



УКРАЇНА

(19) **UA** (11) **113762** (13) **C2**  
(51) МПК (2017.01)**A01N 43/90** (2006.01)**C07D 405/12** (2006.01)**C07D 209/70** (2006.01)

A01P 21/00

ДЕРЖАВНА СЛУЖБА  
ІНТЕЛЕКТУАЛЬНОЇ  
ВЛАСНОСТІ  
УКРАЇНИ**(12) ОПИС ДО ПАТЕНТУ НА ВІНАХІД**

<b>(21)</b> Номер заявки: <b>а 2014 13458</b>	<b>(72)</b> Винахідник(и): <b>Вільд'є-Першерон Емманюель (CH), Лашья Матільд Деніз (CH), де Месмекер Ален (CH), Вольф Ханно Крістіан (CH), Юнг П'єр Жозеф Марсель (CH), Ланфермейєр Франсіскус (NL), ван ден Вейнгард Паул (NL), Скрепанті Клаудіо (CH)</b>
<b>(22)</b> Дата подання заявки: <b>22.05.2013</b>	<b>(73)</b> Власник(и): <b>СІНГЕНТА ПАРТІСІПЕЙШНС АГ, Schwarzwaldallee 215, CH-4058 Basel, Switzerland (CH)</b>
<b>(24)</b> Дата, з якої є чинними права на винахід: <b>10.03.2017</b>	<b>(74)</b> Представник: <b>Петров Андрій Володимирович, реєстр. №139</b>
<b>(31)</b> Номер попередньої заявки відповідно до Паризької конвенції: <b>1209307.6, 12188735.0</b>	<b>(56)</b> Перелік документів, взятих до уваги експертизою: <b>WO 2010/125065 A2, 04.11.2010</b>
<b>(32)</b> Дата подання попередньої заявки відповідно до Паризької конвенції: <b>24.05.2012, 16.10.2012</b>	
<b>(33)</b> Код держави-учасниці Паризької конвенції, до якої подано попередню заявку: <b>GB, EP</b>	
<b>(41)</b> Публікація відомостей про заявку: <b>10.02.2015, Бюл.№ 3</b>	
<b>(46)</b> Публікація відомостей про видачу патенту: <b>10.03.2017, Бюл.№ 5</b>	
<b>(86)</b> Номер та дата подання міжнародної заявки, поданої відповідно до Договору РСТ <b>РСТ/EP2013/060470, 22.05.2013</b>	

**(54) СПОЛУКИ, ЩО РЕГУЛЮЮТЬ РІСТ РОСЛИН****(57) Реферат:**

Даний винахід належить до нових похідних стриголактаму, до способів і проміжних сполук для їх одержання, до композицій для регуляції росту рослин, що містять їх, і до способів їх застосування для контролю росту рослин та/або стимуляції проростання насіння.

UA 113762 C2

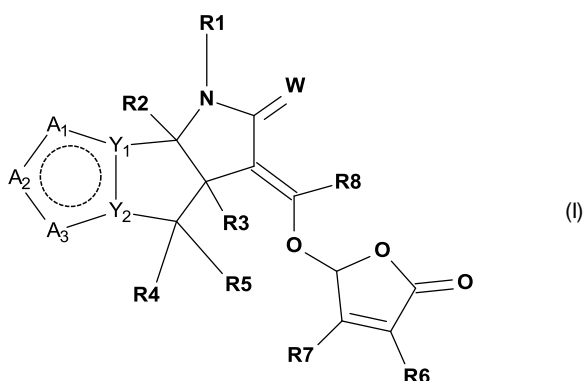


Даний винахід відноситься до нових похідних стриголактаму, до способів та проміжних сполук для їх одержання, до композицій для регуляції росту рослин, що містять їх, та до способів їх застосування для контролю росту рослин та/або стимуляції проростання насіння.

Похідні стриголактону являють собою фітогормони, здатні регулювати ріст рослин та проростання насіння; вони були описані, наприклад, у WO2009/138655, WO2010/125065, WO05/077177, WO06/098626, WO11/125714 та Annual Review of Phytopathology (2010), 48 p.93-117. Відомо, що похідні стриголактону, подібно до синтетичного аналога GR24, діють на проростання паразитичних бур'янистих рослин, таких як види *Orobanche*. З рівня техніки добре відомо, що тестування на проростання насіння *Orobanche* являє собою тест, застосовуваний для ідентифікації аналогів стриголактону (див., наприклад, Plant and Cell Physiology (2010), 51(7) p.1095; та Organic & Biomolecular Chemistry (2009), 7(17), p.3413).

У даний час було несподівано виявлено, що деякі похідні стриголактаму мають властивості, аналогічні до стриголактону.

Відповідно до даного винаходу пропонується сполука формули (I),



де

W являє собою O або S;

R2 та R3 незалежно являють собою водень або C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>алкіл;

R4 та R5 незалежно являють собою водень, галоген, нітро, ціано, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>алкіл, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>галогеналкіл, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>алкокси, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>галогеналкокси, гідроксил, -OC(O)R<sub>9</sub>, амін, N-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>алкіламін або N, N-ди-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>алкіламін;

R<sub>9</sub> являє собою водень, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>алкіл, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>алкокси або C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>галогеналкіл;

R6 та R7 незалежно являють собою водень, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>алкіл, гідроксил, галоген або C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>алкокси;

R8 являє собою водень, нітро, ціано, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>алкіл або C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>галогеналкіл;

R1 являє собою водень, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>алкокси, гідроксил, амін, N-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>алкіламін, N, N-ди-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>алкіламін, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>алкіл, необов'язково заміщений одним - п'ятьма R<sub>10</sub>, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>алкілкарбоніл- або C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>алкоксикарбоніл-, арил, необов'язково заміщений одним - п'ятьма R<sub>10</sub>, гетероарил, необов'язково заміщений одним - п'ятьма R<sub>10</sub>, гетероцикліл, необов'язково заміщений одним - п'ятьма R<sub>10</sub>, бензил, необов'язково заміщений одним - п'ятьма R<sub>10</sub>, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>алкеніл, необов'язково заміщений одним - п'ятьма R<sub>10</sub>, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>алкініл, необов'язково заміщений одним - п'ятьма R<sub>10</sub>, C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>циклоалкіл або C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub>циклоалкіл, заміщений одним - п'ятьма R<sub>10</sub>;

R<sub>10</sub> являє собою ціано, нітро, галоген, гідроксил, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>алкіл, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>алкокси, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>галогеналкокси, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>галогеналкіл, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>алкілтіо-, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>галогеналкілтіо-, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>алкілсульфініл-, N-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>алкіламін, N, N-ди-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>алкіламін, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>галогеналкілсульфініл-, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>алкілсульфоніл-, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>галогеналкілсульфоніл-, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>алкілкарбоніл-, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>алкоксикарбоніл, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>алкеніл або C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>алкініл;

кожний з Y<sub>1</sub> та Y<sub>2</sub> незалежно являє собою C або азот;

кожний з A<sub>1</sub>, A<sub>2</sub> та A<sub>3</sub> незалежно являє собою C-X, кисень, сірку, азот або N-X, де кожний X може бути однаковим або різним, за умови, що A<sub>1</sub>, A<sub>2</sub>, A<sub>3</sub>, Y<sub>1</sub> та Y<sub>2</sub> утворюють ароматичне кільце;

та X являє собою водень, галоген, ціано, нітро, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>галогеналкіл, гідроксил, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>алкокси, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>галогеналкокси, амін, N-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>алкіламін, N, N-ди-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>алкіламін, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>алкіл, необов'язково заміщений одним - п'ятьма R<sub>10</sub>, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>алкілкарбоніл- або C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>алкоксикарбоніл-, N-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>алкіламінокарбоніл, N, N-ди-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>алкіламінокарбоніл, арил, необов'язково заміщений одним - п'ятьма R<sub>10</sub>, гетероарил, необов'язково заміщений одним - п'ятьма R<sub>10</sub>, гетероцикліл, необов'язково заміщений одним - п'ятьма R<sub>10</sub>, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>алкеніл, необов'язково заміщений одним - п'ятьма R<sub>10</sub>, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>алкініл, необов'язково заміщений одним - п'ятьма R<sub>10</sub>, C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>циклоалкіл, C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub>циклоалкіл, заміщений одним - п'ятьма R<sub>10</sub>, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>алкілтіо-, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>галогеналкілтіо-, C<sub>1</sub>-

$C_8$ алкілсульфініл-,  $C_1$ - $C_8$ галогеналкілсульфініл-,  $C_1$ - $C_8$ алкілсульфоніл- або  $C_1$ - $C_8$ галогеналкілсульфоніл;  
або її солі або N-Оксиди.

5 Сполуки формули (I) можуть існувати у вигляді різних геометричних або оптичних ізомерів (діастереоізомерів та енантіомерів) або таутомерних форм. Даний винахід охоплює всі такі ізомери та таутомери та їх суміші у всіх співвідношеннях, а також ізотопні форми, такі як дейтеровані сполуки. Даний винахід також охоплює всі солі, N-оксиди та металоїдні комплекси сполук формули (I).

10 Кожний алкільний фрагмент або окремо, або як частина більшої групи (такої як алкоксі, алкоксикарбоніл, алкілкарбоніл, алкіламінокарбоніл, діалкіламінокарбоніл, алкілтіо, алкілсульфініл, алкілсульфоніл) характеризується лінійним або розгалуженим ланцюгом і являє собою, наприклад, метил, етил, н-пропіл, н-бутил, н-пентил, н-гексил, ізопропіл, н-бутил, втор-бутил, ізобутил, трет-бутил або нео-пентил. Алкільні групи переважно являють собою  $C_1$ - $C_6$ алкільні групи, більш переважно  $C_1$ - $C_4$  та найбільше переважно  $C_1$ - $C_3$ алкільні групи.

15 Кожний алкенільний фрагмент або окремо, або як частина більшої групи (такої як алкоксі, алкоксикарбоніл, алкілкарбоніл, алкіламінокарбоніл, діалкіламінокарбоніл, алкілтіо, алкілсульфініл, алкілсульфоніл) містить щонайменше один подвійний зв'язок вуглець-вуглець і являє собою, наприклад, вініл, аліл. Алкенільні групи переважно являють собою  $C_2$ - $C_6$ алкенільні групи, більш переважно  $C_2$ - $C_4$ алкенільні групи.

20 Використовуваний у даному документі вираз "алкеніл", якщо не зазначене інше, включає алкільні фрагменти, що містять щонайменше один подвійний зв'язок вуглець-вуглець, де алкіл визначений вище.

25 Кожний алкінільний фрагмент або окремо, або як частина більшої групи (такої як алкоксі, алкоксикарбоніл, алкілкарбоніл, алкіламінокарбоніл, діалкіламінокарбоніл, алкілтіо, алкілсульфініл, алкілсульфоніл) містить щонайменше один потрійний зв'язок вуглець-вуглець і являє собою, наприклад, етиніл, пропаргіл. Алкінільні групи переважно являють собою  $C_2$ - $C_6$ алкінільні групи, більш переважно  $C_2$ - $C_4$ алкінільні групи.

30 Використовуваний у даному документі вираз "алкініл", якщо не зазначене інше, включає алкільні фрагменти, що містять щонайменше один потрійний зв'язок вуглець-вуглець, де алкіл визначений вище.

Галоген являє собою фтор, хлор, бром або йод.

35 Галогеналкільними групами (або окремо, або як частина більшої групи, такої як галогеналкоксі або галогеналкілтіо) є алкільні групи, які заміщені одним або декількома однаковими або різними атомами галогену та являють собою, наприклад,  $-CF_3$ ,  $-CF_2Cl$ ,  $-CH_2CF_3$  або  $-CH_2CHF_2$ .

Гідроксіалкільними групами є алкільні групи, які заміщені однією або декількома гідроксильними групами та являють собою, наприклад,  $-CH_2OH$ ,  $-CH_2CH_2OH$  або  $-CH(OH)CH_3$ .

40 У контексті даного опису вираз "арил" відноситься до кільцевої системи, яка може бути моно-, бі- або трициклічною. Приклади таких кілець включають феніл, нафталеніл, антраценіл, інденіл або фенантреніл. Переважною арильною групою є феніл.

45 Якщо не зазначене інше, алкеніл та алкініл самі по собі або як частина іншого замісника можуть характеризуватися лінійним або розгалуженим ланцюгом та можуть переважно містити від 2 до 6 атомів вуглецю, переважно від 2 до 4, більш переважно від 2 до 3, та за необхідності можуть бути або в (E)-, або в (Z)-конфігурації. Приклади включають вініл, аліл, етиніл та пропаргіл.

50 Якщо не зазначене інше, циклоалкіл може бути моно- або біциклічним, може бути необов'язково заміщеним однією або декількома  $C_1$ - $C_6$ алкільними групами та переважно містить від 3 до 7 атомів вуглецю, більш переважно від 3 до 6 атомів вуглецю. Приклади циклоалкілу включають циклопропіл, 1-метилциклопропіл, 2-метилциклопропіл, циклобутил, циклопентил та циклогексил.

55 Вираз "гетероарил" відноситься до ароматичної кільцевої системи, що містить щонайменше один гетероатом та складається або з одного кільця, або з двох або більше конденсованих кілець. Переважно окремі кільця будуть містити щонайбільше три, а біциклічні системи щонайбільше чотири гетероатоми, які переважно будуть вибрані з азоту, кисню та сірки. Приклади таких груп включають піридил, піридазиніл, піримідиніл, піразиніл, фураніл, тіофеніл, оксазоліл, ізоксазоліл, оксадіазоліл, тіазоліл, ізотіазоліл, тіадіазоліл, піроліл, піразоліл, імідазоліл, тριαзоліл та тетразоліл.

Вираз "гетероцикліл" визначається як такий, що включає гетероарил та на додаток його ненасичені або частково ненасичені аналоги, такі як 4,5,6,7-тетрагідро-бензотіофеніл, 9H-

фтореніл, 3,4-дигідро-2Н-бензо-1,4-діоксепініл, 2,3-дигідро-бензофураніл, піперидиніл, 1,3-діоксоланіл, 1,3-діоксаніл, 4,5-дигідро-ізоксазоліл, тетрагідрофураніл та морфолініл.

Переважні значення W, R2, R3, R4, R5, R6, R7, R8, R1, R10, A<sub>1</sub>, A<sub>2</sub>, A<sub>3</sub>, Y<sub>1</sub>, Y<sub>2</sub> та X у будь-якій комбінації викладені нижче.

5 W переважно являє собою кисень.

R2 переважно являє собою водень, метил або етил; більш переважно R2 являє собою водень.

R3 переважно являє собою водень, метил або етил; більш переважно R3 являє собою водень.

10 R4 переважно являє собою водень, гідроксил, метил або етил; більш переважно R4 являє собою водень або гідроксил.

R5 переважно являє собою водень, гідроксил, метил або етил; більш переважно R5 являє собою водень або гідроксил.

15 R6 переважно являє собою водень, метил або етил; більш переважно R6 являє собою метил.

R7 переважно являє собою водень, метил або етил; більш переважно R7 являє собою водень.

R8 переважно являє собою водень, метил або етил; більш переважно R8 являє собою водень.

20 R1 переважно вибраний з групи, що складається з водню, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>алкілу, необов'язково заміщеного одним - п'ятьма R10, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>алкілкарбонілу- або C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>алкоксикарбонілу-, арилу, необов'язково заміщеного одним - п'ятьма R10, або гетероарилу, необов'язково заміщеного одним - п'ятьма R10, гетероциклілу, необов'язково заміщеного одним - п'ятьма R10, бензилу, необов'язково заміщеного одним - п'ятьма R10. Більш переважно R1 являє собою водень, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>алкіл, необов'язково заміщений одним - п'ятьма R10, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>алкілкарбоніл-, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>алкоксикарбоніл-, бензил, необов'язково заміщений одним - п'ятьма R10, або арил, необов'язково заміщений одним - п'ятьма R10. Ще більш переважно R1 являє собою водень, метил, етил, феніл, бензил, ацетат, метоксикарбоніл або трет-бутоксикарбоніл.

