



УКРАЇНА

(19) **UA** (11) **81626** (13) **C2**
(51) **МПК (2009)**
C07D 401/14 (2006.01)
A01N 43/40 (2006.01)
A01P 13/00

МІНІСТЕРСТВО ОСВІТИ
І НАУКИ УКРАЇНИ

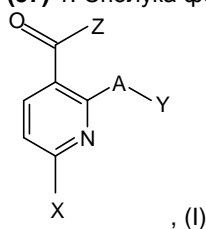
ДЕРЖАВНИЙ ДЕПАРТАМЕНТ
ІНТЕЛЕКТУАЛЬНОЇ
ВЛАСНОСТІ

ОПИС ДО ПАТЕНТУ НА ВИНАХІД

(54) 2,6-ЗАМІЩЕНІ ПІРИДИН-3-КАРБОНІЛЬНІ ПОХІДНІ ТА ПРОМІЖНІ СПОЛУКИ

1

- (21) 20041109747
(22) 16.04.2003
(24) 25.01.2008
(86) РСТ/ЕР03/03948, 16.04.2003
(31) 102 19 036.4
(32) 29.04.2002
(33) DE
(46) 25.01.2008, Бюл.№ 2, 2008 р.
(72) ШВАРЦ ХАНС-ГЕОРГ, DE, ХОШЕН ДОРО-
ТЕЕ, DE, КАТЕР КРІСТІАН, DE, МЮЛЛЕР КЛАУС-
ХЕЛЬМУТ, AT/DE, ДРЕВЕС МАРК ВІЛЬХЕЛЬМ,
DE, ДАМЕН ПЕТЕР, DE, ФОЙХТ ДІТЕР, DE, ПОН-
ТЦЕН РОЛЬФ, DE
(73) БАЕР КРОПСАЄНС АКЦІЕНГЕЗЕЛЬШАФТ,
DE
(56) WO 0039094, A1, 06.07.2000
WO 0015615, A, 23.03.2000
WO 0166522, A, 1309.2001
WO 0154501, A, 02.08.2001
WO 0194339, A, 13.12.2001
EP 0 791 572, A, 27.08.1997
(57) 1. Сполука формули (I)



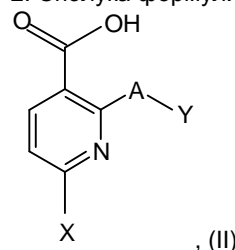
в якій

A означає алкандііл, що містить від 1 до 6 атомів вуглецю, при необхідності, перерваний киснем,
X означає заміщений галогеном C₁-C₆-алкіл або C₁-C₆-алкілсульфоніл,
Y означає 5-6-членний насичений або ненасиче-
ний гетероцикл, який містить від 1 до 4 атомів азо-
ту та, при необхідності, додатково містить один
атом кисню, SO₂-групу або оксогрупу, як складові
гетероциклу, при необхідності, заміщений, який
приєднаний до A атомом азоту, причому атоми
азоту можуть бути заміщені,

2

Z означає циклогексан-1,3-діон або піразол, який
може бути заміщений.

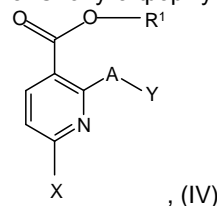
2. Сполука формули (II)



в якій

A означає C₁-C₄-алкандііл,
X означає заміщений галогеном C₁-C₆-алкіл або
C₁-C₆-алкілсульфоніл,
Y означає 5-6-членний, насичений або ненасиче-
ний гетероцикл, який містить від 1 до 4 атомів азо-
ту та, при необхідності, додатково містить один
атом кисню, SO₂-групу або оксогрупу, як складові
гетероциклу, при необхідності, заміщений, причо-
му атоми азоту можуть бути заміщені.

3. Сполука формули (VI)



в якій

R¹ означає C₁-C₄-алкіл,
A означає C₁-C₆-алкандііл,
X означає заміщений галогеном C₁-C₆-алкіл або
C₁-C₆-алкілсульфоніл,
Y означає 5-6-членний, насичений або ненасиче-
ний гетероцикл, який містить від 1 до 4 атомів азо-
ту та, при необхідності, додатково містить один
атом кисню, SO₂-групу або оксогрупу, як складові
гетероциклу, при необхідності, заміщений, причо-
му атоми азоту можуть бути заміщені.

(13) **C2**

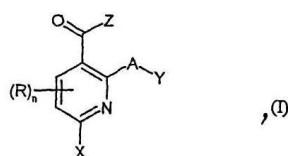
(11) **81626**

(19) **UA**

Винахід стосується нових заміщених піридилкетонів, способу їх одержання та їх застосування як засобів для обробки рослин, зокрема як гербіцидів.

