ циклопропил, $R_B^2 =$ водород и $(R_B^3) = 5$ -Cl-2-ОМе ($S4$ -2),

$R_B^1 =$ этил, $R_B^2 =$ водород и $(R_B^3) = 2$ -ОМе ($S4$ -3),

$R_B^1 =$ изопропил, $R_B^2 =$ водород и $(R_B^3) = 5$ -Cl-2-ОМе ($S4$ -4) и

$R_B^1 =$ изопропил, $R_B^2 =$ водород и $(R_B^3) = 2$ -ОМе ($S4$ -5);

$S4^c$) Соединения из класса бензоилсульфамоилфенилмочевин формулы ($S4^c$), как описано в EP-A-365484,



в которой

5 R_C^1 , R_C^2 представляют собой независимо водород, (C₁-C₈)-алкил, (C₃-C₈)-циклоалкил, (C₃-C₆)-алкенил, (C₃-C₆)-алкинил,

R_C^3 представляет собой галоген, (C₁-C₄)-алкил, (C₁-C₄)-алкокси, CF₃ и

m_C представляет собой 1 или 2;

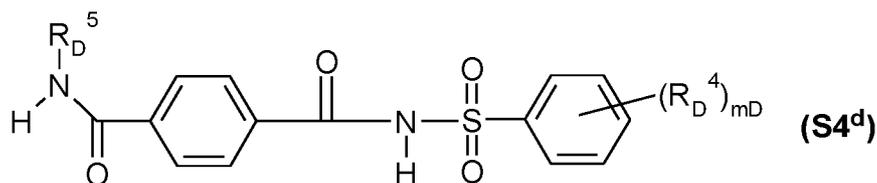
например,

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

10 1-[4-(N-2-метоксибензоилсульфамоил)фенил]-3,3-диметилмочевина,

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

S4^d) Соединения типа N-фенилсульфонилтерeftаламида формулы (S4^d) и его соли, которые известны, например, из CN 101838227,



15

в которой

R_D^4 представляет собой галоген, (C₁-C₄)-алкил, (C₁-C₄)-алкокси, CF₃;

m_D означает 1 или 2;

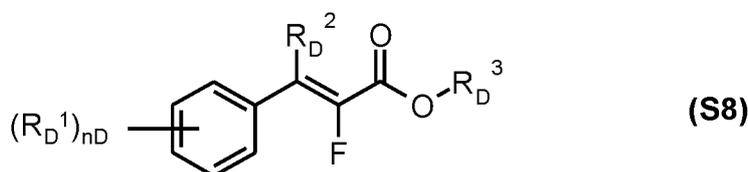
20 R_D^5 представляет собой водород, (C₁-C₆)-алкил, (C₃-C₆)-циклоалкил, (C₂-C₆)-алкенил, (C₂-C₆)-алкинил или (C₅-C₆)-циклоалкенил.

S5) Активные соединения из класса гидроксиароматических соединений и производных ароматических-алифатических карбоновых кислот (S5), например, этил 3,4,5-триацетоксибензоат, 3,5-диметокси-4-гидроксибензойная кислота, 3,5-дигидроксибензойная кислота, 4-гидроксисалициловая кислота, 4-фторсалициловая кислота, 2-гидроксикоричная кислота, 2,4-дихлоркоричная кислота, как описано в WO-A-2004/084631, WO-A-2005/015994, WO-A-2005/016001.

S6) Активные соединения из класса 1,2-дигидрохиноксалин-2-онов (S6), например, 1-метил-3-(2-тиенил)-1,2-дигидрохиноксалин-2-он, 1-метил-3-(2-тиенил)-1,2-дигидрохиноксалин-2-тион, 1-(2-аминоэтил)-3-(2-тиенил)-1,2-дигидрохиноксалин-2-он гидрохлорид, 1-(2-метилсульфониламиноэтил)-3-(2-тиенил)-1,2-дигидрохиноксалин-2-он, как описано в WO-A-2005/112630.

S7) Соединения из класса производных дифенилметоксиуксусной кислоты (S7), например, метил дифенилметоксиацетат (CAS рег. № 41858-19-9) (S7-1), этил дифенилметоксиацетат или дифенилметоксиуксусная кислота, как описано в WO-A-98/38856.