25 R10 незалежно являє собою ціано, нітро, галоген, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>алкіл, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>алкоксі або C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>галогеналкіл. Більш переважно R10 являє собою водень, ціано, нітро, хлорид, бром, фтор, метил, метоксі або трифторметил.

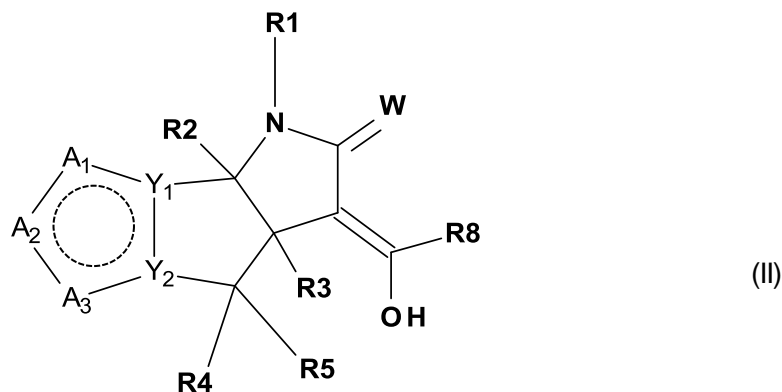
Y<sub>1</sub> переважно являє собою вуглець.

Y<sub>2</sub> переважно являє собою вуглець.

35 Переважно один з A<sub>1</sub>, A<sub>2</sub> або A<sub>3</sub> являє собою сірку, кисень або N-X; інший з A<sub>1</sub>, A<sub>2</sub> або A<sub>3</sub> являє собою C-X або N; та останній з A<sub>1</sub>, A<sub>2</sub> або A<sub>3</sub> являє собою C-X. Більш переважно один з A<sub>1</sub>, A<sub>2</sub> або A<sub>3</sub> являє собою сірку, кисень або N-X; а інші групи являють собою C-X. Ще більш переважно один з A<sub>1</sub>, A<sub>2</sub> або A<sub>3</sub> являє собою сірку, а інші групи являють собою C-X. В одному варіанті здійснення A<sub>1</sub> та A<sub>2</sub> являють собою C-X, а A<sub>3</sub> являє собою сірку.

40 X переважно являє собою водень, гідроксил, галоген, ціано, метил, етил, н-пропіл, гідроксиметил, трифторметил або метоксі. Більш переважно X являє собою водень, гідроксил, метил, трифторметил або метоксі. Найбільш переважно X являє собою водень, метил, метоксі або трифторметил.

У переважному варіанті здійснення сполука представлена формулою II,



45

де

W являє собою O або S;

R2 та R3 незалежно являють собою водень або C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>алкіл;

R4 та R5 незалежно являють собою водень, галоген, нітро, ціано, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>алкіл, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>галогеналкіл, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>алкокси, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>галогеналкокси, гідроксил, -OC(O)R<sub>9</sub>, амін, N-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>алкіламін або N, N-ди-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>алкіламін;

R<sub>9</sub> являє собою водень, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>алкіл, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>алкокси або C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>галогеналкіл;

5 R<sub>8</sub> являє собою водень, нітро, ціано, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>алкіл або C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>галогеналкіл;

R<sub>1</sub> являє собою водень, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>алкокси, гідроксил, амін, N-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>алкіламін, N, N-ди-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>алкіламін, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>алкіл, необов'язково заміщений одним - п'ятьма R<sub>10</sub>, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>алкілкарбоніл- або C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>алкоксикарбоніл-, арил, необов'язково заміщений одним - п'ятьма R<sub>10</sub>, або гетероарил, необов'язково заміщений одним - п'ятьма R<sub>10</sub>, гетероцикліл, необов'язково заміщений одним - п'ятьма R<sub>10</sub>, бензил, необов'язково заміщений одним - п'ятьма R<sub>10</sub>, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>алкеніл, необов'язково заміщений одним - п'ятьма R<sub>10</sub>, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>алкініл, необов'язково заміщений одним - п'ятьма R<sub>10</sub>, C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>циклоалкіл або C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub>циклоалкіл, заміщений одним - п'ятьма R<sub>10</sub>;

10 R<sub>10</sub> являє собою ціано, нітро, галоген, гідроксил, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>алкіл, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>алкокси, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>галогеналкокси, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>галогеналкіл, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>алкілтіо-, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>галогеналкілтіо-, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>алкілсульфініл-, N-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>алкіламін, N, N-ди-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>алкіламін, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>галогеналкілсульфініл-, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>алкілсульфоніл-, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>галогеналкілсульфоніл-, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>алкілкарбоніл-, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>алкоксикарбоніл, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>алкеніл або C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>алкініл;

кожний з Y<sub>1</sub> та Y<sub>2</sub> незалежно являє собою C або азот;

20 кожний з A<sub>1</sub>, A<sub>2</sub> та A<sub>3</sub> незалежно являє собою C-X, кисень, сірку, азот або N-X, де кожний X може бути однаковим або різним, за умови, що A<sub>1</sub>, A<sub>2</sub>, A<sub>3</sub>, Y<sub>1</sub> та Y<sub>2</sub> утворюють ароматичне кільце;

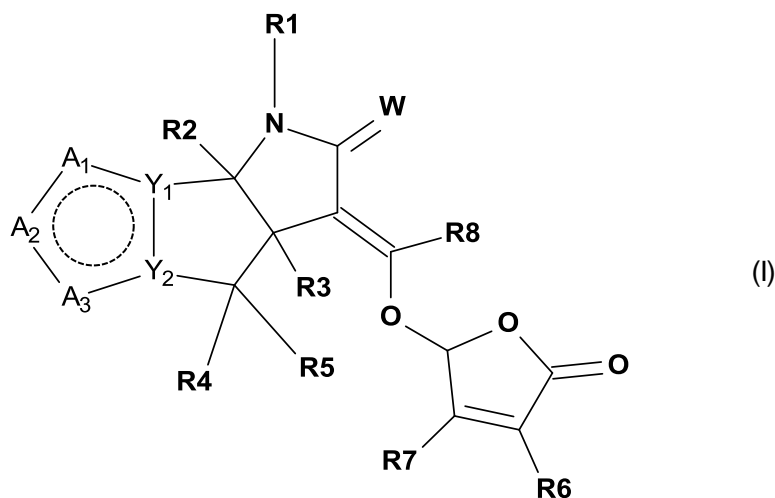
25 та X являє собою водень, галоген, ціано, нітро, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>галогеналкіл, гідроксил, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>алкокси, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>галогеналкокси, амін, N-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>алкіламін, N, N-ди-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>алкіламін, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>алкіл, необов'язково заміщений одним - п'ятьма R<sub>10</sub>, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>алкілкарбоніл- або C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>алкоксикарбоніл-, N-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>алкіламінокарбоніл, N, N-ди-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>алкіламінокарбоніл, арил, необов'язково заміщений одним - п'ятьма R<sub>10</sub>, гетероарил, необов'язково заміщений одним - п'ятьма R<sub>10</sub>, гетероцикліл, необов'язково заміщений одним - п'ятьма R<sub>10</sub>, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>алкеніл, необов'язково заміщений одним - п'ятьма R<sub>10</sub>, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>алкініл, необов'язково заміщений одним - п'ятьма R<sub>10</sub>, C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>циклоалкіл, C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub>циклоалкіл, заміщений одним - п'ятьма R<sub>10</sub>, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>алкілтіо-, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>галогеналкілтіо-, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>алкілсульфініл-, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>галогеналкілсульфініл-, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>алкілсульфоніл- або C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>галогеналкілсульфоніл;

або її солі або N-оксиди.

Переважні значення для A<sub>1</sub>, A<sub>2</sub>, A<sub>3</sub>, Y<sub>1</sub>, Y<sub>2</sub>, R<sub>1</sub>, R<sub>2</sub>, R<sub>3</sub>, R<sub>4</sub>, R<sub>5</sub>, R<sub>8</sub>, X та W є такими ж, як і переважні значення, викладені для відповідних замісників сполук формули (I).

35 У таблиці 1 нижче включені приклади сполук формули (I), де W являє собою O, R<sub>2</sub> являє собою H, R<sub>3</sub> являє собою H, R<sub>4</sub> являє собою H, R<sub>5</sub> являє собою H, R<sub>6</sub> являє собою метил, R<sub>7</sub> являє собою H, R<sub>8</sub> являє собою H, а A<sub>1</sub>, A<sub>2</sub>, A<sub>3</sub>, Y<sub>1</sub>, Y<sub>2</sub> та R<sub>1</sub> є такими, як визначено.

Таблиця 1



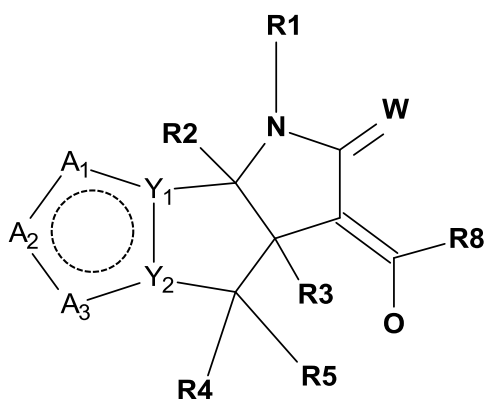
Сполука	R1	Y <sub>1</sub>	Y <sub>2</sub>	A <sub>1</sub>	A <sub>2</sub>	A <sub>3</sub>
1.00	H	C	C	C-H	C-H	S
1.01	H	C	C	C-H	C-H	O
1.02	H	C	C	C-H	C-H	N-H
1.03	H	C	C	C-H	C-H	N-Me
1.04	H	C	C	C-H	S	C-H
1.05	H	C	C	C-H	O	C-H
1.06	H	C	C	C-H	N-H	C-H
1.07	H	C	C	C-H	N-Me	C-H
1.08	H	C	C	S	C-H	C-H
1.09	H	C	C	O	C-H	C-H
1.10	H	C	C	N-H	C-H	C-H
1.11	H	C	C	N-Me	C-H	C-H
1.12	H	C	C	C-H	N	O
1.13	H	C	C	C-H	O	N
1.14	H	C	C	N	O	C-H
1.15	H	C	C	O	N	C-H
1.16	H	C	C	C-H	N	S
1.17	H	C	C	C-H	S	N
1.18	H	C	C	N	S	C-H
1.19	H	C	C	S	N	C-H
1.20	H	C	C	O	C-H	N
1.21	H	C	C	N	C-H	O
1.22	H	C	C	S	C-H	N
1.23	H	C	C	N	C-H	S
1.24	H	C	C	C-H	N	N-H
1.25	H	C	C	C-H	N	N-Me
1.26	H	C	C	N	C-H	N-H
1.27	H	C	C	N	C-H	N-Me
1.28	H	C	C	N-H	C-H	N
1.29	H	C	C	N-Me	C-H	N
1.30	H	C	C	N	N-H	C-H
1.31	H	C	C	N	N-Me	C-H
1.32	H	C	C	N-Me	N	N
1.33	H	C	C	N-H	N	N
1.34	H	C	C	N	N	N-Me
1.35	H	C	C	N	N	N-H
1.36	H	C	N	N	N	N
2.00	H	C	C	C-H	C-Me	S
2.01	H	C	C	C-H	C-Me	O
2.02	H	C	C	C-Me	C-H	S
2.03	H	C	C	C-Me	C-H	O
2.04	H	C	C	C-H	C-Me	N-H
2.05	H	C	C	C-H	C-Me	N-Me
2.06	H	C	C	S	C-H	C-Me
2.07	H	C	C	O	C-H	C-Me
2.08	H	C	C	N-H	C-H	C-Me
2.09	H	C	C	N-Me	C-H	C-Me
2.10	H	C	C	S	C-Me	C-H
2.11	H	C	C	O	C-Me	C-H
2.12	H	C	C	N-H	C-Me	C-H
2.13	H	C	C	N-Me	C-Me	C-H
2.14	H	C	C	C-Me	N	O
2.15	H	C	C	C-Me	O	N
2.16	H	C	C	N	O	C-Me
2.17	H	C	C	O	N	C-Me
2.18	H	C	C	C-Me	N	S
2.19	H	C	C	C-Me	S	N

2.20	H	C	C	N	S	C-Me
2.21	H	C	C	S	N	C-Me
2.22	H	C	C	O	C-Me	N
2.23	H	C	C	N	C-Me	O
2.24	H	C	C	S	C-Me	N
2.25	H	C	C	N	C-Me	S
2.26	H	C	C	C-Me	N	N-H
2.27	H	C	C	C-Me	N	N-Me
2.28	H	C	C	N	C-Me	N-H
2.29	H	C	C	N	C-Me	N-Me
2.30	H	C	C	N-H	C-Me	N
2.31	H	C	C	N-Me	C-Me	N
2.32	H	C	C	N	N-H	C-Me
2.33	H	C	C	N	N-Me	C-Me
3.00	Me	C	C	C-H	C-H	S
3.01	Me	C	C	C-H	C-H	O
3.02	Me	C	C	C-H	C-H	NH
3.03	Me	C	C	C-H	C-H	N-Me
3.04	Me	C	C	C-H	S	C-H
3.05	Me	C	C	C-H	O	C-H
3.06	Me	C	C	C-H	N-H	C-H
3.07	Me	C	C	C-H	N-Me	C-H
3.08	Me	C	C	S	C-H	C-H
3.09	Me	C	C	O	C-H	C-H
3.10	Me	C	C	N-H	C-H	C-H
3.11	Me	C	C	N-Me	C-H	C-H
3.12	Me	C	C	C-H	N	O
3.13	Me	C	C	C-H	O	N
3.14	Me	C	C	N	O	C-H
3.15	Me	C	C	O	N	C-H
3.16	Me	C	C	C-H	N	S
3.17	Me	C	C	C-H	S	N
3.18	Me	C	C	N	S	C-H
3.19	Me	C	C	S	N	C-H
3.20	Me	C	C	O	C-H	N
3.21	Me	C	C	N	C-H	O
3.22	Me	C	C	S	C-H	N
3.23	Me	C	C	N	C-H	S
3.24	Me	C	C	C-H	N	N-H
3.25	Me	C	C	C-H	N	N-Me
3.26	Me	C	C	N	C-H	N-H
3.27	Me	C	C	N	C-H	N-Me
3.28	Me	C	C	N-H	C-H	N
3.29	Me	C	C	N-Me	C-H	N
3.30	Me	C	C	N	N-H	C-H
3.31	Me	C	C	N	N-Me	C-H
3.33	Me	C	C	N-Me	N	N
3.34	Me	C	C	N-H	N	N
3.35	Me	C	C	N	N	N-Me
3.36	Me	C	C	N	N	N-H
3.37	Me	C	N	N	N	N

У таблиці 2 нижче включені приклади сполук формули (II), де W являє собою O, R2 являє собою H, R3 являє собою H, R4 являє собою H, R5 являє собою H, R8 являє собою H, а R1, A<sub>1</sub>, A<sub>2</sub>, A<sub>3</sub>, Y<sub>1</sub> та Y<sub>2</sub> є такими, як визначено.