Вже відомо, що певні заміщені піридилкетони проявляють гербіцидні властивості [див. WO-A-01/66522, WO-A-00/39094, WO-A-00/15615, WO-A-96/17829, WO-A-96/14285/EP-A-791572, WO-A-93/01171/EP-A-641780, JP-A-0429973 - цитований в Chem. Abstracts 116:230216, JP-A-03052862 - цитований в Chem. Abstracts 115:226166, WO-A-91/00260/EP-A-432275, JP-A-03038586 - цитований в Chem. Abstracts 115:293323]. Хоча дія цієї сполуки не в усіх випадках є задовільною.

Були описані нові заміщені піридилкетони формули (I)



в якій

n означає число 0, 1 або 2,

A означає, в разі необхідності, перерваний O (киснем), S (сіркою), SO або SO₂ алкандіол або α- або ω-оксаалкандіол, α, ω-діоксаалкандіол, або α- або ω-тіаалкандіол або α, ω-дитіаалкандіол, що містять відповідно від 1 до 6 атомів вуглецю,

R означає нітро, ціано, карбокси, карбамоїл, тіокарбамоїл, галоген, або відповідно, в разі необхідності, заміщені ціано, гідрокси, галогеном або C₁-C₄-алкокси алкіл, алкокси, алкілтіо, алкілсульфініл, алкілсульфоніл, алкіламіно, діалкіламіно або діалкіламіносульфоніл, що містять відповідно від 1 до 6 атомів вуглецю в алкільних групах,

X означає нітро, ціано, карбокси, карбамоїл, тіокарбамоїл, галоген, або відповідно, в разі необхідності, заміщені ціано, гідрокси, галогеном або C₁-C₄-алкокси алкіл, алкокси, алкілтіо, алкілсульфініл, алкілсульфоніл, алкіламіно, діалкіламіно або діалкіламіносульфоніл, що містять відповідно від 1 до 6 атомів вуглецю в алкільних групах,

Y означає 4- - 12-членний, насичений або ненасичений, моно- або біциклічний гетероцикл,

в разі необхідності, заміщений гідрокси, меркапто, ціано, галогеном, заміщений алкілом, алкілкарбонілом, алкокси, алкоксикарбонілом, алкілтіо, алкілсульфінілом або алкілсульфонілом, які відповідно, в разі необхідності, заміщені ціано, галогеном, C₁-C₄-алкокси, C₁-C₄-алкілтіо, C₁-C₄-алкілсульфінілом або C₁-C₄-алкілсульфонілом та містять відповідно від 1 до 6 атомів вуглецю в алкільних групах,

заміщений алкіламіно або діалкіламіно, які відповідно, в разі необхідності, заміщені галогеном та містять відповідно від 1 до 6 атомів вуглецю в алкільних групах,

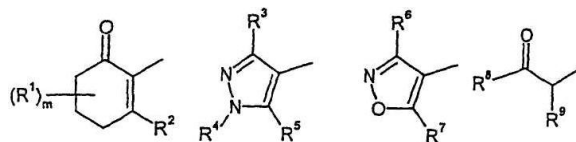
заміщений алкенілом, алкінілом, алкенілокси, алкенілтіо або алкеніламіно, які відповідно, в разі необхідності, заміщені галогеном та містять відповідно від 1 до 6 атомів вуглецю в алкенільних або алкінільних групах,

заміщений циклоалкілом, циклоалкілокси, циклоалкілтіо, циклоалкіламіно, циклоалкілалкілом, циклоалкілалкокси, циклоалкілалкілтіо або циклоалкілалкіламіно, які відповідно, в разі необхідності, заміщені галогеном та/або C₁-C₄-алкілом та містять відповідно від 3 до 6 атомів вуглецю в циклоалкільних групах та, в разі необхідності, від 1 до 4 атомів вуглецю в алкільній частині, або

заміщений фенілом, фенілокси, фенілтіо, феніламіно, бензилом, бензілокси, бензилтіо або бензиламіно, які відповідно, в разі необхідності, заміщені галогеном, C₁-C₄-алкілом або C₁-C₄-алкокси,

який містить від 1 до 4 атомів азоту та, в разі необхідності, додатково один атом кисню, один атом сірки, SO-групу або SO₂-групу, від 1 до 3 оксо-груп (C=O), від 1 до 3 тіоксо-груп (C=S) або від 1 до 3 ціаніміно-груп (C=N-CN) як складові гетероциклу, який приєднаний до A атомом азоту, та

Z означає одну з груп



причому

m означає число від 0 до 6,

R¹ означає галоген, відповідно, в разі необхідності, заміщені ціано, гідрокси, галогеном, C₁-C₄-алкокси, C₁-C₄-алкілтіо, C₁-C₄-алкілсульфінілом або C₁-C₄-алкілсульфонілом алкіл або алкілтіо, що містять відповідно від 1 до 6 атомів вуглецю, або феніл, або - у випадку якщо m означає від 2 до 6 - R¹, в разі необхідності, також разом з іншим залишком R¹ означає кисень або алкандіол (алкілен), що містять від 2 до 5 атомів вуглецю,