10 S8) Соединения формулы (S8), как описано в WO-A-98/27049,



в которой символы и индексы определены следующим образом:

R_D^1 представляет собой галоген, (C_1-C_4) -алкил, (C_1-C_4) -галогеналкил, (C_1-C_4) -алкокси, (C_1-C_4) -галогеналкокси,

15 R_D^2 представляет собой водород или (C_1-C_4) -алкил,

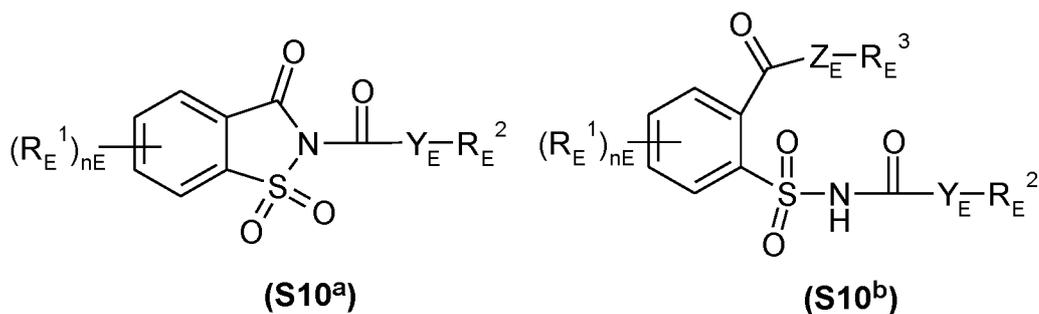
R_D^3 представляет собой водород, (C_1-C_8) -алкил, (C_2-C_4) -алкенил, (C_2-C_4) -алкинил или арил, где каждый из вышеупомянутых углеродсодержащих радикалов является незамещенным или замещенным одним или несколькими, предпочтительно до 3 одинаковыми или различными радикалами из группы, включающей в себя галоген и алкокси; или их соли,

20 n_D представляет собой целое число от 0 до 2.

S9) активные соединения из класса 3-(5-тетразолилкарбонил)-2-хинолонов (S9), например, 1,2-дигидро-4-гидрокси-1-этил-3-(5-тетразолилкарбонил)-2-хинолон (CAS рег. № 219479-18-2), 1,2-дигидро-4-гидрокси-1-метил-3-(5-тетразолилкарбонил)-2-хинолон (CAS рег. № 95855-00-8), как описано в WO-A-199/000020;

S10) Соединения формулы (S10^a) или (S10^b)

как описано в WO A-2007/023719 и WO A-2007/023764



в которой

R_E^1 представляет собой галоген, (C_1-C_4) -алкил, метокси, нитро, циано, CF_3 , OCF_3

5 Y_E, Z_E независимо представляют собой O или S,

n_E представляет собой целое число от 0 до 4,

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

R_E^3 представляет собой водород или (C_1-C_6) -алкил.

10 S11) Активные соединения типа оксиимино соединений (S11), которые известны в качестве средств для протравливания семян, например,

«оксабетринил» ((Z)-1,3-диоксолан-2-илметоксиимино(фенил)ацетонитрил) (S11-1), который известен в качестве сафенера для протравливания семян проса/сорго от повреждения метолахлором,

15 «флуксофеним» (1-(4-хлорфенил)-2,2,2-трифтор-1-этанон O-(1,3-диоксолан-2-илметил)оксим) (S11-2), который известен в качестве сафенера для протравливания семян проса/сорго от повреждения метолахлором, и

20 «циометринил» или «CGA-43089» ((Z)-цианометоксиимино(фенил)ацетонитрил) (S11-3), который известен в качестве сафенера для протравливания семян проса/сорго от повреждения метолахлором.

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

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

25 «нафталевый ангидрид» (ангидрид 1,8-нафталиндикарбоновой кислоты) (S13-1), который известен в качестве сафенера для протравливания семян кукурузы от повреждения тиокарбаматными гербицидами,

«фенклорим» (4,6-дихлор-2-фенилпиримидин) (S13-2), который известен в качестве сафенера для претилахлора в посевном рисе,

«флуразол» (бензил 2-хлор-4-трифторметил-1,3-тиазол-5-карбоксилат) (S13-3), который известен в качестве сафенера для протравливания семян

5 проса/сорго от повреждения алахлором и метолахлором,

«CL 304415» (CAS рег. № 31541-57-8)

(4-карбокси-3,4-дигидро-2H-1-бензопиран-4-уксусная кислота) (S13-4) от фирмы American Cyanamid, который известен в качестве сафенера для кукурузы от повреждения имидазолинонами,

10 «MG 191» (CAS рег. № 96420-72-3) (2-дихлорметил-2-метил-1,3-диоксолан) (S13-5) от Nitrokemia, который известен в качестве сафенера для кукурузы,

«MG 838» (CAS рег. № 133993-74-5)

(2-пропенил 1-окса-4-азаспиро[4.5]декан-4-карбодитиоат) (S13-6) от Nitrokemia

15 «дисульфотон» (О,О-диэтил S-2-этилтиоэтил фосфородитиоат) (S13-7),

«диэтолат» (О,О-диэтил О-фенил фосфоротиоат) (S13-8),

«мефенат» (4-хлорфенил метилкарбамат) (S13-9).