Таблиця 2



Сполука	R1	Y <sub>1</sub>	Y <sub>2</sub>	A <sub>1</sub>	A <sub>2</sub>	A <sub>3</sub>
1.00	H	C	C	C-H	C-H	S
1.01	H	C	C	C-H	C-H	O
1.02	H	C	C	C-H	C-H	N-H
1.03	H	C	C	C-H	C-H	N-Me
1.04	H	C	C	C-H	S	C-H
1.05	H	C	C	C-H	O	C-H
1.06	H	C	C	C-H	N-H	C-H
1.07	H	C	C	C-H	N-Me	C-H
1.08	H	C	C	S	C-H	C-H
1.09	H	C	C	O	C-H	C-H
1.10	H	C	C	N-H	C-H	C-H
1.11	H	C	C	N-Me	C-H	C-H
1.12	H	C	C	C-H	N	O
1.13	H	C	C	C-H	O	N
1.14	H	C	C	N	O	C-H
1.15	H	C	C	O	N	C-H
1.16	H	C	C	C-H	N	S
1.17	H	C	C	C-H	S	N
1.18	H	C	C	N	S	C-H
1.19	H	C	C	S	N	C-H
1.20	H	C	C	O	C-H	N
1.21	H	C	C	N	C-H	O
1.22	H	C	C	S	C-H	N
1.23	H	C	C	N	C-H	S
1.24	H	C	C	C-H	N	N-H
1.25	H	C	C	C-H	N	N-Me
1.26	H	C	C	N	C-H	N-H
1.27	H	C	C	N	C-H	N-Me
1.28	H	C	C	N-H	C-H	N
1.29	H	C	C	N-Me	C-H	N
1.30	H	C	C	N	N-H	C-H
1.31	H	C	C	N	N-Me	C-H
1.32	H	C	C	N-Me	N	N
1.33	H	C	C	N-H	N	N
1.34	H	C	C	N	N	N-Me
1.35	H	C	C	N	N	N-H
1.36	H	C	N	N	N	N
2.00	H	C	C	C-H	C-Me	S
2.01	H	C	C	C-H	C-Me	O

2.02	H	C	C	C-Me	C-H	S
2.03	H	C	C	C-Me	C-H	O
2.04	H	C	C	C-H	C-Me	N-H
2.05	H	C	C	C-H	C-Me	N-Me
2.06	H	C	C	S	C-H	C-Me
2.07	H	C	C	O	C-H	C-Me
2.08	H	C	C	N-H	C-H	C-Me
2.09	H	C	C	N-Me	C-H	C-Me
2.10	H	C	C	S	C-Me	C-H
2.11	H	C	C	O	C-Me	C-H
2.12	H	C	C	N-H	C-Me	C-H
2.13	H	C	C	N-Me	C-Me	C-H
2.14	H	C	C	C-Me	N	O
2.15	H	C	C	C-Me	O	N
2.16	H	C	C	N	O	C-Me
2.17	H	C	C	O	N	C-Me
2.18	H	C	C	C-Me	N	S
2.19	H	C	C	C-Me	S	N
2.20	H	C	C	N	S	C-Me
2.21	H	C	C	S	N	C-Me
2.22	H	C	C	O	C-Me	N
2.23	H	C	C	N	C-Me	O
2.24	H	C	C	S	C-Me	N
2.25	H	C	C	N	C-Me	S
2.26	H	C	C	C-Me	N	N-H
2.27	H	C	C	C-Me	N	N-Me
2.28	H	C	C	N	C-Me	N-H
2.29	H	C	C	N	C-Me	N-Me
2.30	H	C	C	N-H	C-Me	N
2.31	H	C	C	N-Me	C-Me	N
2.32	H	C	C	N	N-H	C-Me
2.33	H	C	C	N	N-Me	C-Me
3.00	Me	C	C	C-H	C-H	S
3.01	Me	C	C	C-H	C-H	O
3.02	Me	C	C	C-H	C-H	N-H
3.03	Me	C	C	C-H	C-H	N-Me
3.04	Me	C	C	C-H	S	C-H
3.05	Me	C	C	C-H	O	C-H
3.06	Me	C	C	C-H	N-H	C-H
3.07	Me	C	C	C-H	N-Me	C-H
3.08	Me	C	C	S	C-H	C-H
3.09	Me	C	C	O	C-H	C-H
3.10	Me	C	C	N-H	C-H	C-H
3.11	Me	C	C	N-Me	C-H	C-H
3.12	Me	C	C	C-H	N	O
3.13	Me	C	C	C-H	O	N
3.14	Me	C	C	N	O	C-H
3.15	Me	C	C	O	N	C-H
3.16	Me	C	C	C-H	N	S
3.17	Me	C	C	C-H	S	N
3.18	Me	C	C	N	S	C-H
3.19	Me	C	C	S	N	C-H
3.20	Me	C	C	O	C-H	N
3.21	Me	C	C	N	C-H	O
3.22	Me	C	C	S	C-H	N
3.23	Me	C	C	N	C-H	S
3.24	Me	C	C	C-H	N	N-H
3.25	Me	C	C	C-H	N	N-Me

3.26	Me	C	C	N	C-H	N-H
3.27	Me	C	C	N	C-H	N-Me
3.28	Me	C	C	N-H	C-H	N
3.29	Me	C	C	N-Me	C-H	N
3.30	Me	C	C	N	N-H	C-H
3.31	Me	C	C	N	N-Me	C-H
3.33	Me	C	C	N-Me	N	N
3.34	Me	C	C	N-H	N	N
3.35	Me	C	C	N	N	N-Me
3.36	Me	C	C	N	N	N-H
3.37	Me	C	N	N	N	N

Сполуки формули (I) відповідно до даного винаходу можуть бути використані самі по собі як регулятори росту рослин або стимулятори проростання насіння, але, як правило, їх складають у композиції для регуляції росту рослин або стимуляції проростання насіння із використанням допоміжних засобів для складання, таких як носії, розчинники та поверхнево-активні речовини (SFA). Таким чином, даний винахід додатково передбачає композицію для регуляції росту рослин, яка містить сполуку формули (I), що регулює ріст рослин, та прийнятний з точки зору сільського господарства допоміжний засіб для складання. Даний винахід додатково передбачає композицію для стимуляції проростання насіння, яка містить сполуку формули (I), що стимулює проростання насіння, та прийнятний з точки зору сільського господарства допоміжний засіб для складання. Композиція може бути представлена у формі концентратів, які розводять перед застосуванням, хоча також можна одержувати готові для застосування композиції. Кінцеве розведення зазвичай виконують за допомогою води, але замість води або на додаток до води можна використовувати, наприклад, рідкі добрива, поживні мікроелементи, біологічні організми, масло або розчинники.

Композиції, як правило, містять від 0,1 до 99 ваг. %, зокрема від 0,1 до 95 ваг. % сполук формули (I) та від 1 до 99,9 ваг. % допоміжного засобу для складання, який переважно включає від 0 до 25 ваг. % поверхнево-активної речовини.

Композиції можна вибрати з ряду типів складів, багато з яких відомі з Manual on Development and Use of FAO Specifications for Plant Protection Products, 5th Edition, 1999. Вони включають порошки, що розпорошуються (DP), розчинні порошки (SP), розчинні у воді гранули (SG), гранули, що диспергуються у воді (WG) порошки, що змочуються (WP), гранули (GR) (з повільним або швидким вивільненням), розчинні концентрати (SL), рідини, що змішуються з маслом (OL), рідини, застосовувані в ультранизькому об'ємі (UL), концентрати, що емульгуються (EC), концентрати, що диспергуються (DC), емульсії (як "масло у воді" (EW), так і "вода в маслі" (EO)), мікроемульсії (ME), суспензійні концентрати (SC), аерозолі, капсульні суспензії (CS) та сполуки для обробки насіння. Вибраний тип складу у будь-якому випадку буде залежати від конкретного призначення, що передбачається, та фізичних, хімічних і біологічних властивостей сполуки формули (I).

Порошки, що розпорошуються (DP), можна одержувати шляхом змішування сполуки формули (I) з одним або декількома твердими розріджувачами (наприклад, природними глинами, каоліном, пірофілітом, бентонітом, оксидом алюмінію, монтморилонітом, кізельгуром, крейдою, діатомовими землями, фосфатами кальцію, карбонатами кальцію та магнію, сіркою, вапном, борошном, тальком та іншими органічними і неорганічними твердими носіями) та механічного здрібнювання суміші до тонкодисперсного порошку.

Розчинні порошки (SP) можна одержувати шляхом змішування сполуки формули (I) з однією або декількома розчинними у воді неорганічними солями (такими як бікарбонат натрію, карбонат натрію або сульфат магнію) або з однією або декількома розчинними у воді органічними твердими речовинами (такими як полісахарид) та необов'язково з одним або декількома змочувальними засобами, одним або декількома диспергувальними засобами або сумішшю зазначених засобів для поліпшення здатності до диспергування/розчинності у воді. Суміш потім подрібнюють у тонкодисперсний порошок. Подібні композиції також можна гранулювати з утворенням розчинних у воді гранул (SG).

Порошки, що змочуються (WP), можна одержувати шляхом змішування сполуки формули (I) з одним або декількома твердими розріджувачами або носіями, одним або декількома змочувальними засобами та переважно одним або декількома диспергувальними засобами, а також необов'язково з одним або декількома суспендувальними засобами для полегшення дисперсії в рідинах. Суміш потім подрібнюють у тонкодисперсний порошок. Подібні композиції також можна гранулювати з утворенням гранул, що диспергуються у воді (WG).

Гранули (GR) можуть бути утворені або гранулюванням суміші сполуки формули (I) та одного або декількох порошкових твердих розріджувачів або носіїв, або з попередньо утворених порожніх гранул за допомогою абсорбції сполуки формули (I) (або її розчину в придатному засобі) пористим матеріалом гранули (таким як пемза, атапульгітова глина, фулерова земля, кізельгур, діатомові землі або здрібнені кукурудзяні качани) або за допомогою адсорбції сполуки формули (I) (або її розчину в придатному засобі) на матеріалі твердого ядра (такому як пісок, силікати, мінеральні карбонати, сульфати або фосфати) та сушіння, якщо необхідно. Засоби, які зазвичай використовують для абсорбції або адсорбції, включають розчинники (такі як аліфатичні та ароматичні нафтові розчинники, спирти, етери, кетони та естери) та засоби, що сприяють прилипанню (такі як полівінілацетати, полівінілові спирти, декстрини, цукри та рослинні олії). Гранули також можуть містити одну або декілька інших добавок (наприклад, емульгувальний засіб, змочувальний засіб або диспергувальний засіб).

Концентрати, що диспергуються (DC), можна одержувати розчиненням сполуки формули (I) у воді або органічному розчиннику, такому як кетон, спирт або гліколевий ефір. Ці розчини можуть містити поверхнево-активний засіб (наприклад, для поліпшення розведення водою або запобігання кристалізації в резервуарі обприскувача).

Концентрати, що емульгуються (EC), або емульсії "масло-в-воді" (EW) можна одержувати розчиненням сполуки формули (I) в органічному розчиннику (що необов'язково містить один або декілька змочувальних засобів, один або декілька емульгувальних засобів або суміш зазначених засобів). Придатні органічні розчинники для застосування в EC включають ароматичні вуглеводні (такі як алкілбензоли або алкілнафталіни, прикладами яких є SOLVESSO 100, SOLVESSO 150 та SOLVESSO 200; SOLVESSO являє собою зареєстровану торговельну марку), кетони (такі як циклогексанон або метилциклогексанон) та спирти (такі як бензиловий спирт, фурфуріловий спирт або бутанол), N-алкілпіролідони (такі як N-метилпіролідон або N-октилпіролідон), диметиламід жирних кислот (такі як диметиламід C<sub>8</sub>-C<sub>10</sub>жирної кислоти) та хлоровані вуглеводні. Продукт EC може мимовільно емульгуватися при додаванні у воду з утворенням емульсії з достатньою стабільністю, що дозволяє використовувати розпилення за допомогою відповідного обладнання.

Одержання EW включає одержання сполуки формули (I) або у вигляді рідини (якщо вона не є рідиною при кімнатній температурі, її можна розплавити при помірній температурі, зазвичай нижче 70 °C), або в розчині (шляхом розчинення його у відповідному розчиннику), а потім емульгування одержаної рідини або розчину у воді, що містить одну або декілька SFA, при високому зсувному зусиллі з одержанням емульсії. Придатні розчинники для застосування в EW включають рослинні олії, хлоровані вуглеводні (такі як хлорбензоли), ароматичні розчинники (такі як алкілбензоли або алкілнафталіни) та інші відповідні органічні розчинники, які характеризуються низькою розчинністю у воді.

Мікроемульсії (ME) можна одержувати змішуванням води із сумішшю одного або декількох розчинників з однією або декількома SFA з мимовільним утворенням термодинамічно стабільного ізотропного рідкого складу. Сполука формули (I) присутня спочатку або у воді, або у суміші розчинник/SFA. Розчинники, що підходять для застосування в ME, включають описані вище для застосування в EC або в EW. ME може бути системою або "масло-в-воді", або "вода-в-маслі" (те, яка система присутня, можна визначити вимірюванням питомої електричної провідності) та може бути придатною для змішування розчинних у воді та розчинних у маслі пестицидів у цьому ж складі. ME є придатною для розведення у воді, при цьому або залишається у вигляді мікроемульсії, або утворює звичайну емульсію "масло-у-воді".

Суспензійні концентрати (SC) можуть містити водні або неводні суспензії дрібно здрібнених нерозчинних твердих частинок сполуки формули (I). SC можна одержувати розмелюванням на кульовому або бісерному млині твердої сполуки формули (I) у придатному середовищі необов'язково з одним або декількома диспергувальними засобами з одержанням суспензії тонкодисперсних частинок сполуки. У композицію можна включити один або декілька змочувальних засобів, а для зниження швидкості, з якою осідають частинки, можна включити суспендувальний засіб. Альтернативно, сполуку формули (I) можна подрібнювати сухою та додати у воду, що містить засоби, описані вище в даному документі, з одержанням бажаного кінцевого продукту.

Аерозольні склади містять сполуку формули (I) та придатний газ-витискувач (наприклад, н-бутан). Сполуку формули (I) також можна розчинити або диспергувати у придатному середовищі (наприклад, у воді або в рідині, що змішується з водою, такої як н-пропанол) з одержанням композицій для застосування в насосах, що не перебувають під тиском, для обприскування з ручним керуванням.

Капсульні суспензії (CS) можна одержати подібно одержанню складів EW, але з додатковим етапом полімеризації з одержанням водної дисперсії крапельок масла, у якій кожна крапелька масла інкапсулюється полімерною оболонкою та містить сполуку формули (I) та необов'язково її носій або розріджувач. Полімерну оболонку можна одержати або за допомогою реакції міжфазної поліконденсації, або за допомогою методики коацервації. Композиції можуть забезпечувати контрольоване вивільнення сполуки формули (I), та їх можна застосовувати для обробки насіння. Для забезпечення повільного контрольованого вивільнення сполуки формули (I) також можна скласти у вигляді полімерної матриці, що біорозкладається.

Композиція може включати одну або декілька добавок для поліпшення біологічної дії композиції, наприклад, шляхом поліпшення змочування, утримання на поверхнях або розподілу по поверхнях; стійкості до змивання дощем з оброблених поверхонь або поглинання або рухливості сполуки формули (I). Такі добавки включають поверхнево-активні речовини (SFA), добавки для обприскування на основі масел, наприклад, деяких мінеральних масел або природних рослинних олій (таких як соєва та рапсова олія), та їх суміші з іншими біопідсилювальними допоміжними засобами (інгредієнтами, які можуть сприяти дії або модифікувати дію сполуки формули (I)).

Змочувальні засоби, диспергувальні засоби та емульгувальні засоби можуть являти собою SFA катіонного, аніонного, амфотерного або неіонного типу.

Придатні SFA катіонного типу включають сполуки четвертинного амонію (наприклад, цетилтриметиламонію бромід), імідазоліни та солі амінів.

Придатні аніонні SFA включають солі лужних металів жирних кислот, солі аліфатичних моноєфірів сірчаної кислоти (наприклад, лаурилсульфат натрію), солі сульфонованих ароматичних сполук (наприклад, додецилбензолсульфонат натрію, додецилбензолсульфонат кальцію, бутилнафталін сульфонат та суміші діізопропіл- та триізопропілнафталінсульфонатів натрію), сульфати етерів, сульфати етерів спиртів (наприклад, лаурет-3-сульфат натрію), карбоксилати етерів (наприклад, лаурет-3-карбоксилат натрію), естери фосфорної кислоти (продукти реакції між одним або декількома жирними спиртами та фосфорною кислотою (переважно моноестери) або пентаоксидом фосфору (переважно діестери), наприклад, при реакції між лауриловим спиртом та тетрафосфорною кислотою; додатково ці продукти можуть бути етоксильовані), сульфосукцинамат, парафін- або олефісульфонати, таурати та лігносульфонати.