R² означає гідрокси, формілокси, галоген, відповідно, в разі необхідності, заміщені ціано, гідрокси, галогеном, C₁-C₄-алкокси, C₁-C₄-алкілтіо, C₁-C₄-алкілсульфінілом або C₁-C₄-алкілсульфонілом алкокси, алкілтіо, алкілсульфініл, алкілсульфоніл, алкілкарбонілокси, алкоксикарбонілокси, алкіламінокарбонілокси, алкілсульфонілокси або алкілсульфоніламіно, що містять відповідно від 1 до 6 атомів вуглецю, відповідно, в разі необхідності, заміщені галогеном алкенілокси або алкінілокси, що містять відповідно від 3 до 6 атомів вуглецю, відповідно в разі необхідності, заміщені нітро, ціано, галогеном, C₁-C₄-алкілом, C₁-C₄-галогеналкілом, C₁-C₄-алкокси, C₁-C₄-галогеналкокси, C₁-C₄-алкілтіо, C₁-C₄-галогеналкілтіо, C₁-C₄-алкілсульфінілом, C₁-C₄-галогеналкілсульфінілом, C₁-C₄-алкілсульфонілом або C₁-C₄-галогеналкілсульфонілом арилокси, арилтіо, арилсульфініл, арилсульфоніл, арилкарбонілокси, арилкарбонілалкокси, арилсульфонілокси, арилсульфоніламіно, ариалкокси, ариалкілтіо, ариалкілсульфініл або ариалкілсульфоніл, що містять відповідно 6 або 10 атомів вуглецю в арильній групі та, в разі необхідності, від 1 до 4 атомів вуглецю в алкільній частині, або групу Y' -

причому Y' має вказане вище для Y значення, хоча в окремих випадках і не співпадає з Y,

R³ означає водень, ціано, карбамоїл, тіокарбамоїл, галоген, відповідно, в разі необхідності, заміщені ціано, гідрокси, галогеном, C₁-C₄-алкокси, C₁-C₄-алкілтіо, C₁-C₄-алкілсульфінілом або C₁-C₄-алкілсульфонілом алкіл, алкокси, алкілтіо, алкілсульфініл, алкілсульфоніл або алкоксикарбоніл, що містять відповідно від 1 до 6 атомів вуглецю в алкільних групах, або, в разі необхідності, заміщений ціано, галогеном або C₁-C₄-алкілом циклоалкіл, що містить від 3 до 6 атомів вуглецю,

R⁴ означає водень, в разі необхідності, заміщений ціано, гідрокси, галогеном, C₁-C₄-алкокси, C₁-C₄-алкілтіо, C₁-C₄-алкілсульфінілом алкіл, що містить від 1 до 6 атомів вуглецю, відповідно, в разі необхідності, заміщені ціано або галогеном алкеніл або алкініл, що містять відповідно від 3 до 6 атомів вуглецю, відповідно, в разі необхідності, заміщені ціано, галогеном або C₁-C₄-алкілом циклоалкіл або циклоалкілалкіл, що містять відповідно від 3 до 6 атомів вуглецю в циклоалкільній групі та, в разі необхідності, від 1 до 4 атомів вуглецю в алкільній частині, або відповідно, в разі необхідності, заміщені нітро, ціано, галогеном, C₁-C₄-алкілом, C₁-C₄-галогеналкілом, C₁-C₄-алкокси, C₁-C₄-галогеналкокси, C₁-C₄-алкілтіо, C₁-C₄-галогеналкілтіо, C₁-C₄-алкілсульфінілом, C₁-C₄-галогеналкілсульфінілом, C₁-C₄-алкілсульфонілом або C₁-C₄-галогеналкілсульфонілом арил або арилалкіл, що містять відповідно 6 або 10 атомів вуглецю в арильній групі та, в разі необхідності, від 1 до 4 атомів вуглецю в алкільній частині,