S14) Активные соединения, которые, в дополнение к гербицидному действию против вредных растений, также обладают действием сафенера на культурные растения, такие как рис, например,

20 «димепиперат» или «MY 93» (S-1-метил 1-фенилэтилпиперидин-1-карботиоат), который известен в качестве сафенера для риса от повреждения гербицидом молинат,

«даимурон» или «SK 23» (1-(1-метил-1-фенилэтил)-3-*n*-толилмочевина),

25 который известен в качестве сафенера для риса от повреждения гербицидом имазасульфурон,

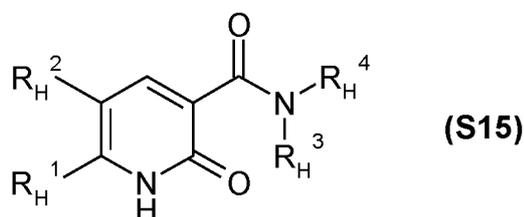
«кумилурон» = «JC 940» (3-(2-хлорфенилметил)-1-(1-метил-1-фенилэтил) мочевины, см. JP-A-60087254), который известен в качестве сафенера для риса от повреждения некоторыми гербицидами,

30 «метоксифенон» или «NK 049» (3,3'-диметил-4-метоксибензофенон),

который известен в качестве сафенера для риса от повреждения некоторыми гербицидами,

«CSB» (1-бром-4-(хлорметилсульфонил)бензол) от фирмы Kumiai, (рег. № CAS 54091-06-4), который известен в качестве сафенера от повреждения некоторыми гербицидами в рисе.

S15) Соединения формулы (S15) или их таутомеры



5

как описано в WO-A-2008/131861 и WO-A-2008/131860

в которой

R_H^1 представляет собой (C₁-C₆)-галогеналкильный радикал и

R_H^2 представляет собой водород или галоген и

10 R_H^3 , R_H^4 каждый независимо представляет собой водород, (C₁-C₁₆)-алкил, (C₂-C₁₆)-алкенил или (C₂-C₁₆)-алкинил,

где каждый из 3 последних радикалов является незамещенным или замещенным одним или несколькими радикалами из группы, включающей в себя галоген, гидроксил, циано, (C₁-C₄)-алкокси, (C₁-C₄)-галогеналкокси, (C₁-C₄)-
15 алкилтио, (C₁-C₄)-алкиламино, ди[(C₁-C₄)-алкил]амино, [(C₁-C₄)-алкокси]карбонил, [(C₁-C₄)-галогеналкокси]карбонил, (C₃-C₆)-циклоалкил, который является незамещенным или замещенным, фенил, который является незамещенным или замещенным, и гетероциклил, который является
незамещенным или замещенным,

20 или (C₃-C₆)-циклоалкил, (C₄-C₆)-циклоалкенил, (C₃-C₆)-циклоалкил, конденсированный на одной стороне кольца с 4 - 6- членным насыщенным или ненасыщенным карбоциклическим кольцом, или (C₄-C₆)-циклоалкенил, конденсированный на одной стороне кольца с 4 - 6-членным насыщенным или ненасыщенным карбоциклическим кольцом,

25 где каждый из 4 последних радикалов является незамещенным или замещенным одним или несколькими радикалами из группы, включающей в себя галоген, гидроксил, циано, (C₁-C₄)-алкил, (C₁-C₄)-галогеналкил, (C₁-C₄)-алкокси, (C₁-C₄)-галогеналкокси, (C₁-C₄)-алкилтио, (C₁-C₄)-алкиламино, ди[(C₁-C₄)-алкил]амино, [(C₁-C₄)-алкокси]карбонил, [(C₁-C₄)-галогеналкокси]карбонил, (C₃-

C₆)-циклоалкил, который является незамещенным или замещенным, фенил, который является незамещенным или замещенным, и гетероциклил, который является незамещенным или замещенным,

или

5 R_H³ представляет собой (C₁-C₄)-алкокси, (C₂-C₄)-алкенилокси, (C₂-C₆)-алкинилокси или (C₂-C₄)-галогеналкокси и

R_H⁴ представляет собой водород или (C₁-C₄)-алкил или

10 R_H³ и R_H⁴ вместе с непосредственно присоединенным атомом азота представляют собой 4 - 8-членное гетероциклическое кольцо, которое наряду с атомом азота, может также содержать дополнительные кольцевые гетероатомы, предпочтительно до двух дополнительных кольцевых гетероатомов из группы, включающей N, O и S, и которое является незамещенным или замещенным одним или несколькими радикалами из группы, включающей галоген, циано, нитро (C₁-C₄)-алкил, (C₁-C₄)-галогеналкил, (C₁-C₄)-алкокси, (C₁-C₄)-галогеналкокси и (C₁-C₄)-алкилтио.

S16) Активные соединения, которые применяют главным образом в качестве гербицидов, но также они обладают действием сафенеров на культурные растения, например,

20 (2,4-дихлорфенокси)уксусная кислота (2,4-D),
(4-хлорфенокси)уксусная кислота,
(R,S)-2-(4-хлор-о-толилокси)пропионовая кислота (мекопроп),
4-(2,4-дихлорфенокси)масляная кислота (2,4-DB),
(4-хлор-о-толилокси)уксусная кислота (MCPA),
4-(4-хлор-о-толилокси)масляная кислота,
25 4-(4-хлорфенокси)масляная кислота,
3,6-дихлор-2-метоксибензойная кислота (дикамба),
1-(этоксикарбонил)этил 3,6-дихлор-2-метоксибензоат (лактидихлор-этил).