Придатні SFA амфотерного типу включають бетаїни, пропіонати та гліцинати.

Придатні SFA неіонного типу включають продукти конденсації алкіленоксидів, таких як етиленоксид, пропіленоксид, бутиленоксид або їх суміші, з жирними спиртами (такими як олеїловий спирт або цетиловий спирт) або з алкілфенолами (такими як октилфенол, нонілфенол або октилкрезол); неповні естери, одержані із довголанцюгових жирних кислот або ангідридів гекситолу; продукти конденсації зазначених неповних складних ефірів з етиленоксидом; блок-полімери (що включають етиленоксид та пропіленоксид); алканоламіди; естери (наприклад, жирної кислоти поліетиленгліколеві естери); аміноксиди (наприклад, лаурилдиметиламіну оксид) та лецитини.

Придатні суспендувальні засоби включають гідрофільні колоїди (такі як полісахариди, полівінілпіролідон або карбоксиметилцелюлоза натрію) та глини, що набухають (такі як бентоніт або атапульгіт).

Даний винахід, крім того, відноситься до способу регуляції росту рослин у місці розташування, при цьому спосіб включає застосування щодо місця розташування композиції відповідно до даного винаходу у кількості, що регулює ріст рослин.

Даний винахід також передбачає спосіб стимуляції проростання насіння, що включає застосування щодо насіння або щодо місця розташування, що містить насіння, композиції відповідно до даного винаходу у кількості, що стимулює проростання насіння.

Застосування зазвичай здійснюють шляхом розпилення композиції, як правило, за допомогою встановленого на тракторі розпилювача для більших територій, але також можна застосовувати інші способи, такі як опудрювання (для порошоків), краплинний полив або зрошення. Альтернативно, композицію можна вносити у борозну або ж безпосередньо застосовувати щодо насіння до посіву або під час нього.

Сполуку формули (I) або композицію за даним винаходом можна застосовувати щодо рослини, частини рослини, органу рослини, матеріалу для розмноження рослини або ділянки навколо них.

В одному варіанті здійснення даний винахід відноситься до способу обробки матеріалу для розмноження рослин, що включає застосування композиції за даним винаходом в кількості, ефективній для стимуляції проростання та/або регуляції росту рослин, щодо матеріалу для

розмноження рослин. Даний винахід також відноситься до матеріалу для розмноження рослин, обробленого сполукою формули (I) або композицією за даним винаходом. Переважно матеріалом для розмноження рослин є насіння.

Вираз "матеріал для розмноження рослин" означає всі генеративні частини рослини, такі як насіння, які можна застосовувати для розмноження останнього, і вегетативні матеріали рослини, такі як живці та бульби. Зокрема, слід згадати насіння, коріння, плоди, бульби, цибулини та кореневища.

Способи застосування активних інгредієнтів щодо матеріалу для розмноження рослин, особливо насіння, відомі в даній галузі техніки і включають способи застосування за допомогою протруювання, покриття, гранулювання й просочування матеріалу для розмноження. Обробку насіння можна застосовувати в будь-який час між збором насіння та висіванням насіння або під час висівання. Насіння також можна замочувати до або після обробки. Сполуку формули (I) необов'язково можна застосовувати в комбінації з покриттям або технологією для контролюваного вивільнення, внаслідок чого сполука вивільняється поступово.

Композицію за даним винаходом можна застосовувати до появи сходів або після появи сходів. Відповідно, якщо композиція використовується для регуляції росту культурних рослин, вона може бути застосована до або після появи сходів, але переважно після появи сходів сільськогосподарської культури. Якщо композиція використовується для стимуляції проростання насіння, вона може бути застосована до появи сходів.

Норми внесення сполук формули I можуть варіювати в широких межах і залежати від характеру ґрунту, способу застосування (до або після проростання; протравлення насіння; застосування щодо борозни для насіння; застосування без обробки ґрунту тощо), культурної рослини, кліматичних умов, що переважають, та інших факторів, обумовлених способом застосування, часом застосування та цільовою сільськогосподарською культурою. Для нанесення на листя або зрошення сполуки формули I згідно з даним винаходом, як правило, застосовують при нормі від 1 до 2000 г/га, зокрема від 5 до 1000 г/га. Для обробки насіння норма внесення, як правило, становить 0,0005-150 г на 100 кг насіння.

Рослини, щодо яких можна застосовувати композицію згідно з даним винаходом, включають сільськогосподарські культури, такі як зернові (наприклад, пшениця, ячмінь, жито, овес); буряк (наприклад, цукровий буряк або кормовий буряк); фруктові (наприклад, зерняткові, кісточкові або ягоди, такі як яблуна, груші, сливи, персики, мигдаль, вишні, полуниця, малина або ожина); бобові рослини (наприклад, боби, сочевиця, горох або соя); олійні рослини (наприклад, рапс, гірчиця, мак, оливи, соняшник, кокосова пальма, рослини, що дають касторову олію, какао-боби або арахіс); огіркові (наприклад, кабачки, огірки або дині); волокнисті рослини (наприклад, бавовник, льон, коноплі або джут); цитрусові (наприклад, апельсини, лимони, грейпфрути або мандарини); овочі (наприклад, шпинат, латук, спаржа, капуста, морква, цибуля, томат, картопля, гарбуз або перець); Lauraceae (наприклад, авокадо, коричне дерево або камфорне дерево); маїс; рис; тютюн; горіхи; кава; цукровий очерет; чай; виноград; хміль; дуріан; банан; рослини, що дають натуральний каучук; газонні або декоративні (наприклад, квіти, чагарники, широколисті дерева або вічнозелені, такі як хвойні). Цей перелік не передбачає ніякого обмеження.

Даний винахід також може бути використаний для регуляції росту або для стимуляції проростання насіння рослин, що не є сільськогосподарськими культурами, наприклад, для полегшення контролю бур'янистих рослин шляхом синхронізації проростання.

Слід розуміти, що сільськогосподарські культури також включають ті культури, які були змінені за допомогою традиційних способів селекції або за допомогою генної інженерії. Наприклад, даний винахід можна застосовувати щодо сільськогосподарських культур, яким була надана толерантність до гербіцидів або класів гербіцидів (наприклад, інгібіторів ALS, GS, EPSPS, PPO, ACCази та HPPD). Прикладом сільськогосподарської культури, якій була надана толерантність до імідазолінонів, наприклад, до імазамоксу, за допомогою загальноприйнятих способів селекції, є капуста польова Clearfield® (канола). Приклади сільськогосподарських культур, яким була надана толерантність до гербіцидів за допомогою способів генної інженерії, включають, наприклад, стійкі до гліфосату та глюфосинату сорти маїсу, комерційно доступні під торговими назвами RoundupReady® та LibertyLink®. Способи надання культурним рослинам толерантності до інгібіторів HPPD відомі, наприклад, з WO0246387; наприклад, культурна рослина є трансгенною за полінуклеотидом, що містить послідовність ДНК, яка кодує фермент HPPD, стійкий до інгібітора HPPD, одержаний з бактерії, зокрема з *Pseudomonas fluorescens* або *Shewanella colwelliana*, або з рослини, зокрема, одержаний з однодольної рослини або, ще більш конкретно, з ячменю, маїсу, пшениці, рису, видів *Brachiaria*, *Chenchrus*, *Lolium*, *Festuca*, *Setaria*, *Eleusine*, *Sorghum* або *Avena*.

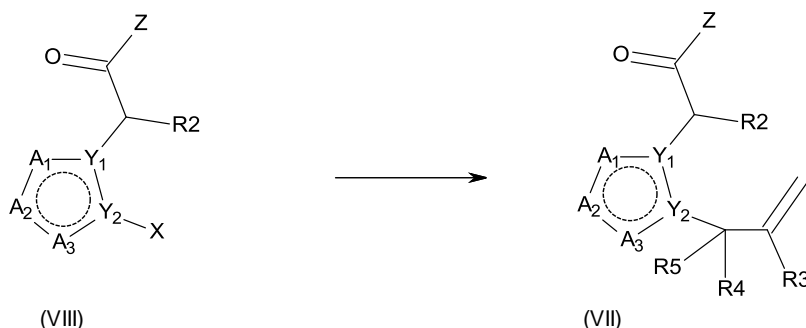
Під сільськогосподарськими культурами також слід розуміти такі, яким була надана стійкість до шкідливих комах за допомогою способів генної інженерії, наприклад, маїс Bt (стійкий до метелика кукурудзяного), бавовник Bt (стійкий до довгоносика бавовняного), а також різновиди картоплі Bt (стійкі до колорадського жука). Прикладами маїсу Bt є гібриди маїсу Bt 176 NK® (Syngenta Seeds). Токсин Bt являє собою білок, який у природі продукується ґрунтовою бактерією *Bacillus thuringiensis*. Приклади токсинів або трансгенних рослин, здатних синтезувати такі токсини, описані в EP-A-451878, EP-A-374753, WO 93/07278, WO 95/34656, WO 03/052073 та EP-A-427529. Прикладами трансгенних рослин, що містять один або декілька генів, що кодують стійкість до інсектицидів та експресують один або декілька токсинів, є Knockout® (маїс), Yield Gard® (маїс), NuCOTIN33B® (бавовник), Bollgard® (бавовник), Newleaf® (картопля), Naturegard® та Protexta®. Як рослинні культури, так і їхній насіннєвий матеріал можуть бути стійкими до гербіцидів і водночас стійкими до поїдання комахами (трансгенні об'єкти з "пакетованими" генами). Наприклад, насіння може мати здатність експресувати інсектицидний білок Cry3 та у той же час бути толерантним до гліфосату.

Слід розуміти, що сільськогосподарські культури включають ті, які отримані традиційними способами селекції або генної інженерії і мають так звані привнесені ознаки (наприклад, поліпшену стабільність при зберіганні, більш високу живильну цінність та поліпшений смак).

Сполуки та композиції відповідно до даного винаходу можуть застосовуватися в комбінації з іншими активними інгредієнтами або продуктами для використання в сільському господарстві, у тому числі з інсектицидами, фунгіцидами, гербіцидами, регуляторами росту рослин, сполуками, що підвищують врожайність, живильними речовинами та біологічними засобами. Приклади придатних складових змішування можна знайти в Pesticide Manual, 15<sup>th</sup> edition (опублікованому British Crop Protection Council). Такі суміші можна застосовувати щодо рослини, матеріалу для розмноження рослини або місця зростання рослини або одночасно (наприклад, як попередню складену суміш або бакову суміш), або послідовно з прийнятними часовими рамками. Спільне застосування пестицидів відповідно до даного винаходу має додаткову перевагу, яка полягає в мінімізації затрачуваного фермером часу на застосування продуктів щодо сільськогосподарських культур.

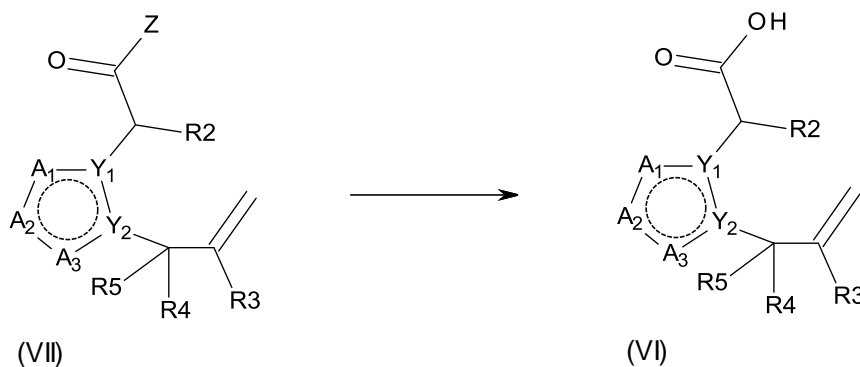
Сполуки за даним винаходом можуть бути одержані за допомогою наступних способів.

Схема 1



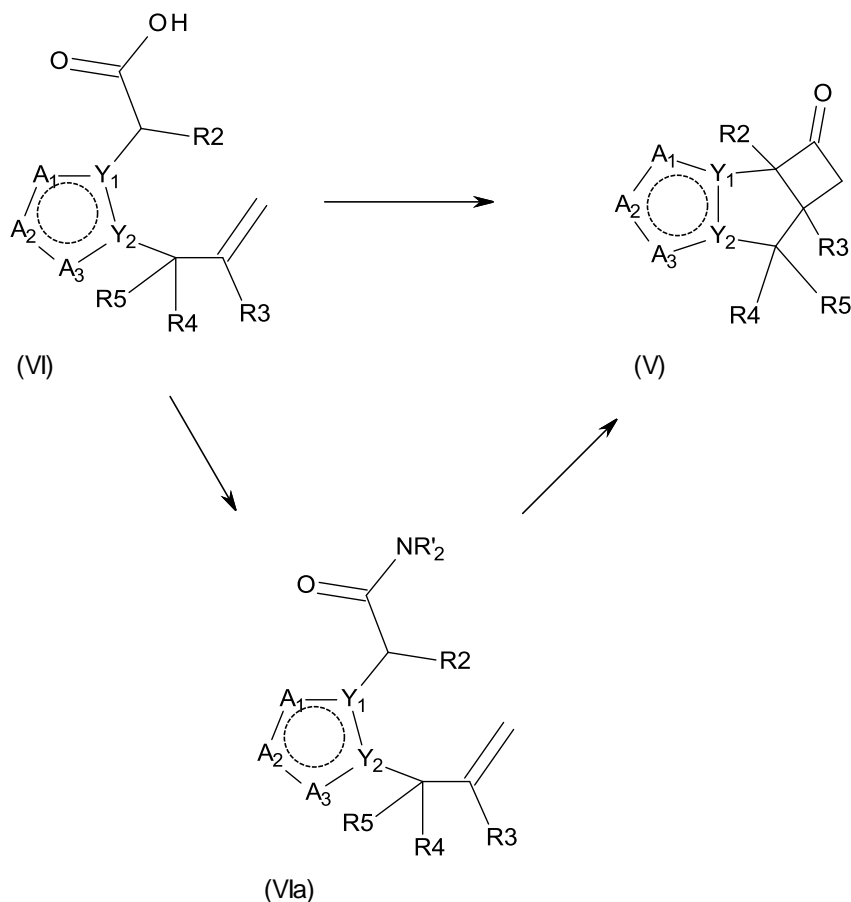
Сполуки формули (VII) можуть бути одержані шляхом обробки сполук формули (VIII), де Z являє собою C1-C6-алкокси (як для прикладу в *Macromolecules* 2004, 37, 4351), та X являє собою Br або I, з алільним похідним формули MC(R4R5)C(R3)CH<sub>2</sub>, де M являє собою похідні бору або олова, у присутності придатної системи каталізатор/ліганд, часто комплексу паладію(0).

Схема 2



Сполука формули (VI) може бути одержана зі сполуки формули (VII), де Z являє собою C1-Сбалкоксі, шляхом обробки основою, такою як гідроксид натрію, у присутності води.

Схема 3



5        Сполуки формули (V) можуть бути одержані шляхом обробки сполук формули (VI) реагентом, застосовуваним при синтезі хлорангідриду, таким як (1-хлор-2-метил-пропеніл)-диметиламін, з наступною реакцією з основою, такою як триетиламін. Утворення ацилхлориду добре відоме фахівцям в даній галузі техніки та може бути виконане з багатьма іншими реагентами, такими як тіонілхлорид, оксалоїлхлорид або трихлорид фосфору. Друга реакція

10        відома фахівцям в даній галузі техніки як обробка шляхом внутрішньомолекулярного циклоприєднання кетену.

Альтернативно, сполуки формули (V) можуть бути одержані шляхом обробки сполук формули (VIa), де R" являє собою C1-Сбалкіл, дегідратуючим засобом, таким як трифторметансульфоновий ангідрид, у присутності основи, такої як колідин, з одержанням проміжної сполуки імінію шляхом внутрішньомолекулярного циклоприєднання з наступним гідролізом за допомогою води. Застосування сполук формули (VIa), де R" є хіральним, дає хіральні сполуки формули (V), (IV), (III), (II), (I).