R⁵ означає гідрокси, формілокси, відповідно, в разі необхідності, заміщені ціано, галогеном, C₁-C₄-алкокси або C₁-C₄-алкоксикарбонілом алкокси, алкілкарбонілокси, алкоксикарбонілокси, алкіламінокарбонілокси або алкілсульфонілокси, що містять відповідно від 1 до 6 атомів вуглецю в алкільних групах, відповідно, в разі необхідності, заміщені ціано або галогеном алкенілокси або алкінілокси, що містять відповідно від 3 до 6 атомів вуглецю, або відповідно, в разі необхідності, заміщені нітро, ціано, галогеном, C₁-C₄-алкілом, C₁-C₄-галогеналкілом, C₁-C₄-алкокси, C₁-C₄-галогеналкокси, C₁-C₄-алкілтіо, C₁-C₄-галогеналкілтіо, C₁-C₄-алкілсульфінілом, C₁-C₄-галогеналкілсульфінілом, C₁-C₄-алкілсульфонілом або C₁-C₄-галогеналкілсульфонілом арилалкокси, арилкарбонілокси, арилкарбонілалкокси або арилсульфонілокси, що містять відповідно 6 або 10 атомів вуглецю в арильній групі та, в разі необхідності, від 1 до 4 атомів вуглецю в алкільній частині,

R⁶ означає водень, ціано, карбамоїл, тіокарбамоїл, галоген, або відповідно, в разі необхідності, заміщені ціано, галогеном або C₁-C₄-алкокси алкіл, алкілкарбоніл, алкокси, алкоксикарбоніл, алкілтіо, алкілсульфініл або алкілсульфоніл, що містять відповідно від 1 до 6 атомів вуглецю,

R⁷ означає водень, в разі необхідності, заміщений ціано, галогеном або C₁-C₄-алкокси алкіл, що містить від 1 до 6 атомів вуглецю, або, в разі необхідності, заміщений ціано, галогеном або C₁-

C₄-алкілом циклоалкіл, що містить від 3 до 6 атомів вуглецю,

R⁸ означає водень, в разі необхідності, заміщений ціано, галогеном або C₁-C₄-алкокси алкіл, що містить від 1 до 6 атомів вуглецю, або, в разі необхідності, заміщений ціано, галогеном або C₁-C₄-алкілом циклоалкіл, що містить від 3 до 6 атомів вуглецю, та

R⁹ означає водень, ціано, карбамоїл, галоген, або відповідно, в разі необхідності, заміщені ціано, галогеном або C₁-C₄-алкокси алкіл, алкокси, алкоксикарбоніл, алкілтіо, алкілсульфініл або алкілсульфоніл, що містять відповідно від 1 до 6 атомів вуглецю в алкільних групах,

- включаючи всі можливі таутомерні форми сполук загальної формули (I) та можливі солі або кислотні або основні адукти сполук загальної формули (I).

Якщо не зазначено нічого іншого, наведені вище та нижче визначення мають такі значення:

Насичені або ненасичені вуглеводневі ланцюги, такі як алкіл, алкандііл, алкеніл або алкініл, також разом з гетероатомами, як, наприклад, алкокси, алкілтіо або алкіламіно, є відповідно нерозгалуженими або розгалуженими. При цьому, якщо не вказано нічого іншого, перевагу надають вуглеводневим ланцюгам, що містять від 1 до 6 атомів вуглецю. Циклоалкіл означає насичені, карбоциклічні сполуки, які, в разі необхідності, разом з іншими карбоциклічними приконденсованими або перекритими циклами утворюють поліциклічну кільцеву систему. При цьому, якщо не вказано нічого іншого, перевагу надають циклопропілу, циклопентилу та циклогексилу.

Арил означає ароматичні, моно- або поліциклічні вуглеводневі цикли, такі як, наприклад, феніл, нафтил, антраніл, фенантрин, переважно феніл або нафтил, зокрема феніл.

Гетероциклік означає насичені, ненасичені або ароматичні, кільцеві сполуки, в яких щонайменше один член кільця означає гетероатом, тобто відмінний від вуглецю атом. Якщо кільце містить кілька гетероатомів, вони є однаковими або різними. Гетероатомами є переважно кисень, азот або сірка. Якщо це кільце містить кілька атомів кисню, то вони не є сусідніми. В разі необхідності, кільцеві сполуки разом з іншими карбоциклічними або гетероциклічними приконденсованими або перекритими циклами утворюють поліциклічну кільцеву систему. Поліциклічна кільцева система може бути приєднана через гетероциклічне кільце або приконденсоване карбоциклічне кільце. Перевагу при цьому надають моно- або біциклічним кільцевим системам, зокрема моноциклічним кільцевим системам, що мають 5 або 6 членів кільця, та біциклічним кільцевим системам, що містять від 7 до 9 членів кільця.

Сполуки загальної формули (I) згідно з винаходом, в разі необхідності, містять один або кілька асиметричних заміщених атомів вуглецю та тому можуть можуть бути представлені в різних енантіомерних (R- та S-конфігуровані форми) або діастереомерних формах. Винахід стосується як різних можливих окремих енантіомерних або

стереоізомерних форм сполук загальної формули (I), так і сумішей цих стереоізомерних сполук.

Переважні замісниками або переважні області значень замісників вказаних вище та нижче формул наведені нижче.

n означає переважно число 0 або 1.