Предпочтительные сафенеры в комбинации с соединениями общей формулы (I) в соответствии с изобретением и/или их соли и N-оксиды, в частности, с соединениями формул (I-001) - (I-015), их соли или N-оксиды, представляют собой: клоквинтоцет-мексил, ципросульфамид, фенхлоразол-этил, изоксадифен-этил, мефенпир-диэтил, фенкллорим, кумилурон, S4-1 и S4-5, и особенно предпочтительными сафенерами являются: клоквинтоцет-мексил, ципросульфамид, изоксадифен-этил и мефенпир-диэтил.

Биологические примеры:

В примерах и таблицах ниже используют следующие сокращения:

Исследуемые вредные растения:

	ABUTH: <i>Abutilon theophrasti</i>
5	ALOMY: <i>Alopecurus myosuroides</i>
	AMARE: <i>Amaranthus retroflexus</i>
	DIGSA: <i>Digitaria sanguinalis</i>
	ECHCG: <i>Echinochloa crus-galli</i>
	KCHSC: <i>Kochia scoparia</i>
10	LOLRI: <i>Lolium rigidum</i>
	MATIN: <i>Matricaria inodora</i>
	POAAN: <i>Poa annua</i>
	SETVI: <i>Setaria viridis</i>
	STEME: <i>Stellaria media</i>
15	VERPE: <i>Veronica persica</i>

А. Гербицидное довсходовое действие

Семена одно- и двудольных сорных растений высевали в пластиковые горшки (двойные посева по одному виду одно- и одному виду двудольных сорных растений на горшок), в песчаный суглинок и засыпали почвой.

Соединения в соответствии с изобретением, приготовленные в виде смачиваемых порошков (WP) или в виде эмульсионных концентратов (EC), затем наносили на поверхность покрывающей почвы в виде водной суспензии или эмульсии, с добавлением 0,5 % добавки, при норме расхода 600 литров воды на гектар (в пересчете). После обработки горшки помещали в теплицу и содержали в оптимальных условиях роста тестируемых растений. Визуальную оценку повреждения тестируемых растений проводят прибл. через 3 недели по сравнению с необработанными контрольными растениями (гербицидный эффект в процентах (%): 100 % эффект = растения погибли, 0 % эффект = как контрольные растения).

В таблицах А1 - А12 ниже показано воздействие избранных соединений общей формулы (I) в соответствии с таблицей 1 на различные вредные растения и норма внесения, соответствующая 1280 г/га, полученная с помощью экспериментальной процедуры, указанной выше.

Таблица А1

Номер примера	Дозировка [г/га]	ABUTH
I-003	1280	90
I-005	1280	90
I-013	1280	90

Таблица А2

Номер примера	Дозировка [г/га]	DIGSA
I-003	1280	90
I-005	1280	90

5

Таблица А3

Номер примера	Дозировка [г/га]	ECHCG
I-003	1280	90
I-005	1280	90
I-013	1280	90

Таблица А4

Номер примера	Дозировка [г/га]	KCHSC
I-003	1280	100
I-005	1280	100
I-006	1280	90
I-008	1280	90
I-010	1280	90
I-013	1280	90

Таблица А5

Номер примера	Дозировка [г/га]	LOLRI
I-003	1280	90
I-005	1280	100
I-006	1280	90
I-010	1280	90
I-013	1280	90

Таблица А6

Номер примера	Дозировка [г/га]	MATIN
I-002	1280	100
I-001	1280	90
I-003	1280	100
I-004	1280	90
I-005	1280	100
I-006	1280	100
I-009	1280	100
I-010	1280	100
I-011	1280	100
I-013	1280	100

Таблица А7

Номер примера	Дозировка [г/га]	POAAN
I-003	1280	100
I-005	1280	100
I-006	1280	90
I-007	1280	90
I-008	1280	90

5

Таблица А8

Номер примера	Дозировка [г/га]	SETVI
I-003	1280	100
I-004	1280	90
I-005	1280	100
I-006	1280	90
I-009	1280	100

Таблица А9

Номер примера	Дозировка [г/га]	STEME
I-002	1280	90
I-003	1280	100
I-004	1280	90

Номер примера	Дозировка [г/га]	STEME
I-005	1280	100
I-006	1280	100
I-007	1280	90
I-008	1280	90
I-009	1280	90
I-010	1280	100
I-011	1280	90
I-013	1280	100

Таблица А10

Номер примера	Дозировка [г/га]	VERPE
I-003	1280	90
I-005	1280	100
I-013	1280	90

Таблица А11

Номер примера	Дозировка [г/га]	AMARE
I-002	1280	100
I-003	1280	100
I-004	1280	100
I-005	1280	100
I-006	1280	90
I-007	1280	100
I-008	1280	100
I-010	1280	90
I-013	1280	90