15

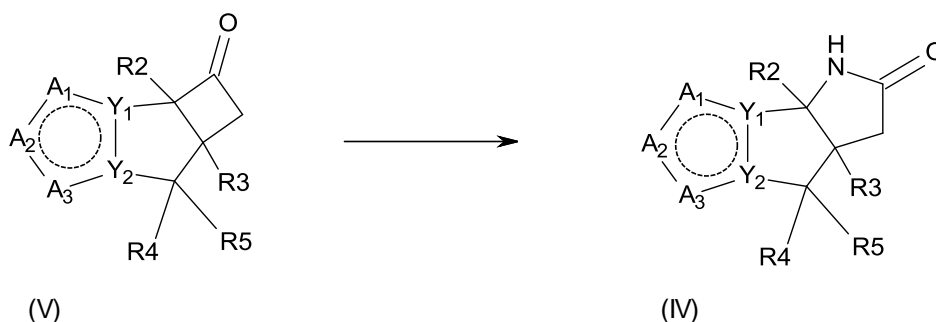
Сполуки формули (VIa) можуть бути одержані зі сполук формули (VI) за допомогою аміну формули  $\text{HNR}'_2$ , де R" не є хіральним, таким як піролідин, або R' є хіральним, таким як (R, R)-2,5-диметилпіролідин. Такі реакції можуть бути здійснені в присутності зв'язувального реагенту, такого як DCC (N, N'-дициклогексилкарбодіїмід), EDC (1-етил-3-[3-диметиламіно-пропіл]карбодіїмід) або BOP-Cl (біс(2-оксо-3-оксазолідиніл)фосфонові кислоти хлорид), у присутності основи, такої як піридин, триетиламін, 4-(диметиламіно)піридин або діізопропілетиламін, та необов'язково в присутності нуклеофільного каталізатора, такого як гідроксибензотриазол або 1-гідрокси-7-азабензотриазол. Альтернативно, ця реакція може бути виконана у два етапи шляхом обробки сполуки формули (VI) реагентом, використовуваним для синтезу хлорангідриду, з наступним додаванням аміну формули  $\text{HNR}'_2$  у присутності основи, такої як триетиламін.

20

25

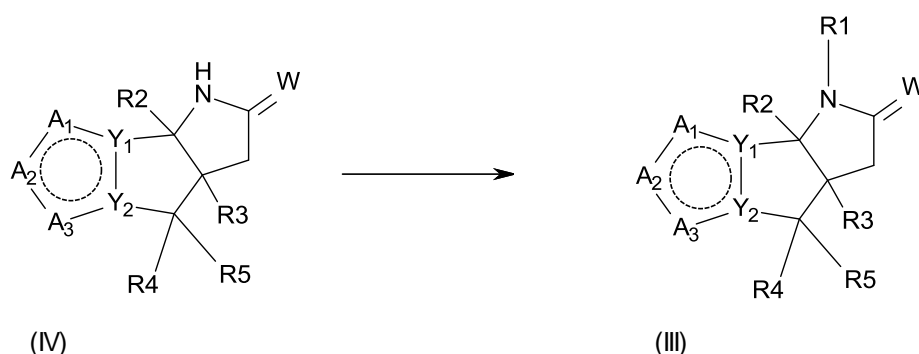
Схема 4





Сполука формули (IV) може бути одержана зі сполуки формули (V) шляхом утворення оксиму та перегрупування оксиму за допомогою реакції, наприклад, з оцтовим ангідридом або сульфонілхлоридом. Альтернативно, сполука формули (III) може бути одержана безпосередньо шляхом обробки О-мезитилсульфонілгідроксиламіном. Ці реакції відомі фахівцеві в даній галузі техніки як перегрупування Бекмана.

Схема 5

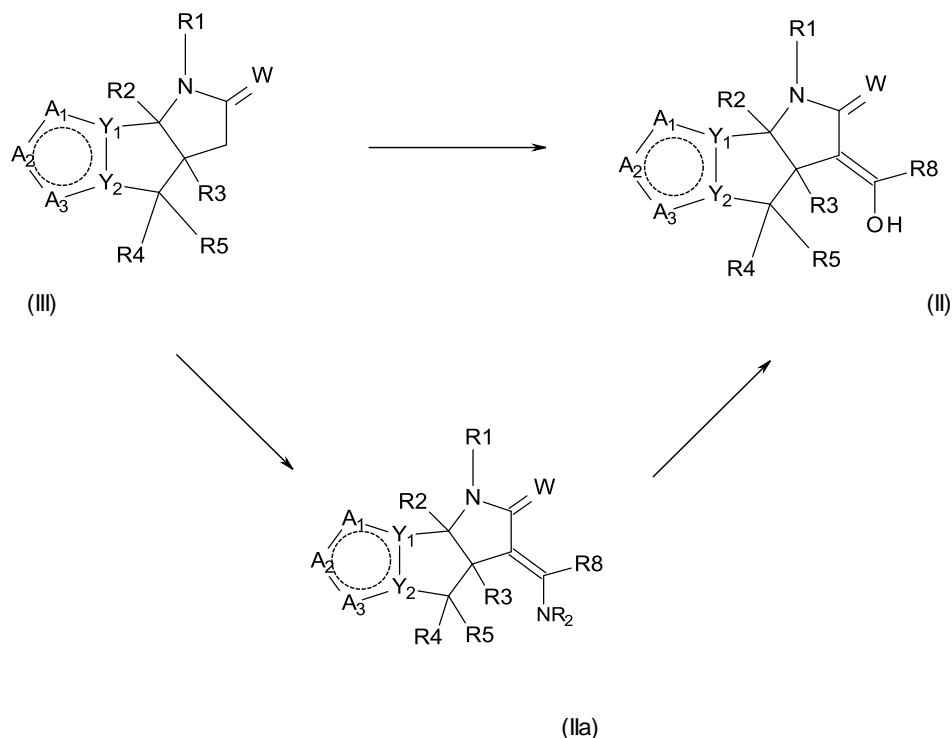


Сполуки формули (III), де R1 не являє собою водень, можуть бути одержані зі сполуки формули (IV) (де R1 являє собою H) шляхом алкілювання за допомогою реакції амідів з алкілюючим засобом, таким як алкілгалід, у присутності основи, такої як гідрид натрію.

Сполуки формули (III), де R1 являє собою карбонільне похідне, можуть бути одержані шляхом ацилювання сполуки формули (IV) за допомогою сполуки R'C(O)R, де R являє собою OH, у присутності з'єднувального реагенту, такого як DCC (N, N'-дициклогексилкарбодіїмід), EDC (1-етил-3-[3-диметиламіно-пропіл]карбодіїмід гідрохлорид) або BOP-Cl (біс(2-оксо-3-оксазолідиніл)фосфонові кислоти хлорид), у присутності основи, такої як піридин, триетиламін, 4-(диметиламіно)піридин або діізопропілетиламін, та необов'язково в присутності нуклеофільного каталізатора, такого як гідроксибензотриазол. Необов'язково, якщо R являє собою Cl або ОС(О)C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>алкокси, реакція ацилювання може бути виконана за основних умов (наприклад, у присутності піридину, триетиламіну, 4-(диметиламіно)піридину або діізопропілетиламіну), необов'язково в присутності нуклеофільного каталізатора. Альтернативно, реакція може бути проведена у двофазній системі, що включає органічний розчинник, переважно етилацетат, і водний розчинник, переважно розчин бікарбонату натрію. Необов'язково, якщо R являє собою C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>алкокси, амід може бути одержаний шляхом нагрівання похідного (IV) та амідів (V) разом. R" може являти собою алкіл або алкоксигрупу.

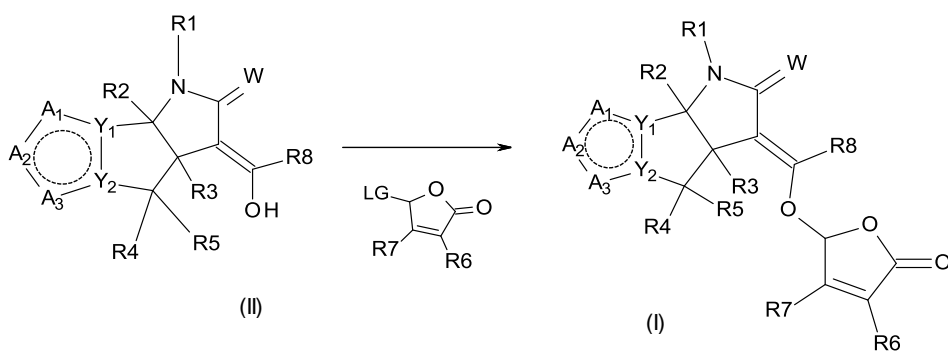
Сполуки формули (III), де R1 являє собою ароматичну або гетероароматичну групу, можуть бути одержані зі сполуки формули (IV) за допомогою реакції амідів з ароматичною або гетероароматичною сполукою формули ArX, причому X являє собою галоген, у присутності основи, такої як фосфат калію, та придатного каталізатора, часто солі міді (I), та ліганду, такого як диметилетан-1,2-діамін.

Схема 6



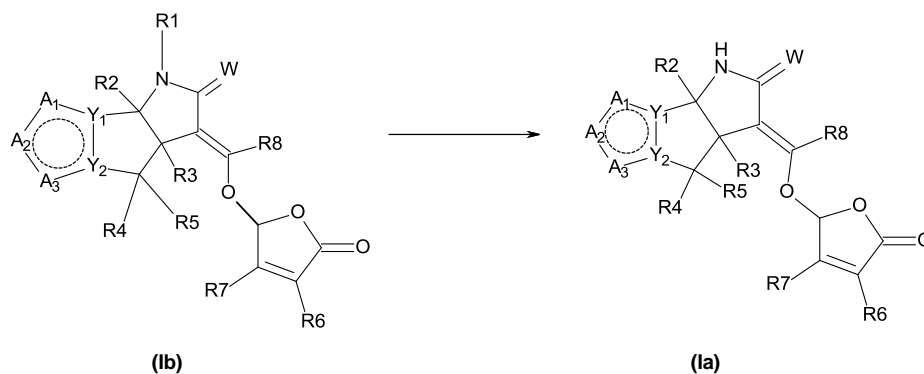
Сполуки формули (II) можуть бути одержані зі сполуки формули (III) за допомогою реакції з похідним естеру мурашиної кислоти, таким як метилформіат, у присутності основи, такої як діізопропіламід літію або трет-бутилат калію. Альтернативно, сполуки формули (II) можуть бути одержані зі сполуки формули (IIa) шляхом гідролізу за допомогою кислоти, такої як хлороводень. Сполуки формули (IIa) можуть бути одержані зі сполук формули (III) за допомогою реакції з реагентом Бредерека (т-бутоксібис(диметиламіно)метан), де R являє собою метил або аналог.

Схема 7



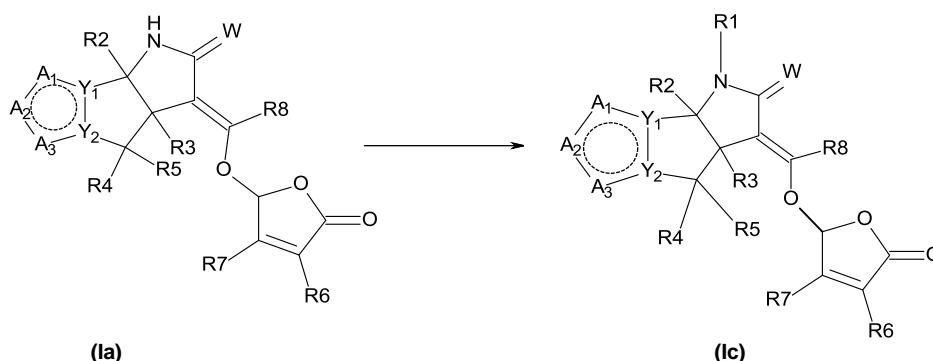
Сполуки формули (I) можуть бути одержані зі сполук формули (II) шляхом нуклеофільного заміщення похідного 5Н-фуранону, який містить групу, що відходить (LG), при цьому LG являє собою групу, що відходить, таку як хлор або бром, у присутності основи, такої як, наприклад, трет-бутилат калію, з краун-ефіром або без нього.

Схема 8



Альтернативно, сполуки формули (Ia) можуть бути одержані зі сполуки формули (Ib), де R<sub>1</sub> являє собою захисну групу, таку як третбутоксикарбоніл, шляхом зняття захисту з використанням кислоти, такої як трифтороцтова кислота або хлороводень або кислоти Льюїса, такої як хлорид магнію.

### Схема 9



Сполуки формули (Ic), де R1 являє собою алکیلну групу, можуть бути одержані зі сполук формули (Ia) за допомогою реакції з алкілюючим засобом формули R1X, де X являє собою групу, що відходить, таку як галоген, тозил або мезил, у присутності основи, такої як гідрид натрію або оксид срібла.

Сполуки формули (1c), де R1 являє собою алкілкарбонільну або алкоксикарбонільну групу, можуть бути одержані зі сполук формули (1a) за допомогою реакції з відповідним хлорангідридом формули R1Cl або відповідним ангідридом формули R1<sub>2</sub>O у присутності основи, такої як основа Хуніга, триетиламіну або карбонату натрію, необов'язково в присутності нуклеофільного каталізатора, такого як диметиламінопіридин.

## Приклади

Для аналізу сполук застосовували наступні способи HPLC-MS.

Спосіб А. Спектри реєстрували на ZQ Mass Spectrometer від Waters (одиначному квадрупольному мас-спектрометрі), оснащеному джерелом електророзпилення (полярність: позитивні або негативні іони, капілярність: 3,00 кВ, конус: 30,00 В, екстрактор: 2,00 В, температура джерела: 100 °С, температура десольватації: 250 °С, газовий потік конуса: 50 л/година, газовий потік десольватації: 400 л/година, діапазон маси: 100-900 Да) та Acquity UPLC від Waters (дегазатор розчинника, насос для двокомпонентних сумішей, камера колонки, що нагрівається, та детектор на діодній матриці. Колонка: Waters UPLC HSS T3, 1,8 мкм, 30 × 2,1 мм, температура: 60 °С, швидкість потоку 0,85 мл/хвилина; діапазон довжин хвиль DAD (нм): 210-500) градієнт розчинника: А=Н<sub>2</sub>О+5 % MeOH+0,05 % НСООН, В = ацетонітрил + 0,05 % НСООН) градієнт: 0 хвилин 10 % В; 0-1,2 хвилини 100 % В; 1,2-1,50 хвилини 100 % В.

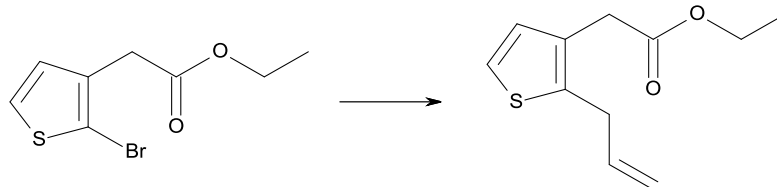
Спосіб В. Спектри реєстрували на мас-спектрометрі SQD Mass Spectrometer від Waters (одиначний квадрупольний мас-спектрометр), оснащеному джерелом електророзпилення (полярність: позитивні та негативні іони, капілярність: 3,00 кВ, конус: 30,00 В, екстрактор: 2,00 В, температура джерела: 150 °С, температура десольватації: 250 °С, газовий потік конуса: 0 л/година, газовий потік десольватації: 650 л/година, діапазон маси: 100-900 Да) та Acquity UPLC від Waters (насос для двокомпонентних сумішей, камера колонки, що нагрівається, та детектор на діодній матриці, дегазатор розчинника, насос для двокомпонентних сумішей, камера колонки, що нагрівається, та детектор на діодній матриці, колонка: Waters UPLC HSS T3, 1,8 мкм, 30 × 2,1 мм, температура: 60 °С, швидкість потоку 0.85 мл/хвилина; діапазон довжин хвиль

DAD (нм): 210-500); градієнт розчинника: A=H<sub>2</sub>O+5 % MeOH+0,05 % HCOOH, B = ацетонітрил + 0,05 % HCOOH; градієнт: 0 хвилин 10 % B; 0-1,2 хвилини 100 % B; 1,2-1,50 хвилини 100 % B.