A означає переважно, в разі необхідності, перерваний O, SO або SO₂ алкандііл або α- або ω-оксаалкандііл, α-, ω-діоксаалкандііл, α- або ω-тіаалкандііл або α-, ω-дитіаалкандііл, що містять відповідно від 1 до 4 атомів вуглецю.

R означає переважно нітро, ціано, карбокси, карбамоїл, тіокарбамоїл, галоген, або відповідно, в разі необхідності, заміщені ціано, гідрокси, галогеном або C₁-C₄-алкокси алкіл, алкокси, алкілтію, алкілсульфініл, алкілсульфоніл, алкіламіно, діалкіламіно або діалкіламіносульфоніл, що містять відповідно від 1 до 4 атомів вуглецю в алкільних групах.

X означає переважно нітро, ціано, карбокси, карбамоїл, локарбамоїл, галоген, або відповідно, в разі необхідності, заміщені ціано, гідрокси, галогеном або C₁-C₄-алкокси алкіл, алкокси, алкілтію, алкілсульфініл, алкілсульфоніл, алкіламіно, діалкіламіно або діалкіламіносульфоніл, що містять відповідно від 1 до 4 атомів вуглецю в алкільних групах.

Y означає переважно 4- - 12-членний, насичений або ненасичений, моно- або біциклічний гетероцикл,

в разі необхідності, заміщений гідрокси, меркапто, ціано, галогеном,

заміщений алкілом, алкілкарбонілом, алкокси, алкоксикарбонілом, алкілтію, алкілсульфінілом або алкілсульфонілом, які відповідно, в разі необхідності, заміщені ціано, галогеном, C₁-C₄-алкокси, C₁-C₄-алкілтію, C₁-C₄-алкілсульфінілом або C₁-C₄-алкілсульфонілом та містять відповідно до 5 атомів вуглецю в алкільних групах,

заміщений алкіламіно або діалкіламіно, які відповідно, в разі необхідності, заміщені галогеном та містять відповідно до 5 атомів вуглецю в алкільних групах,

заміщений алкенілом, алкінілом, алкенілокси, алкенілтію або алкеніламіно, які відповідно, в разі необхідності, заміщені галогеном та містять відповідно до 5 атомів вуглецю в алкенільних або алкінільних групах,

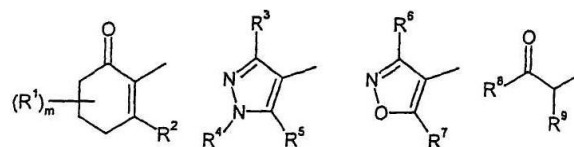
заміщений циклоалкілом, циклоалкілокси, циклоалкілтію, циклоалкіламіно, циклоалкілалкілом, циклоалкілалкокси, циклоалкілалкілтію або циклоалкілалкіламіно, які відповідно, в разі необхідності, заміщені галогеном та/або C₁-C₄-алкілом та містять відповідно від 3 до 6 атомів вуглецю в циклоалкільних групах та, в разі необхідності, від 1 до 4 атомів вуглецю в алкільній частині, або

заміщений фенілом, фенілокси, фенілтію, феніламіно, бензилом, бензилокси, бензилтію або бензиламіно, які відповідно, в разі необхідності, заміщені галогеном, C₁-C₄-алкілом або C₁-C₄-алкокси,

який містить від 1 до 4 атомів азоту та, в разі необхідності, додатково один атом кисню, один атом сірки, SO-групу або SO₂-групу, 1 або 2 оксогрупи (C=O), тіоксо-групи (C=S) або ціаніміно-групи

(C=N-CN) як складові гетероциклу, який приєднаний до A атомом азоту.

Z означає переважно одну з груп



причому

m означає число від 0 до 5,

R¹ означає галоген, відповідно, в разі необхідності, заміщені ціано, гідрокси, галогеном, C₁-C₄-алкокси, C₁-C₄-алкілтію, C₁-C₄-алкілсульфінілом або C₁-C₄-алкілсульфонілом алкіл або алкілтію, що містять відповідно від 1 до 5 атомів вуглецю, або феніл, або - у випадку якщо M означає від 2 до 5 - R¹, в разі необхідності, також разом із другим залишком R¹ означає кисень або алкандііл (алкілен), що містять від 2 до 4 атомів вуглецю,