5

Таблица А12

Номер примера	Дозировка [г/га]	ALOMY
I-005	1280	100

Как показывают результаты, различные соединения общей формулы (I) в соответствии с изобретением обладают очень хорошей гербицидной

довсходовой эффективностью против широкого спектра вредных одно- и двудольных растений, таких как *Abutilon theophrasti* (ABUTH), *Alopecurus myosuroides* (ALOMY), *Amaranthus retroflexus* (AMARE), *Digitaria sanguinalis* (DIGSA), *Echinochloa crus-galli* (ECHCG), *Kochia scoraria* (KCHSC), *Lolium rigidum* (LOLRI), *Matricaria inodora* (MATIN), *Poa annua* (POAAN), *Setaria viridis* (SETVI), *Stellaria media* (STEME) и *Veronica persica* (VERPE) при норме внесения 1280 г активного ингредиента на гектар.

В. Гербицидное послевсходовое действие

Семена одно- и двудольных сорных растений высевали в пластиковые горшки (двойные посеы по одному виду одно- и одному виду двудольных сорных растений на горшок) в песчаный суглинок, засыпали почвой, и выращивали в контролируемых условиях роста. Через 2-3 недели после посева тестируемые растения опрыскивали на стадии одного листка. Соединения в соответствии с изобретением, приготовленные в форме смачиваемых порошков (WP) или эмульгируемых концентратов (EC), распыляли на зеленые части растений в виде водной суспензии или эмульсии с добавлением 0,5% добавки, при норме расхода 600 литров воды на гектар (в пересчете). Тестируемые растения помещали в теплицу примерно на 3 недели в оптимальных условиях роста, и затем визуально оценивали действие препаратов в сравнении с необработанным контролем (гербицидное действие в процентах (%): 100 % эффект = растения погибли, 0 % эффект = как контрольные растения).

В таблицах В1-В12 ниже показано воздействие избранных соединений общей формулы (I) в соответствии с таблицей 1 на различные вредные растения при норме внесения, соответствующей 1280 г/га, полученной с помощью экспериментальной процедуры, указанной выше.

Таблица В1

Номер примера	Дозировка [г/га]	ABUTH
I-003	1280	90
I-006	1280	90
I-013	1280	90

Таблица В2

Номер примера	Дозировка [г/га]	ALOMY
I-005	1280	90
I-013	1280	90

Таблица В3

Номер примера	Дозировка [г/га]	ЕНСГ
I-003	1280	90
I-005	1280	90
I-010	1280	90
I-013	1280	90

5

Таблица В4

Номер примера	Дозировка [г/га]	КСНС
I-002	1280	90
I-003	1280	100
I-004	1280	90
I-005	1280	100
I-006	1280	100
I-008	1280	90

Таблица В5

Номер примера	Дозировка [г/га]	LOLRI
I-003	1280	90
I-005	1280	100
I-013	1280	90

Таблица В6

Номер примера	Дозировка [г/га]	MATIN
I-003	1280	100
I-004	1280	100
I-005	1280	100
I-008	1280	100

Номер примера	Дозировка [г/га]	MATIN
I-010	1280	90
I-013	1280	90

Таблица В7

Номер примера	Дозировка [г/га]	SETVI
I-004	1280	100
I-005	1280	100

Таблица В8

Номер примера	Дозировка [г/га]	POAAN
I-003	1280	100
I-005	1280	100
I-006	1280	90
I-008	1280	90
I-010	1280	90
I-013	1280	90

5

Таблица В9

Номер примера	Дозировка [г/га]	STEME
I-002	1280	90
I-003	1280	100
I-004	1280	100
I-005	1280	100
I-006	1280	100
I-008	1280	100
I-009	1280	90
I-010	1280	90
I-011	1280	90
I-013	1280	90

Таблица В10

Номер примера	Дозировка [г/га]	VERPE
I-002	1280	90
I-003	1280	100
I-004	1280	90
I-005	1280	100
I-006	1280	90
I-008	1280	90
I-010	1280	90
I-011	1280	90
I-013	1280	90

Таблица В11

Номер примера	Дозировка [г/га]	AMARE
I-002	1280	90
I-003	1280	100
I-004	1280	100
I-005	1280	100
I-006	1280	100
I-008	1280	100
I-009	1280	90
I-010	1280	90
I-013	1280	90

5 Таблица В12

Номер примера	Дозировка [г/га]	DIGSA
I-005	1280	100
I-006	1280	90

10 Как показывают результаты, различные соединения общей формулы (I) в соответствии с изобретением обладают очень хорошей гербицидной послевсходовой эффективностью против широкого спектра вредных одно- и двудольных растений, таких как *Abutilon theophrasti* (ABUTH), *Alopecurus myosuroides* (ALOMY), *Amaranthus retroflexus* (AMARE), *Digitaria sanguinalis* (DIGSA), *Echinochloa crus-galli* (ECHCG), *Kochia scoparia* (KCHSC), *Lolium*

rigidum (LOLRI), Matricaria inodora (MATIN), Poa annua (POAAN), Setaria viridis (SETVI), Stellaria media (STEME) и Veronica persica (VERPE) при норме внесения 1280 г активного ингредиента на гектар.