У всьому розділі використовуються наступні скорочення: s = синглет; bs = широкий синглет; d = дуплет; dd = подвійний дуплет; dt = подвійний триплет; t = триплет, tt = потрійний триплет, q = кuartет, m = мультиплет; Me = метил; Et = етил; Pr = пропіл; Bu = бутил; т.пл. = точка плавлення; DMF=N, N-диметилформамід, THF = тетрагідрофуран.

5

Етап 1: етил-2-(2-аліл-3-тієніл)ацетат

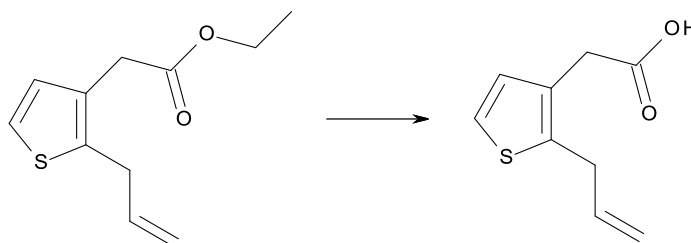


10

До розчину етил-2-(2-бром-3-тієніл)ацетату (4,67 г, 18,7 ммоль) у безводному DMF (75,0 мл), при цьому розчин дегазували протягом 30 хвилин, додавали хлорид літію (28,1 ммоль, 1,19 г), а потім алілтри-н-бутилолово (28,1 ммоль, 9,60 г, 8,90 мл) та паладію трифенілфосфонтетракіс (1,31 ммоль, 1,55 г) та розчин нагрівали до 100 °C протягом 4 годин. Воду (600 мл) та водний шар екстрагували етилацетатом (3\*300 мл). Об'єднані органічні шари промивали сольовим розчином (2\*250 мл), сушили та концентрували. Продукт очищали за допомогою флеш-хроматографії (0 % - 5 % етилацетат у циклогексані) з одержанням етил-2-(2-аліл-3-тієніл)ацетату (3,10 г, 79 %). <sup>1</sup>H ЯМР (400 МГц, CDCl<sub>3</sub>) 7,11 (1H, d), 6,94 (1H, d), 5,94 (1H, m), 5,12 (1H, m), 5,08 (1H, t), 4,14 (2H, q), 3,53 (4H, m), 1,26 (3H, t).

15

Етап 2: 2-(2-аліл-3-тієніл)оцтова кислота

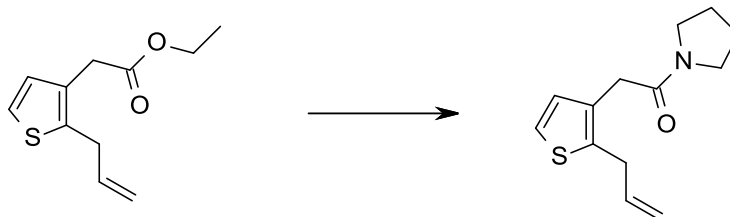


20

До розчину етил-2-(2-аліл-3-тієніл)ацетату (етап 1, 0,833 г, 3,96 ммоль) у діоксані (4,5 мл) додавали гідроксид натрію (4 M, 4,95 ммоль, 1,24 мл) та розчин перемішували при 50 °C протягом 18 годин. Розчин концентрували та додавали воду (50 мл). Розчин екстрагували діетиловим ефіром (50 мл) та pH водного шару регулювали до 1. Водний шар екстрагували етилацетатом (4\*50 мл), промивали сольовим розчином, сушили та концентрували з одержанням 2-(2-аліл-3-тієніл)оцтової кислоти (670 мг, 93 %). <sup>1</sup>H ЯМР (400 МГц, CDCl<sub>3</sub>) 7,13 (1H, d), 6,94 (1H, d), 5,94 (1H, m), 5,12 (1H, m), 5,08 (1H, t), 3,61 (2H, s), 3,58 (2H, m).

25

Етап 3: 2-(2-аліл-3-тієніл)-1-піролідин-1-іл-етанон



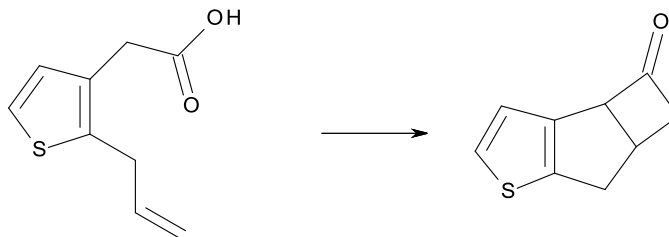
30

До розчину 2-(2-аліл-3-тієніл)оцтової кислоти (етап 2, 0,580 г, 3,18 ммоль) у безводному DMF (13 мл) додавали триетиламін (6,37 ммоль, 0,896 мл), піролідин (6,37 ммоль, 0,537 мл), 1-етил-3-(3-диметиламінопропіл)карбодііміду гідрохлорид (4,77 ммоль, 0,963 г) та гідроксі-7-азабензотриазол (1,50 екв., 4,77 ммоль, 0,663 г). Розчин перемішували при кімнатній температурі протягом ночі. Додавали HCl (1 M, 100 мл) та розчин екстрагували діетиловим ефіром (4\*75 мл). Об'єднані органічні шари промивали сольовим розчином, висушували та концентрували. Продукт очищали за допомогою флеш-хроматографії (15 % - 100 % етилацетат у циклогексані) з одержанням 2-(2-аліл-3-тієніл)-1-піролідин-1-іл-етанону у вигляді жовтого гарячого масла (524 мг, 70 %). <sup>1</sup>H ЯМР (400 МГц, CDCl<sub>3</sub>) 7,10 (1H, d), 6,91 (1H, d), 5,94 (1H, m), 5,12 (1H, m), 5,08 (1H, t), 3,55 (4H, m), 3,49 (2H, t), 3,40 (2H, t), 1,90 (4H, m).

35

Етап 4: 1,2а, 7,7а-тетрагідро-2Н-циклобут[а]тіоінден-2-он

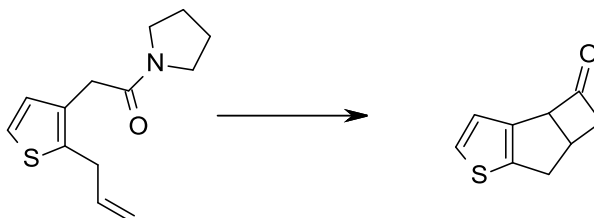
## Спосіб А



До розчину 2-(2-аліл-3-тієніл)оцтової кислоти (етап 2, 0,150 г, 0,823 ммоль) в 1,2-дихлоретані (40 мл) додавали 1-хлор-N, N,2-триметил-проп-1-ен-1-амін (0,988 ммоль, 0,132 г) при 0 °С. Розчин перемішували протягом 1 години, а потім нагрівали зі зворотним холодильником. Потім додавали триетиламін (0,99 ммоль, 0,100 г) у дихлорметані (3 мл) за 1,5 години та розчин перемішували ще 2 години при 70 °С. Розчин охолоджували до кімнатної температури та додавали 50 мл 1 М НСl. Розчин екстрагували дихлорметаном, сушили та концентрували.

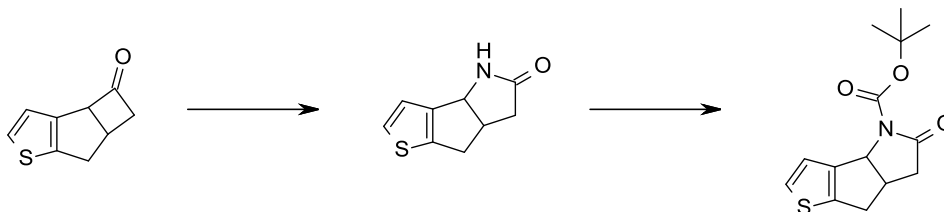
Продукт очищали за допомогою флеш-хроматографії (0 % - 15 % етилацетат у циклогексані) з одержанням названої сполуки у вигляді масла (41 мг, 30 %). <sup>1</sup>Н ЯМР (400 МГц, CDCl<sub>3</sub>) 7,25 (1H, d), 6,88 (1H, d), 4,57 (1H, m), 3,42 (1H, m), 3,36 (2H, m), 3,00 (2H, m).

## Спосіб В



До розчину 2-(2-аліл-3-тієніл)-1-піролідин-1-іл-етанону (етап 3, 1,692 г, 7,191 ммоль) у дихлорметані (150 мл) додавали колідин (12,94 ммоль, 1,73 мл) та ангідрид трифторметансульфонової кислоти (10,0 ммоль, 1,73 мл) у дихлорметані (10 мл). Розчин перемішували протягом 5,5 години при кімнатній температурі та розчинники видаляли. Залишок розділяли між тетрахлоридом вуглецю (4 мл) та водою (4 мл) і двофазну суміш нагрівали до 70 °С протягом ночі. Потім водний шар екстрагували дихлорметаном і об'єднані органічні шари сушили та концентрували. Продукт очищали за допомогою флеш-хроматографії (0 % - 15 % етилацетат у циклогексані) з одержанням названої сполуки у вигляді масла (895 мг, 76 %). Аналітичні дані були ідентичні таким у способі А.

Етап 5: трет-бутиловий естер 2-оксо-3,3a, 4,8b-тетрагідро-2H-тіоіндено[1,2-b]пірол-1-карбонової кислоти

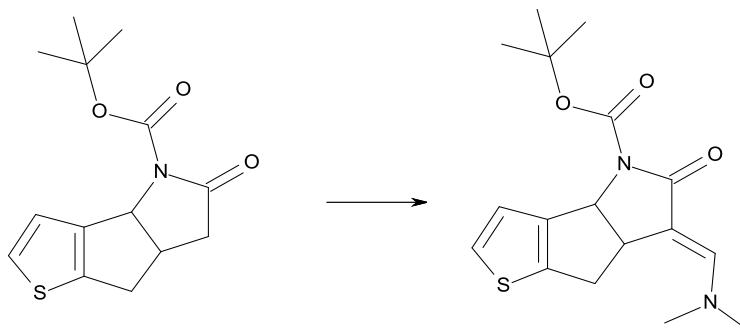


Етап 5a. До розчину 1,2a, 7,7a-тетрагідро-2H-циклобут[а]тіоінден-2-ону (етап 4, 5,45 ммоль, 0,895 г) у дихлорметані (22 мл) додавали О-мезителенсульфонілгідроксиамін (7,09 ммоль, 2,18 г) та розчин перемішували при кімнатній температурі протягом 6 годин. Через 5 годин додавали ще 0,75 екв. О-мезителенсульфонілгідроксиаміну. Розчинник видаляли in vacuo і залишок розбавляли етилацетатом і промивали насиченим NaHCO<sub>3</sub>, сушили та концентрували з одержанням проміжного лактаму у вигляді білої твердої речовини, яку використовували без очищення в наступному етапі. <sup>1</sup>Н ЯМР (400 МГц, DMSO-d<sub>6</sub>) 7,59 (1H, brs), 6,97 (1H, d), 6,63 (1H, d), 4,65 (1H, d), 3,00 (1H, dd), 2,54-2,39 (3H, m), 2,00 (1H, d).

Етап 5b. Одержаний раніше залишок (0,977 г) поміщали в дихлорметан (55 мл) та додавали триетиламін (16,4 ммоль, 2,29 мл), ди-трет-бутилдикарбонат (16,4 ммоль, 3,68 г) та 4-(N, N-диметиламіно)піридин (1,09 ммоль, 0,136 г) і розчин перемішували протягом ночі при кімнатній температурі. Додавали воду та водний шар екстрагували дихлорметаном (4\*20 мл). Об'єднані органічні шари сушили і концентрували. Продукт очищали за допомогою флеш-хроматографії

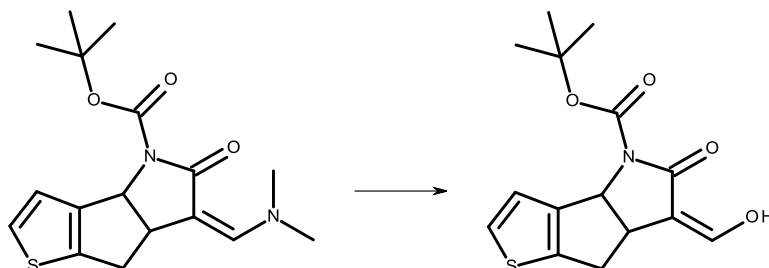
(5 % етилацетат - 35 % етилацетат у циклогексані) з одержанням названої сполуки у вигляді світлої твердої речовини (950 мг, 62 % за 2 етапи).  $^1\text{H}$  ЯМР (400 МГц,  $\text{CDCl}_3$ ) 7,24 (1H, d) 7,03 (1H, d), 5,42 (1H, d), 3,49 (1H, m), 3,25 (1H, dd), 2,90 (1H, dd), 2,82 (1H, d), 2,47 (1H, dd), 1,61 (9H).

Етап 6: трет-бутиловий естер 3-[1-диметиламіно-мет-(Z)-іліден]-2-оксо-3,3а, 4,8b-тетрагідро-2H-тіоіндено[1,2-b]пірол-1-карбонової кислоти



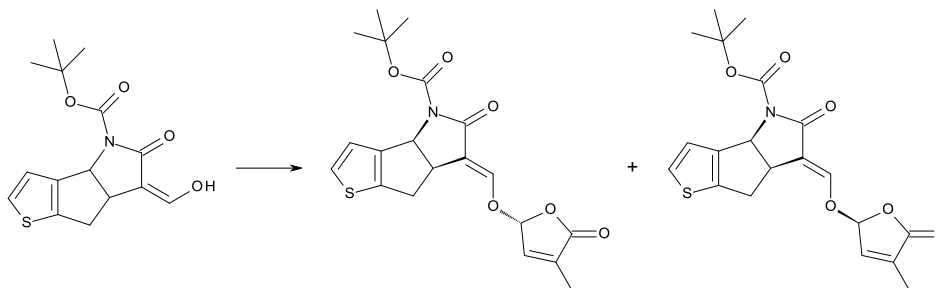
Розчин трет-бутилового естеру 2-оксо-3,3а, 4,8b-тетрагідро-2H-тіоіндено[1,2-b]пірол-1-карбонової кислоти (етап 5, 0,533 ммоль, 0,149 г) у 1-трет-бутоксиді-N, N,N',N'-тетраметилметилендіаміні (1,60 ммоль, 0,33 мл) і толуолі (3 мл) нагрівали до 100 °C протягом 3,5 години. Реакційну суміш охолоджували до кімнатної температури і додавали воду. Водний шар екстрагували етилацетатом (4\*20 мл). Об'єднані органічні шари сушили і концентрували. Продукт очищали за допомогою флеш-хроматографії (0 % етилацетат - 50 % етилацетат у циклогексані) з одержанням названої сполуки у вигляді світлої твердої речовини (132 мг, 74 %).  $^1\text{H}$  ЯМР (400 МГц,  $\text{CDCl}_3$ ) 7,09 (1H, s), 7,07 (1H, d), 7,01 (1H, d), 5,23 (1H, d), 4,30 (1H, m), 3,25 (1H, dd), 2,98 (6H, s), 2,68 (1H, d), 1,61 (9H, s).