R² означає гідрокси, формілокси, галоген, відповідно, в разі необхідності, заміщені ціано, гідрокси, галогеном, C₁-C₄-алкокси, C₁-C₄-алкілтію, C₁-C₄-алкілсульфінілом або C₁-C₄-алкілсульфонілом алкокси, алкілтію, алкілсульфініл, алкілсульфоніл, алкілкарбонілокси, алкоксикарбонілокси, алкіламінокарбонілокси, алкілсульфонілокси або алкілсульфоніламіно, що містять відповідно від 1 до 5 атомів вуглецю, відповідно, в разі необхідності, заміщені галогеном алкенілокси або алкінілокси, що містять відповідно від 3 до 6 атомів вуглецю, відповідно, в разі необхідності, заміщені нітро, ціано, галогеном, C₁-C₄-алкілом, C₁-C₄-галогеналкілом, C₁-C₄-алкокси, C₁-C₄-галогеналкокси, C₁-C₄-алкілтію, C₁-C₄-галогеналкілтію, C₁-C₄-алкілсульфінілом, C₁-C₄-галогеналкілсульфінілом, C₁-C₄-алкілсульфонілом або C₁-C₄-галогеналкілсульфонілом арилокси, арилтію, арилсульфініл, арилсульфоніл, арилкарбонілокси, арилкарбонілалкокси, арилсульфонілокси, арилсульфоніламіно, арилалкокси, арилалкілтію, арил алкілсульфініл або арилалкілсульфоніл, що містять відповідно 6 або 10 атомів вуглецю в арильній групі та, в разі необхідності, від 1 до 3 атомів вуглецю в алкільній частині, або групу Y' - причому Y' має вказане вище для Y переважне значення, хоча в окремих випадках і не співпадає з Y,

R³ означає водень, ціано, карбамоїл, тіокарбамоїл, галоген, відповідно, в разі необхідності, заміщені ціано, гідрокси, галогеном, C₁-C₄-алкокси, C₁-C₄-алкілтію, C₁-C₄-алкілсульфінілом або C₁-C₄-алкілсульфонілом алкіл, алкокси, алкілтію, алкілсульфініл, алкілсульфоніл або алкоксикарбоніл, що містять відповідно від 1 до 5 атомів вуглецю в алкільних групах, або, в разі необхідності, заміщений ціано, галогеном або C₁-C₄-алкілом циклоалкіл, що містить від 3 до 6 атомів вуглецю,

R⁴ означає водень, в разі необхідності, заміщений ціано, гідрокси, галогеном, C₁-C₄-алкокси, C₁-C₄-алкілтію, C₁-C₄-алкілсульфінілом алкіл, що містить від 1 до 5 атомів вуглецю, відповідно, в разі необхідності, заміщені ціано або галогеном алкеніл або алкініл, що містять відповідно від 3 до 5 атомів вуглецю, відповідно, в разі необхідності,

заміщені ціано, галогеном або C_1 - C_4 -алкілом циклоалкіл або циклоалкілалкіл, що містять відповідно від 3 до 6 атомів вуглецю в циклоалкіл групі і в разі необхідності, 1 bis 4 атомів вуглецю в алкільній частині, або відповідно, в разі необхідності, заміщені нітро, ціано, галогеном, C_1 - C_4 -алкілом, C_1 - C_4 -галогеналкілом, C_1 - C_4 -алкокси, C_1 - C_4 -галогеналкокси, C_1 - C_4 -алкілтіо, C_1 - C_4 -галогеналкілтіо, C_1 - C_4 -алкілсульфінілом, C_1 - C_4 -галогеналкілсульфінілом, C_1 - C_4 -алкілсульфонілом або C_1 - C_4 -галогеналкілсульфонілом арил або арилалкіл, що містять відповідно 6 або 10 атомів вуглецю в арильній групі та, в разі необхідності, від 1 до 3 атомів вуглецю в алкільній частині,

R^5 означає гідрокси, формілокси, відповідно, в разі необхідності, заміщені ціано, галогеном, C_1 - C_4 -алкокси або C_1 - C_4 -алкоксикарбонілом алкокси, алкілкарбонілокси, алкоксикарбонілокси, алкіламінокарбонілокси або алкілсульфонілокси, що містять відповідно від 1 до 5 атомів вуглецю в алкільних групах, відповідно, в разі необхідності, заміщені ціано або галогеном алкенілокси або алкінілокси, що містять відповідно від 3 до 5 атомів вуглецю, або відповідно, в разі необхідності, заміщені нітро, ціано, галогеном, C_1 - C_4 -алкілом, C_1 - C_4 -галогеналкілом, C_1 - C_4 -алкокси, C_1 - C_4 -галогеналкокси, C_1 - C_4 -алкілтіо, C_1 - C_4 -галогеналкілтіо, C_1 - C_4 -алкілсульфінілом, C_1 - C_4 -галогеналкілсульфінілом, C_1 - C_4 -алкілсульфонілом або C_1 - C_4 -галогеналкілсульфонілом арилалкокси, арилкарбонілокси, арилкарбонілалкокси або арилсульфонілокси, що містять відповідно 6 або 10 атомів вуглецю в арильній групі та, в разі необхідності, від 1 до 3 атомів вуглецю в алкільній частині,