С. Гербицидное довсходовое действие

5 Семена одно- и двудольных сорных растений высевали в пластиковые горшки (двойные посевы по одному виду одно- и одному виду двудольных сорных растений на горшок) в песчаный суглинок, засыпали почвой. Соединения в соответствии с изобретением, приготовленные в виде смачиваемых порошков (WP) или эмульгируемых концентратов (EC), наносили на поверхность
10 покрываемой почвы в виде водной суспензии или в виде эмульсии, с добавлением 0,5 % добавки, при норме расхода 600 литров воды на гектар (в пересчете). После обработки горшки помещали в теплицу и выдерживали в оптимальных условиях для роста тестируемых растений. Визуальную оценку повреждения тестируемых растений проводили примерно через 3 недели по
15 сравнению с необработанным контролем (гербицидный эффект в процентах (%): 100 % эффект = растения погибли, 0 % эффект = как контрольные растения).

В таблицах С1 – С10 ниже показано воздействие избранных соединений общей формулы (I) в соответствии с таблицей 1 на различные вредные растения при норме внесения, соответствующей 320 г/га, полученной с помощью
20 экспериментальной процедуры, указанной выше.

Таблица С1

Номер примера	Дозировка [г/га]	KCHSC
I-003	320	90
I-005	320	100

Таблица С2

Номер примера	Дозировка [г/га]	LOLRI
I-003	320	90
I-005	320	100
I-006	320	90

Таблица С3

Номер примера	Дозировка [г/га]	MATIN
I-002	320	90
I-001	320	90
I-003	320	100
I-005	320	100
I-006	320	90
I-010	320	90
I-011	320	100
I-013	320	90

Таблица С4

Номер примера	Дозировка [г/га]	POAAN
I-003	320	90
I-005	320	100
I-006	320	90

5

Таблица С5

Номер примера	Дозировка [г/га]	SETVI
I-003	320	100
I-005	320	100
I-009	320	90

Таблица С6

Номер примера	Дозировка [г/га]	STEME
I-002	320	90
I-003	320	100
I-005	320	100
I-006	320	100
I-007	320	90
I-008	320	90
I-013	320	90

Таблица С7

Номер примера	Дозировка [г/га]	VERPE
I-003	320	90
I-005	320	90

Таблица С8

Номер примера	Дозировка [г/га]	AMARE
I-003	320	90
I-005	320	100
I-008	320	90

5 Таблица С9

Номер примера	Дозировка [г/га]	ECHCG
I-005	320	90

Таблица С10

Номер примера	Дозировка [г/га]	DIGSA
I-005	320	90

Как показывают результаты, различные соединения общей формулы (I) в соответствии с изобретением обладают очень хорошей гербицидной довсходовой эффективностью против широкого спектра вредных одно- и двудольных растений, таких как *Amaranthus retroflexus* (AMARE), *Digitaria sanguinalis* (DIGSA), *Echinochloa crus-galli* (ECHCG), *Kochia scoparia* (KCHSC), *Lolium rigidum* (LOLRI), *Matricaria inodora* (MATIN), *Poa annua* (POAAN), *Setaria viridis* (SETVI), *Stellaria media* (STEME) и *Veronica persica* (VERPE) при норме внесения 320 г активного ингредиента на гектар.

D. Гербицидное послевсходовое действие

Семена одно- и двудольных сорных растений высевали в пластиковые горшки (двойные посева по одному виду одно- и одному виду двудольных сорных растений на горшок) в песчаный суглинок, засыпали почвой и

выращивали в контролируемых условиях роста. Через 2-3 недели после посева тестируемые растения опрыскивали на стадии одного листка. Соединения в соответствии с изобретением, приготовленные в форме смачиваемых порошков (WP) или эмульгируемых концентратов (EC), распыляли на зеленые части растений в виде водной суспензии или эмульсии с добавлением 0,5 % добавки, при норме расхода 600 литров воды на гектар (в пересчете). Тестируемые растения помещали в теплицу примерно на 3 недели в оптимальных условиях роста, и затем визуально оценивали действие препаратов в сравнении с необработанным контролем (гербицидное действие в процентах (%): 100 % эффект = растения погибли, 0 % эффект = как контрольные растения).

В таблицах D1 - D9 ниже показано воздействие избранных соединений общей формулы (I) в соответствии с таблицей 1 на различные вредные растения при норме внесения, соответствующей 320 г/га, полученной с помощью экспериментальной процедуры, указанной выше.