Етап 7: трет-бутиловий складний ефір 3-[1-гідрокси-мет-(Z)-іліден]-2-оксо-3,3а, 4,8b-тетрагідро-2H-тіоіндено[1,2-b]пірол-1-карбонової кислоти



До розчину трет-бутилового естеру 3-[1-диметиламіно-мет-(Z)-іліден]-2-оксо-3,3а, 4,8b-тетрагідро-2H-тіоіндено[1,2-b]пірол-1-карбонової кислоти (етап 6, 0,107 г, 0,32 ммоль) у діоксані (5 мл) додавали HCl (2 M, 0,48 мл). Розчин перемішували при кімнатній температурі протягом 1,5 години і потім розбавляли водою, екстрагували етилацетатом, промивали сольовим розчином, сушили та концентрували з одержанням бажаного продукту (99 мг, кільк.).  $^1\text{H}$  ЯМР (400 МГц,  $\text{CDCl}_3$ ) (суміш енолу та альдегіду) 11,12 (0,8H), 7,87 (0,2H, s), 7,25-6,90 (2,8H, m), 5,48-5,32 (1,2H, m), 4,12-3,95 (1H, m), 3,35-3,25 (1H, m), 2,82-2,69 (1H, m), 1,60 (9H, s).

Етап 8: діастереоізомери трет-бутилового естеру (3E)-3-[(2R\*)-(4-метил-5-оксо-2H-фуран-2-іл)оксиметил]-3,3а, 4,8b-тетрагідро-1H-тіоіндено[1,2-b]пірол-2-он-1-карбонової кислоти A1 і A2



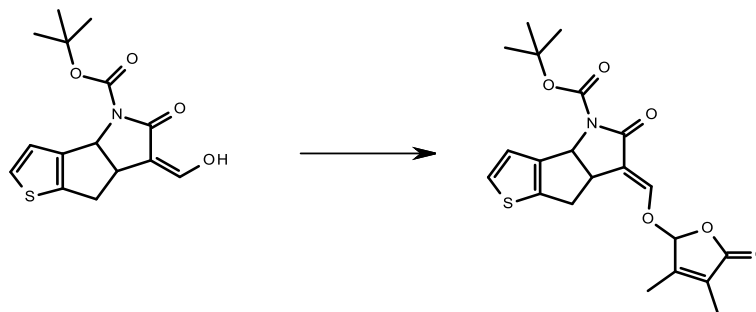
До розчину трет-бутилового естеру 3-[1-гідрокси-мет-(Z)-іліден]-2-оксо-3,3а, 4,8b-тетрагідро-2H-тіоіндено[1,2-b]пірол-1-карбонової кислоти (етап 7, 0,099 г, 0,32 ммоль) в THF (4,0 мл),

охолодженого до 0 °С, додавали трет-бутоксид калію (0,483 ммоль, 0,0553 г) та 18-краун-6-етер (0,483 ммоль, 0,129 г). Через 10 хвилин додавали 2-хлор-4-метил-2Н-фуран-5-он (0,386 ммоль, 0,0512 г) (одержаний як в J. Chem. Soc., Perkin Trans. 1, 1981, 1734-1743) в 1 мл THF та розчин перемішували протягом 40 хвилин. Додавали воду та водний шар екстрагували етилацетатом (4\*20 мл). Об'єднані органічні шари сушили і концентрували. Продукт очищали за допомогою флеш-хроматографії (20 % етилацетат - 50 % етилацетат у циклогексані) з одержанням бажаного продукту у вигляді двох ізомерів:

- менш полярний діастереоізомер: трет-бутиловий складний ефір (3aR\*,8bS\*)-(3E)-3-[(2R\*)-(4-метил-5-оксо-2Н-фуран-2-іл)оксиметиле]н]-3,3a, 4,8b-тетрагідро-1Н-тіоіндено[1,2-b]-он-1-карбонової кислоти A1 (54 мг, 42 %). <sup>1</sup>H ЯМР (400 МГц, CDCl<sub>3</sub>) 7,44 (1H, d), 7,20 (1H, d), 7,04 (1H, d), 6,95 (1H, s), 6,17 (1H, s), 5,44 (1H, d), 4,12 (1H, m), 3,36 (1H, dd), 3,05 (1H, d), 2,02 (3H, s), 1,60 (9H, s); LCMS (спосіб A) RT=1,05 хвилини; ES+326 (M+Na<sup>+</sup>);

- більш полярний діастереоізомер: трет-бутиловий складний ефір (3aR\*,8bS\*)-(3E)-3-[(2S\*)-(4-метил-5-оксо-2Н-фуран-2-іл)оксиметиле]н]-3,3a, 4,8b-тетрагідро-1Н-тіоіндено[1,2-b]пірол-2-он-1-карбонової кислоти A2 (32 мг, 24 %). <sup>1</sup>H ЯМР (400 МГц, CDCl<sub>3</sub>) 7,44 (1H, d), 7,19 (1H, d), 7,03 (1H, d), 6,99 (1H, s), 6,18 (1H, s), 5,44 (1H, d), 4,11 (1H, m), 3,36 (1H, dd), 3,05 (1H, d), 2,03 (3H, s), 1,60 (9H, s). LCMS (спосіб A) RT=1,05 хвилини; ES+326 (M+Na<sup>+</sup>)

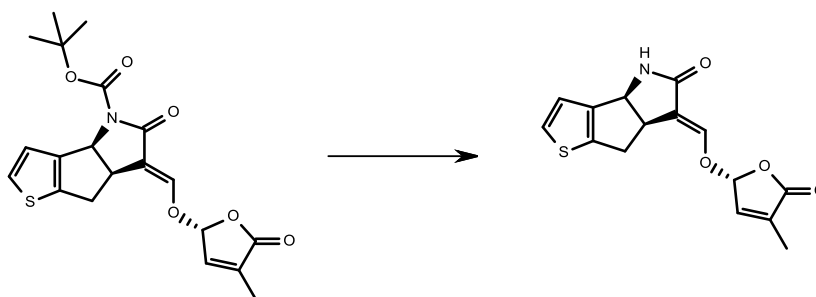
- трет-бутил-(3E)-3-[(3,4-диметил-5-оксо-2Н-фуран-2-іл)оксиметиле]н]-2-оксо-3,3a, 4,8b-тетрагідро-2Н-тіоіндено[1,2-b]пірол-карбоксилат A5



A5

Сполуку одержували способом, подібним до A1 і A2, виходячи з трет-бутилового естеру 3-[1-гідрокси-мет-(Z)-іліден]-2-оксо-3,3a, 4,8b-тетрагідро-2Н-тіоіндено[1,2-b]пірол-1-карбонової кислоти та 5-хлор-3,4-диметил-2(5Н)-фуранону (одержаного як в Tetrahedron 1978, 34(13), 1935-42)). Одержували сполуку трет-бутил-(3E)-3-[(3,4-диметил-5-оксо-2Н-фуран-2-іл)оксиметиле]н]-2-оксо-3,3a, 4,8b-тетрагідро-2Н-тіоіндено[1,2-b]пірол-карбоксилат A5 у вигляді суміші діастереоізомерів. LCMS (спосіб A) RT=1,09 хвилини; ES+481 (M+MeCN+Na<sup>+</sup>).

Етап 9: діастереоізомер (3aR\*,8bS\*)-(3E)-3-[(2R\*)-(4-метил-5-оксо-2Н-фуран-2-іл)оксиметиле]н]-3,3a, 4,8b-тетрагідро-1Н-тіоіндено[1,2-b]пірол-2-ону A3

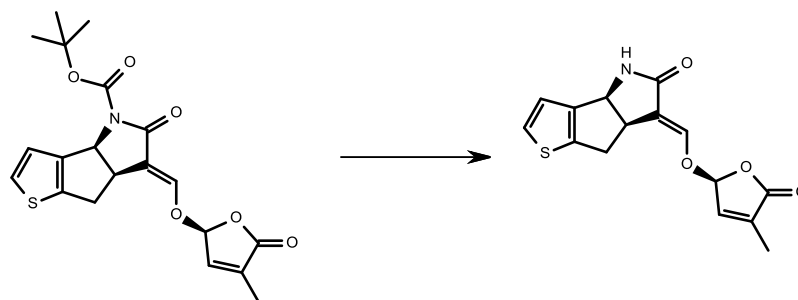


A1

A3

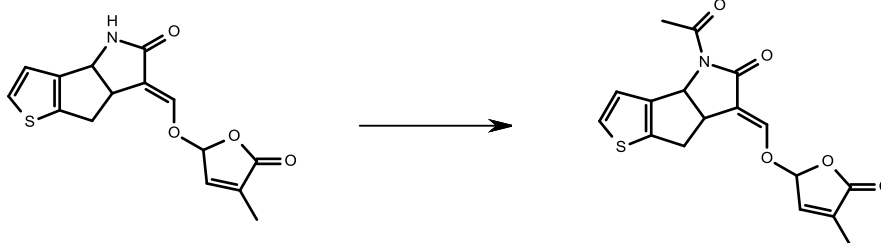
Розчин A1 (етап 8, менш полярного ізомеру, 55 мг, 0,135 ммоль) та хлориду магнію (20 мг, 0,203 ммоль) в ацетонітрилі (2,0 мл) перемішували протягом ночі при 40 °С. Розчин розбавляли етилацетатом і фільтрували та випарювали фільтрат. Продукт очищали за допомогою флеш-хроматографії (етилацетат) з одержанням бажаного продукту A3 (6,9 мг, 29 %). <sup>1</sup>H ЯМР (400 МГц, CD<sub>2</sub>Cl<sub>2</sub>) 7,25 (1H, d), 7,21 (1H, d), 6,95 (1H, brs), 6,93 (1H, s), 6,85 (1H, d), 6,14 (1H, s), 4,94 (1H, d), 4,26 (1H, m), 3,37 (1H, dd), 2,98 (1H, d), 1,98 (3H, s). LCMS (спосіб B) RT=0,80 хвилини; ES+304 (M+H<sup>+</sup>);

Діастереоізомер (3aK\*,8bS\*)-(3E)-3-[(2S\*)-(4-метил-5-оксо-2Н-фуран-2-іл)оксиметиле]н]-3,3a, 4,8b-тетрагідро-2Н-тіоіндено[1,2-b]пірол-2-ону A4

**A2****A4**

Продукт A4 одержували з A2 за допомогою процедури, подібної такій для A3.  $^1\text{H}$  ЯМР (400 МГц,  $\text{CD}_2\text{Cl}_2$ ) 7,26 (1H, d), 7,25 (1H, d), 6,97 (1H, s), 6,87 (1H, d), 6,61 (1H, brs), 6,16 (1H, s), 4,98 (1H, d), 4,29 (1H, m), 3,37 (1H, dd), 2,98 (1H, d), 1,99 (3H, s). LCMS (спосіб B) RT=0,81 хвилини; ES+304 ( $\text{M}+\text{H}^+$ );

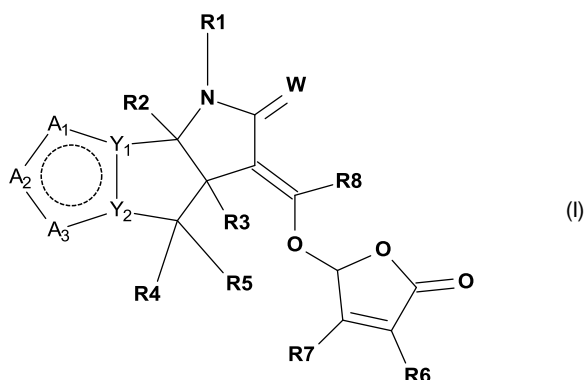
Етап 10: (3E)-1-ацетил-3-[(4-метил-5-оксо-2H-фуран-2-іл)оксиметиле]н-3,3а, 4,8b-тетрагідро-2H-тіоіндено[1,2-b]пірол-2-он A6

**A3+A4****A6**

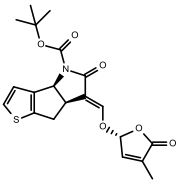
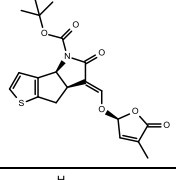
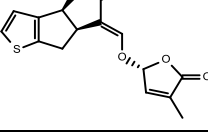
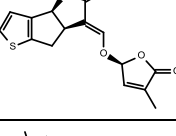
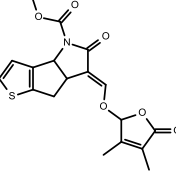
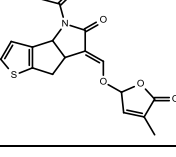
(3E)-3-[(4-метил-5-оксо-2H-фуран-2-іл)оксиметиле]н-3,3а, 4,8b-тетрагідро-1H-тіоіндено[1,2-b]пірол-2-он A3+A4 (20 мг, 0,065 ммоль) і диметиламінопіридин (1,6 мг, 0,013 ммоль) розчиняли в дихлорметані (2 мл) та додавали триетиламін (26 мг, 0,0371 мл, 0,263 ммоль). До розчину по краплях додавали оцтовий ангідрид (20 мг, 0,019 мл, 0,197 ммоль) і реакційну суміш перемішували протягом ночі при кімнатній температурі. Реакційну суміш виливали в розділову лійку, розбавляли етилацетатом, промивали насиченим розчином  $\text{NH}_4\text{Cl}$ , водою та сольовим розчином, сушили над  $\text{MgSO}_4$  та випарювали розчинник. Продукт очищали за допомогою флеш-хроматографії (0-100 % EA) з одержанням (3E)-1-ацетил-3-[(4-метил-5-оксо-2H-фуран-2-іл)оксиметиле]н-3,3а, 4,8b-тетрагідро-2H-тіоіндено[1,2-b]пірол-2-ону A6 (16,5 мг, 72 %). LCMS (спосіб A) RT=0,94 хвилини; ES+346 ( $\text{M}+\text{H}^+$ );

Таблиця 3

сполуки формули (I)





Приклад	Структура	LCMS спосіб	Утримання (хвилини)	Маса
A1		A	1,05	326 (M+Na <sup>+</sup> ).
A2		A	1,05	326 (M+Na <sup>+</sup> ).
A3		B	0,81	304 (M+H <sup>+</sup> )
A4		B	0,81	304 (M+H <sup>+</sup> )
A5		A	1,09	481 (M+MeCN+Na <sup>+</sup> ).
A6		A	0,94	346 (M+H <sup>+</sup> )

#### Біологічні приклади

Вплив сполук формули (I) на проростання насіння *Orobanchе сumana* Wallr. оцінювали на фільтрувальному папері зі скловолокна (GFFP) у чашках Петрі. Насіння попередньо кондиціювали при вологості та придатній температурі, щоб зробити сприйнятливим до конкретних хімічних стимуляторів проростання.

Тестові сполуки розчиняли в DMSO (10000 мг л<sup>-1</sup>) та зберігали при кімнатній температурі в ексикаторах з десикантами. Маточні розчини розчиняли деіонізованою водою для відповідної кінцевої тестової концентрації.

Насіння *O. сumana* раси 'F' збирали з полів соняшника у Мансанілья (Севілья, Іспанія) в 2008 р. (партія насіння IN153) і зберігали при кімнатній температурі. Для того, щоб відокремити насіння від важких органічних залишків, застосовували модифікований спосіб плавучості в розчині сахарози, який описано Hartman & Tanimonure (Plant Disease (1991), 75, р. 494). Насінням заповнювали розділову лійку та перемішували його у воді. Коли насіння сплигло на поверхню, водну фракцію, що містить важкі залишки, відкидали. Насіння повторно суспендували в 2,5М розчині сахарози (відносна щільність 1,20) і важким залишкам дозволяли осідати протягом 60 хвилин. Після видалення залишків насіння дезінфікували в 1 % розчині гіпохлориту натрію та 0,025 % (об'єм/об'єм) Твееп 20 протягом 2 хвилин. Насіння зціджували на подвійний шар марлі, промивали стерильною деіонізованою водою та повторно суспендували в стерильній деіонізованій воді. Два мл суспензії насіння, що містить приблизно 150-400 насінин, рівномірно наносили на подвійний шар стерильного диска фільтрувального паперу зі скловолокна (Ø 9 мм) у чашках Петрі (Ø 9 см). Після змочування дисків 3 мл стерильної

деіонізованої води чашки Петрі запечатували парафільмом. Насіння інкубували протягом 10 днів при 20 °C у темряві для кондиціювання насіння. Верхній диск із кондиціонованим насінням недовго сушили, переносили в чашку Петрі, покриту сухим диском GFFP, і змочували 6 мл відповідного тестового розчину. Сполуки формули (I) тестували при концентраціях 0,001, 0,01 та 0,1 мг л<sup>-1</sup>. Аналог стриголактону GR24 (комерційно доступний у вигляді суміші ізомерів) включали як позитивний контроль та 0,001 % DMSO як негативний контроль. Усі обробки тестували у п'ятьох повторностях. Насіння повторно інкубували при 20 °C у темряві та досліджували щодо проростання через 10 днів. Первинні корінці пророщеного насіння фарбували протягом 5 хвилин синім чорнилом (MIGROS, Switzerland) в 5 % оцтовій кислоті згідно з Long et al. (Seed Science Research (2008), 18, p. 125). Після фарбування насіння сканували з використанням планшетного сканера з оптичним дозволом 1200 точок на дюйм (PULSTEK, Opticpro ST28) або фотографували з використанням штатива кінокамери із установленою цифровою SLR камерою (Canon EOS 5D). Проростання 100 насінин на повторність оцінювали за цифровими зображеннями. Насіння вважали пророщеним, якщо первинний корінець виступав з насінної оболонки. Результати тестів із проростанням насіння Orobanche показано в таблиці 4.