R^6 означає водень, ціано, карбамоїл, тіокарбамоїл, галоген, або відповідно, в разі необхідності, заміщені ціано, галогеном або C_1 - C_4 -алкокси алкіл, алкілкарбоніл, алкокси, алкоксикарбоніл, алкілтіо, алкілсульфініл або алкілсульфоніл, що містять відповідно від 1 до 5 атомів вуглецю,

R^7 означає водень, в разі необхідності, заміщений ціано, галогеном або C_1 - C_4 -алкокси алкіл, що містить від 1 до 5 атомів вуглецю, або, в разі необхідності, заміщений ціано, галогеном або C_1 - C_4 -алкілом циклоалкіл, що містить від 3 до 6 атомів вуглецю, та

R^8 означає водень, в разі необхідності, заміщений ціано, галогеном або C_1 - C_4 -алкокси алкіл, що містить від 1 до 5 атомів вуглецю, або, в разі необхідності, заміщений ціано, галогеном або C_1 - C_4 -алкілом циклоалкіл, що містить від 3 до 6 атомів вуглецю, та

R^9 означає водень, ціано, карбамоїл, галоген, або відповідно, в разі необхідності, заміщені ціано, галогеном або C_1 - C_4 -алкокси алкіл, алкокси, алкоксикарбоніл, алкілтіо, алкілсульфініл або алкілсульфоніл, що містять відповідно від 1 до 5 атомів вуглецю в алкільних групах.

n означає особливо переважно число 0 або 1.

A означає особливо переважно, в разі необхідності, перерваний O, S, SO або SO_2 алкандііл або α - або ω -оксаалкандііл або α - або ω -тіоалкандііл, що містять відповідно 1, 2 або 3 атоми вуглецю.

R означає особливо переважно нітро, ціано, галоген, або відповідно, в разі необхідності, заміщені ціано, галогеном або C_1 - C_3 -алкокси алкіл, алкокси, алкілтіо, алкілсульфініл, алкілсульфоніл, алкіламіно, діалкіламіно або діалкіламіносульфоніл, що містять відповідно від 1 до 3 атомів вуглецю в алкільних групах.

X означає особливо переважно нітро, ціано, галоген, або відповідно, в разі необхідності, заміщені ціано, галогеном або C_1 - C_3 -алкокси алкіл, алкокси, алкілтіо, алкілсульфініл, алкілсульфоніл, алкіламіно, діалкіламіно або діалкіламіносульфоніл, що містять відповідно від 1 до 3 атомів вуглецю в алкільних групах.

Y означає особливо переважно 4- - 12-членний, насичений або ненасичений, моно-або біциклічний гетероцикл, приєднаний до A за допомогою N (атому азоту),

в разі необхідності, заміщений ціано, галогеном,

заміщений алкілом, алкілкарбонілом, алкокси, алкоксикарбонілом, алкілтіо, алкілсульфінілом або алкілсульфонілом, які відповідно, в разі необхідності, заміщені ціано, галогеном, C_1 - C_3 -алкокси, C_1 - C_3 -алкілтіо, C_1 - C_3 -алкілсульфінілом або C_1 - C_3 -алкілсульфонілом та містять відповідно до 4 атомів вуглецю в алкільних групах,

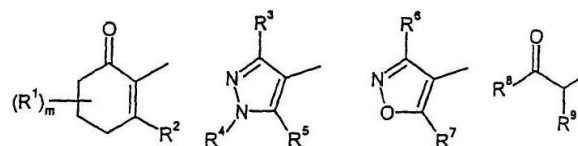
заміщений алкіламіно або діалкіламіно, які відповідно, в разі необхідності, заміщені галогеном та містять відповідно до 4 атомів вуглецю в алкільних групах,

заміщений алкенілом, алкінілом, алкенілокси, алкенілтіо або алкеніламіно, які відповідно, в разі необхідності, заміщені галогеном та містять відповідно до 4 атомів вуглецю в алкенільних або алкінільних групах,

заміщений циклоалкілом, циклоалкілокси, циклоалкілтіо, циклоалкіламіно, циклоалкілалкілом, циклоалкілалкокси, циклоалкілалкілтіо або циклоалкілалкіламіно, які відповідно, в разі необхідності, заміщені галогеном та/або C_1 - C_3 -алкілом та містять відповідно від 3 до 6 атомів вуглецю в циклоалкільних групах та, в разі необхідності, від 1 до 3 атомів вуглецю в алкільній частині, або

заміщений фенілом, фенілокси, фенілтіо, феніламіно, бензилом, бензилокси, бензилтіо або бензиламіно, які відповідно, в разі необхідності, заміщені галогеном, C_1 - C_4 -алкілом або C_1 - C_4 -алкокси,