Таблица D1

Номер примера	Дозировка [г/га]	KCHSC
I-003	320	90
I-005	320	100
I-006	1280	90

Таблица D2

Номер примера	Дозировка [г/га]	MATIN
I-003	320	90
I-005	320	100
I-010	320	90
I-013	320	90

Таблица D3

Номер примера	Дозировка [г/га]	POAAN
I-003	320	90
I-005	320	100
I-010	320	90
I-013	320	90

Таблица D4

Номер примера	Дозировка [г/га]	STEME
I-003	320	100
I-004	320	90
I-005	320	100
I-006	1280	90
I-010	320	90
I-013	320	90

Таблица D5

Номер примера	Дозировка [г/га]	VERPE
I-003	320	90
I-005	320	100
I-010	320	90
I-013	320	90

5

Таблица D6

Номер примера	Дозировка [г/га]	AMARE
I-003	320	100
I-004	320	100
I-005	320	100
I-006	320	90
I-008	320	90
I-013	320	90

Таблица D7

Номер примера	Дозировка [г/га]	ECHCG
I-013	320	90

10

Таблица D8

Номер примера	Дозировка [г/га]	SETVI
I-005	320	90

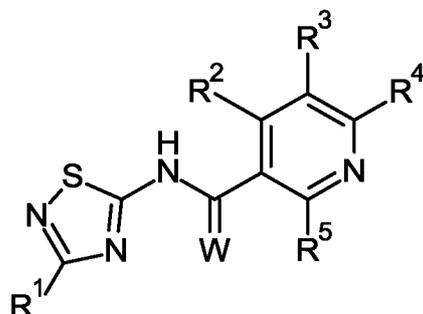
Таблица D9

Номер примера	Дозировка [г/га]	LOLRI
I-005	320	100

5 Как показывают результаты, различные соединения общей формулы (I) в соответствии с изобретением обладают очень хорошей гербицидной
послевсходовой эффективностью против широкого спектра вредных одно- и
двудольных растений, таких как *Amaranthus retroflexus* (AMARE), *Echinochloa*
crus-galli (ECHCG), *Kochia scoparia* (KCHSC), *Lolium rigidum* (LOLRI), *Matricaria*
10 *inodora* (MATIN), *Poa annua* (POAAN), *Setaria viridis* (SETVI), *Stellaria media*
(STEME) и *Veronica persica* (VERPE) при норме внесения 320 г активного
ингредиента на гектар.

ФОРМУЛА ИЗОБРЕТЕНИЯ

1. Замещенный 1,2,4-тиадиазолилникотинамид общей формулы (I) и/или его соли или N-оксиды



(I)

где

W представляет собой кислород или серу,

5 R¹ представляет собой водород, галоген, циано, (C₁-C₄)-алкил, (C₁-C₄)-галогеналкил, (C₃-C₆)-циклоалкил, (C₃-C₆)-галогенциклоалкил, (C₁-C₄)-алкокси, (C₁-C₄)-галогеналкокси, (C₁-C₄)-алкилтио, (C₁-C₄)-алкилсульфинил, (C₁-C₄)-алкилсульфонил, (C₁-C₄)-галогеналкилтио, (C₁-C₄)-галогеналкилсульфинил, (C₁-C₄)-галогеналкилсульфонил или (C₃-C₆)-циклоалкил-(C₁-C₄)-алкил,

15 R² представляет собой (C₂-C₄)-алкенил, (C₂-C₄)-галогеналкенил, (C₁-C₄)-галогеналкил-(C₂-C₄)-алкенил,

(C₃-C₆)-циклоалкил, (C₃-C₆)-галогенциклоалкил, (C₁-C₄)-алкил-(C₃-C₆)-циклоалкил, (C₁-C₄)-алкил-(C₃-C₆)-галогенциклоалкил, (C₁-C₄)-галогеналкил-(C₃-C₆)-циклоалкил, (C₁-C₄)-галогеналкил-(C₃-C₆)-галогенциклоалкил или (C₃-C₆)-циклоалкил-(C₃-C₆)-циклоалкил,

20 R³ представляет собой водород, галоген, циано, (C₁-C₄)-алкил, (C₁-C₄)-галогеналкил, (C₁-C₄)-алкокси или (C₁-C₄)-галогеналкокси,

R⁴ представляет собой водород, галоген, циано, (C₁-C₄)-алкил, (C₁-C₄)-галогеналкил, (C₁-C₄)-алкокси или (C₁-C₄)-галогеналкокси,

25 R⁵ представляет собой водород, галоген, циано, (C₁-C₄)-алкил, (C₁-C₄)-галогеналкил, (C₃-C₆)-циклоалкил, (C₃-C₆)-галогенциклоалкил (C₁-C₄)-алкокси, (C₁-C₄)-галогеналкокси, (C₁-C₄)-алкилтио, (C₁-C₄)-алкилсульфинил, (C₁-C₄)-алкилсульфонил, (C₁-C₄)-галогеналкилтио, (C₁-C₄)-галогеналкилсульфинил, (C₁-C₄)-галогеналкилсульфонил или (C₃-C₆)-циклоалкил-(C₁-C₄)-алкил.