Таблиця 4:

вплив аналогів стриголактону на проростання  
попередньо обробленого насіння Orobanche cymana

Сполука	Концентрація (мг л <sup>-1</sup> )		
	0,1	0,01	0,001
	Проростання (%)*		
A3	84,6	85,6	87,8
GR-24	78,4	65	67

\* Середнє; N=5 × 100 насінин; партія насіння IN153

Контроль, DMSO 0,01 % (вага/вага): проростання 1,4 %

Біологічні приклади

Вплив сполук формули (I) на проростання Brassica oleracea вид Botrytis або звичайної цвітної капусти тестували на двох видах цвітної капусти: видах помірної смуги та тропічних видах. Ці два види були вибрані тому, що вони проявляють різну чутливість до світлових умов та температури під час проростання. Проростання чутливого виду помірної смуги пригнічувалося світлом при 10 °C, тоді як для тропічних видів проростання стимулювалося при 20° присутністю світла. Таким чином, 10 °C у світлі та 20 °C у темряві вважають субоптимальними або стресовими умовами для проростання даних двох видів, відповідно.

Партії насіння для тестування видів помірної смуги були частиною партій насіння різних сортів, що комерційно випускаються, які, як відомо, чутливі до світла при 10 °C. Це насіння збирали та очищали у відповідно до стандартних комерційних процедур. Використовували готові партії насіння (готовність указує на рівень обробки цього насіння: воно було очищене та сортоване за розміром, але не піддавалося ніяким іншим обробкам). Тестовані партії насіння тропічного типу були частиною партій насіння, які одержували як основне насіння (для збереження батьківської лінії) та обробляли відповідним чином.

Проростання оцінювали з використанням стандартного тесту проростання на папері для Brassica. П'ятдесят насінин поміщали на блакитний папір для проростання, який зволожували відповідними розчинами в закритих довгастих боксах для проростання. Кожну умову тестували in duplo. Бокси для проростання поміщали в камери контрольованого проростання з відповідними температурними та світловими умовами. Проростання насіння підраховували з постійними інтервалами. Насіння вважали пророслими, коли корінь виступав з насінної оболонки йта ендосперми (розмір кореня приблизно 1 мм).

Тестовані сполуки розчиняли в DMSO при концентрації 50 мМ та зберігали при -20 °C. Аналог стриголактону GR24 (комерційно доступний у вигляді рацемічної суміші 2 діастереоізомерів, за назвою "синтетичний стриголактон GR-24", уперше одержаний згідно з Johnson A. W. & all, Journal of the Chemical Society, Perkin Transactions 1, 1981, page 1734-1743) включали як позитивний контроль. Розчини для проростання одержували шляхом розведення маточних розчинів демінералізованою водою до 25 мкМ. Як контрольні розчини використовували демінералізовану воду та 0,05 % вага/вага розчин DMSO.

Вплив похідних стриголактону на проростання показаний в таблиці 5. Ці результати показують, що стриголактони стимулюють проростання за субоптимальних умов.

Таблиця 5

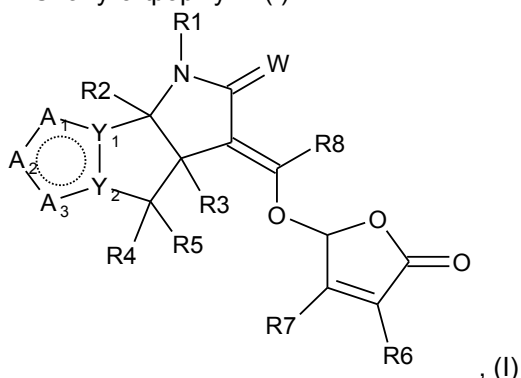
проростання насіння цвітної капусти помірної смуги Spacestar (партія насіння 11B313; вироблена в Південній Африці в 2010 р. (не стійка до холоду); і партія насіння 11B314; вироблена в Чилі в 2010 р. (холодостійка)) у присутності 25 мкМ різних похідних стриголактону при 10 °C на світлі

	Spacestar 11B313		Spacestar 11B314	
	G <sub>max</sub> <sup>a</sup>	стимуляція <sup>b</sup>	G <sub>max</sub> <sup>a</sup>	стимуляція <sup>b</sup>
сполука	(%)	(%)	(%)	(%)
DMSO	60,0	0,0	90,5	0,0
GR24	71,5	19,2	93,5	3,3
A3	75,0	38,9	94,0	9,3

- 5 <sup>a</sup>: загальне проростання, виражене в процентних частках від висіяного насіння.  
<sup>b</sup>: збільшене проростання в порівнянні з обробкою DMSO (контроль), виражене у процентних частках від проростання при обробці DMSO.

# ФОРМУЛА ВІНАХОДУ

## 1. Сполука формули (I)



де

W являє собою O або S;

- 15 R2 та R3 незалежно являють собою водень або C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>алкіл;  
R4 та R5 незалежно являють собою водень, галоген, нітро, ціано, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>алкіл, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>галогеналкіл, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>алкокси, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>галогеналкокси, гідроксил, -OC(O)R<sub>9</sub>, амін, N-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>алкіламін або N,N-ді-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>алкіламін;  
R9 являє собою водень, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>алкіл, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>алкокси або C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>галогеналкіл;  
20 R6 та R7 незалежно являють собою водень, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>алкіл, гідроксил, галоген або C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>алкокси;  
R8 являє собою водень, нітро, ціано, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>алкіл або C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>галогеналкіл;  
R1 являє собою водень, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>алкокси, гідроксил, амін, N-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>алкіламін, N,N-ді-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>алкіламін, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>алкіл, необов'язково заміщений одним-п'ятьма R<sub>10</sub>, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>алкілкарбоніл- або C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>алкоксикарбоніл-, арил, необов'язково заміщений одним-п'ятьма R<sub>10</sub>, гетероарил,  
25 необов'язково заміщений одним-п'ятьма R<sub>10</sub>, гетероциклі, необов'язково заміщений одним-п'ятьма R<sub>10</sub>, бензил, необов'язково заміщений одним-п'ятьма R<sub>10</sub>, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>алкеніл, необов'язково заміщений одним-п'ятьма R<sub>10</sub>, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>алкініл, необов'язково заміщений одним-п'ятьма R<sub>10</sub>, C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>циклоалкіл або C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub>циклоалкіл, заміщений одним-п'ятьма R<sub>10</sub>;  
R<sub>10</sub> являє собою ціано, нітро, галоген, гідроксил, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>алкіл, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>алкокси, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>галогеналкокси, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>галогеналкіл, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>алкілтіо-, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>галогеналкілтіо-, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>алкілсульфініл-,  
30 N-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>алкіламін, N,N-ді-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>алкіламін, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>галогеналкілсульфініл-, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>алкілсульфоніл-, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>галогеналкілсульфоніл-, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>алкілкарбоніл-, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>алкоксикарбоніл, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>алкеніл або C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>алкініл;  
кожний з Y<sub>1</sub> та Y<sub>2</sub> являє собою C;  
35 кожний з A<sub>1</sub> та A<sub>2</sub> являє собою C-X, де кожний X може бути однаковим або різним, за умови, що A<sub>1</sub>, A<sub>2</sub>, A<sub>3</sub>, Y<sub>1</sub> та Y<sub>2</sub> утворюють ароматичне кільце;

A<sub>3</sub> являє собою сірку;

та X являє собою водень, галоген, ціано, нітро, гідроксил, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>алкокси, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>галогеналкокси, амін, N-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>алкіламін, N,N-ді-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>алкіламін, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>алкіл, необов'язково заміщений одним-п'ятьма R10, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>алкілкарбоніл- або C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>алкоксикарбоніл-, N-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>алкіламінокарбоніл, N,N-ді-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>алкіламінокарбоніл, арил, необов'язково заміщений одним-п'ятьма R10, гетероарил, необов'язково заміщений одним-п'ятьма R10, гетероцикліл, необов'язково заміщений одним-п'ятьма R10, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>алкеніл, необов'язково заміщений одним-п'ятьма R10, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>алкініл, необов'язково заміщений одним-п'ятьма R10, C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>циклоалкіл, C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub>циклоалкіл, заміщений одним-п'ятьма R10, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>алкілтіо-, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>галогеналкілтіо-, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>алкілсульфініл-, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>галогеналкілсульфініл-, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>алкілсульфоніл- або C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>галогеналкілсульфоніл; або її солі або N-оксиди.

2. Сполука за п. 1, де W являє собою O.

3. Сполука за п. 2, де

R2 та R3 незалежно являють собою водень, метил або етил;

R4 та R5 незалежно являють собою водень, гідроксил, метил або етил;

R6, R7 та R8 незалежно являють собою водень, метил або етил;

R1 вибраний з групи, що складається з водню, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>алкілу, необов'язково заміщеного одним-п'ятьма R10, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>алкілкарбонілу- або C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>алкоксикарбонілу-, арилу, необов'язково заміщеного одним-п'ятьма R10, або гетероарилу, необов'язково заміщеного одним-п'ятьма R10, гетероциклілу, необов'язково заміщеного одним-п'ятьма R10, бензилу, необов'язково заміщеного одним-п'ятьма R10;

R10 незалежно являє собою ціано, нітро, галоген, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>алкіл, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>алкокси або C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>галогеналкіл;

кожний з Y<sub>1</sub> та Y<sub>2</sub> являє собою вуглець;

кожний з A<sub>1</sub> та A<sub>2</sub> являє собою C-X;

X являє собою водень, гідроксил, галоген, ціано, метил, етил, н-пропіл, гідроксиметил, трифторметил або метокси; та

A<sub>3</sub> являє собою сірку.

4. Сполука за п. 3, де R1 являє собою водень, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>алкіл, необов'язково заміщений одним-п'ятьма R10, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>алкілкарбоніл-, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>алкоксикарбоніл-, бензил, необов'язково заміщений одним-п'ятьма R10, або арил, необов'язково заміщений одним-п'ятьма R10.

5. Сполука за п. 3, де X являє собою водень, метил, метокси або трифторметил.

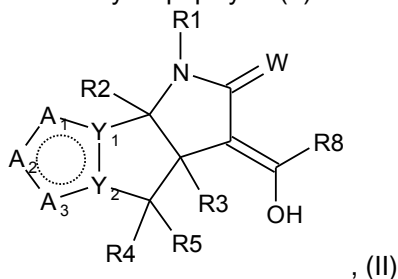
6. Композиція для регуляції росту рослин або стимуляції проростання насіння, яка містить сполуку за будь-яким з попередніх пунктів та прийнятний з погляду сільського господарства допоміжний засіб для складання.

7. Спосіб стимуляції проростання насіння, який включає застосування щодо насіння або місця розташування, що містить насіння, сполуки за будь-яким з пп. 1-5 або композиції за п. 6 у кількості, що стимулює проростання насіння.

8. Матеріал для розмноження рослин, що містить сполуку за будь-яким з пп. 1-5 або композицію за п. 6.

9. Спосіб контролю бур'янистих рослин, який включає застосування щодо місця розташування, що містить насіння бур'янистих рослин, сполуки за будь-яким з пп. 1-5 або композиції за п. 6 у кількості, що стимулює проростання насіння, забезпечення можливості проростання насіння, а потім застосування щодо місця розташування післясходового гербіциду.

10. Сполука формули (II)



де

W являє собою O або S;

R2 та R3 незалежно являють собою водень або C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>алкіл;

R4 та R5 незалежно являють собою водень, галоген, нітро, ціано, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>алкіл, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>галогеналкіл, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>алкокси, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>галогеналкокси, гідроксил, -OC(O)R9, амін, N-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>алкіламін або N,N-ді-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>алкіламін;

- R9 являє собою водень, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>алкіл, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>алкокси або C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>галогеналкіл;  
 R8 являє собою водень, нітро, ціано, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>алкіл або C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>галогеналкіл;  
 R1 являє собою водень, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>алкокси, гідроксил, амін, N-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>алкіламін, N,N-ді-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>алкіламін, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>алкіл, необов'язково заміщений одним-п'ятьма R10, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>алкілкарбоніл- або C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>алкоксикарбоніл-, арил, необов'язково заміщений одним-п'ятьма R10, або гетероарил, необов'язково заміщений одним-п'ятьма R10, гетероцикліл, необов'язково заміщений одним-п'ятьма R10, бензил, необов'язково заміщений одним-п'ятьма R10, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>алкеніл, необов'язково заміщений одним-п'ятьма R10, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>алкініл, необов'язково заміщений одним-п'ятьма R10, C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>циклоалкіл або C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub>циклоалкіл, заміщений одним-п'ятьма R10;
- 10 R10 являє собою ціано, нітро, галоген, гідроксил, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>алкіл, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>алкокси, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>галогеналкокси, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>галогеналкіл, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>алкілтіо-, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>галогеналкілтіо-, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>алкілсульфініл-, N-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>алкіламін, N,N-ді-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>алкіламін, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>галогеналкілсульфініл-, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>алкілсульфоніл-, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>галогеналкілсульфоніл-, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>алкілкарбоніл-, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>алкоксикарбоніл, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>алкеніл або C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>алкініл;
- 15 кожний з Y<sub>1</sub> та Y<sub>2</sub> являє собою C;  
 кожний з A<sub>1</sub> та A<sub>2</sub> являє собою C-X, де кожний X може бути однаковим або різним, за умови, що A<sub>1</sub>, A<sub>2</sub>, A<sub>3</sub>, Y<sub>1</sub> та Y<sub>2</sub> утворюють ароматичне кільце;  
 A<sub>3</sub> являє собою сірку;
- 20 та X являє собою водень, галоген, ціано, нітро, гідроксил, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>алкокси, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>галогеналкокси, амін, N-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>алкіламін, N,N-ді-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>алкіламін, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>алкіл, необов'язково заміщений одним-п'ятьма R10, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>алкілкарбоніл- або C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>алкоксикарбоніл-, N-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>алкіламінокарбоніл, N,N-ді-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>алкіламінокарбоніл, арил, необов'язково заміщений одним-п'ятьма R10, гетероарил, необов'язково заміщений одним-п'ятьма R10, гетероцикліл, необов'язково заміщений одним-п'ятьма R10, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>алкеніл, необов'язково заміщений одним-п'ятьма R10, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>алкініл, необов'язково заміщений одним-п'ятьма R10, C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>циклоалкіл, C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub>циклоалкіл, заміщений одним-п'ятьма R10, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>алкілтіо-, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>галогеналкілтіо-, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>алкілсульфініл-, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>галогеналкілсульфініл-, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>алкілсульфоніл- або C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>галогеналкілсульфоніл;
- 25 або її солі, або N-оксиди.

---

Комп'ютерна верстка Г. Паяльніков

---

Державна служба інтелектуальної власності України, вул. Василя Липківського, 45, м. Київ, МСП, 03680, Україна

---

ДП "Український інститут промислової власності", вул. Глазунова, 1, м. Київ – 42, 01601