2. Соединение общей формулы (I) по п. 1 и/или его соли или N-оксиды, отличающееся тем, что:

W представляет собой кислород или серу,

5 R¹ представляет собой водород, галоген, (C₁-C₄)-алкил, (C₁-C₄)-галогеналкил, (C₃-C₆)-циклоалкил,

(C₁-C₄)-алкокси, (C₁-C₄)-галогеналкокси или (C₁-C₄)-алкилтио,

10 R² представляет собой (C₂-C₄)-алкенил, (C₂-C₄)-галогеналкенил, (C₃-C₆)-циклоалкил, (C₃-C₆)-галогенциклоалкил, (C₁-C₄)-алкил-(C₃-C₆)-циклоалкил или (C₁-C₄)-алкил-(C₃-C₆)-галогенциклоалкил,

R³ представляет собой водород, галоген, (C₁-C₄)-алкил, (C₁-C₄)-галогеналкил или (C₁-C₄)-алкокси,

R⁴ представляет собой водород, галоген, (C₁-C₄)-алкил, (C₁-C₄)-галогеналкил или (C₁-C₄)-алкокси,

15 R⁵ представляет собой водород, галоген, (C₁-C₄)-алкил, (C₁-C₄)-галогеналкил, (C₃-C₆)-циклоалкил,

(C₁-C₄)-алкокси или (C₁-C₄)-галогеналкокси.

20 3. Соединение общей формулы (I) по п. 1 и/или его соли или N-оксиды, отличающееся тем, что:

W представляет собой кислород или серу, предпочтительно кислород,

R¹ представляет собой водород, галоген, (C₁-C₄)-алкил или (C₁-C₄)-галогеналкил,

25 R² представляет собой (C₂-C₄)-алкенил, (C₂-C₄)-галогеналкенил, (C₃-C₆)-циклоалкил, (C₃-C₆)-галогенциклоалкил или (C₁-C₄)-алкил-(C₃-C₆)-циклоалкил,

R³ представляет собой водород, галоген или (C₁-C₄)-алкил,

R⁴ представляет собой водород, галоген или (C₁-C₄)-алкил,

30 R⁵ представляет собой водород, галоген, (C₁-C₄)-алкил, (C₁-C₄)-галогеналкил, (C₁-C₄)-алкокси или (C₃-C₆)-циклоалкил.

4. Соединение общей формулы (I) по п. 1 и/или его соли или N-оксиды, отличающееся тем, что:

W представляет собой кислород,

R¹ представляет собой водород, галоген или (C₁-C₄)-алкил,

R^2 представляет собой (C_2-C_4) -алкенил, (C_3-C_6) -циклоалкил, (C_3-C_6) -галогенциклоалкил или (C_1-C_4) -алкил- (C_3-C_6) -циклоалкил,

R^3 представляет собой водород,

R^4 представляет собой водород,

5 R^5 представляет собой водород, галоген, (C_1-C_4) -галогеналкил, (C_1-C_4) -алкокси или (C_3-C_6) -циклоалкил.

5. Соединение общей формулы (I) по п. 1 и/или его соли или N-оксиды, отличающееся тем, что:

10 W представляет собой кислород,

R^1 представляет собой водород, хлор, бром, метил, этил или *трет*-бутил,

R^2 представляет собой проп-1-ен-2-ил, циклопропил, 2-метилциклопропил или

2,2-дифторциклопропил,

15 R^3 представляет собой водород,

R^4 представляет собой водород,

R^5 представляет собой водород, фтор, хлор, трифторметил, метокси или циклопропил.

20 6. Соединение общей формулы (I) по п. 1 и/или его соли или N-оксиды, отличающееся тем, что:

W представляет собой кислород,

R^1 представляет собой водород, хлор, бром или метил,

25 R^2 представляет собой проп-1-ен-2-ил, циклопропил, 2-метилциклопропил или

2,2-дифторциклопропил,

R^3 представляет собой водород,

R^4 представляет собой водород,

R^5 представляет собой водород, фтор, хлор, трифторметил или метокси.

30

7. Применение одного или нескольких соединений общей формулы (I) и/или его солей или N-оксидов по любому из пп. 1 - 6 в качестве гербицидов и/или регуляторов роста растений.

8. Гербицидная и/или регулирующая рост растений композиция, отличающаяся тем, что композиция содержит одно или несколько соединений формулы (I) и/или их соли или N-оксиды по любому из пп. 1 - 6 и одно или несколько дополнительных веществ, выбранных из групп (i) и/или (ii), с

5 (i) одним или несколькими дополнительными агрохимически активными веществами, выбранными из группы, включающей в себя инсектициды, акарициды, нематоциды, другие гербициды, фунгициды, сафенеры, удобрения и/или другие регуляторы роста,

10 (ii) одним или несколькими вспомогательными средствами для составов, используемых в защите растений.

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

15 - одного или нескольких соединений формулы (I) и/или их солей или N-оксидов по любому из пп. 1 - 6 или

- композиции по п. 8,

наносят на растения, семена растений, почву, в которой или на которой растения растут или возделываемую площадь.