який містить від 1 до 4 атомів азоту та, в разі необхідності, додатково один атом кисню, один атом сірки, SO-групу або SO_2 -групу, 1 або 2 оксо-групи ($C=O$), тіоксо-групи ($C=S$) або ціаніміно-групи ($C=N-CN$) як складові гетероциклу. Z означає особливо переважно одну з таких груп:



причому
 m означає число від 0 до 4,

R^1 означає галоген, відповідно, в разі необхідності, заміщені ціано, гідрокси, галогеном, C_1 - C_3 -алкокси, C_1 - C_3 -алкілтіо, C_1 - C_3 -алкілсульфінілом або C_1 - C_3 -алкілсульфонілом алкіл або алкілтіо, що містять відповідно від 1 до 4 атомів вуглецю, або феніл, або - у випадку якщо m означає від 2 до 5 - R^1 , в разі необхідності, також разом з іншим залишком R^1 означає кисень або алкандііл (алкілен), що містить 2 або 3 атоми вуглецю,

R^2 означає гідрокси, формілокси, галоген, відповідно, в разі необхідності, заміщені ціано, гідрокси, галогеном, C_1 - C_3 -алкокси, C_1 - C_3 -алкілтіо, C_1 - C_3 -алкілсульфінілом або C_1 - C_3 -алкілсульфонілом алкокси, алкілтіо, алкілсульфініл, алкілсульфоніл, алкілкарбонілокси, алкоксикарбонілокси, алкіламінокарбонілокси, алкілсульфонілокси або алкілсульфоніламіно, що містять відповідно від 1 до 4 атомів вуглецю, відповідно, в разі необхідності, заміщені галогеном алкенілокси або алкінілокси, що містять відповідно від 3 до 5 атомів вуглецю, відповідно, в разі необхідності, заміщені нітро, ціано, галогеном, C_1 - C_3 -алкілом, C_1 - C_3 -галогеналкілом, C_1 - C_3 -алкокси, C_1 - C_3 -галогеналкокси, C_1 - C_3 -алкілтіо, C_1 - C_3 -галогеналкілтіо, C_1 - C_3 -алкілсульфінілом, C_1 - C_3 -галогеналкілсульфінілом, C_1 - C_3 -алкілсульфонілом або C_1 - C_3 -галогеналкілсульфонілом арилокси, арилтіо, арилсульфініл, арилсульфоніл, арилкарбонілокси, арилкарбонілалкокси, арилсульфонілокси, арилсульфоніламіно, арилалкокси, арилалкілтіо, арилалкілсульфініл або арилалкілсульфоніл, що містять відповідно 6 або 10 атомів вуглецю в арильній групі та, в разі необхідності, 1 або 2 атомів вуглецю в алкільній частині, або групу Y' - причому Y' має вказане вище для Y особливо переважне значення, хоча в окремих випадках і не співпадає з Y ,

R^3 означає водень, ціано, карбамоїл, тіокарбамоїл, галоген, відповідно, в разі необхідності, заміщені ціано, гідрокси, галогеном, C_1 - C_3 -алкокси, C_1 - C_3 -алкілтіо, C_1 - C_3 -алкілсульфінілом або C_1 - C_3 -алкілсульфонілом алкіл, алкокси, алкілтіо, алкілсульфініл, алкілсульфоніл або алкоксикарбоніл, що містять відповідно від 1 до 4 атомів вуглецю в алкільних групах, або, в разі необхідності, заміщений ціано, галогеном або C_1 - C_3 -алкілом циклоалкіл, що містить від 3 до 6 атомів вуглецю,

R^4 означає водень, в разі необхідності, заміщений ціано, гідрокси, галогеном, C_1 - C_3 -алкокси, C_1 - C_3 -алкілтіо, C_1 - C_3 -алкілсульфінілом або C_1 - C_3 -алкілсульфонілом алкіл, що містить від 1 до 4 атомів вуглецю, відповідно, в разі необхідності, заміщені ціано або галогеном алкеніл або алкініл, що містять відповідно 3-4 атоми вуглецю, відповідно, в разі необхідності, заміщені ціано, галогеном або C_1 - C_3 -алкілом циклоалкіл або циклоалкілалкіл, що містять відповідно від 3 до 6 атомів вуглецю в циклоалкільній групі та, в разі необхідності, від 1 до 3 атомів вуглецю в алкільній частині, або відповідно, в разі необхідності, заміщені нітро, ціано, галогеном, C_1 - C_3 -алкілом, C_1 - C_3 -галогеналкілом, C_1 - C_3 -алкокси, C_1 - C_3 -галогеналкокси, C_1 - C_3 -алкілтіо, C_1 - C_3 -галогеналкілтіо, C_1 - C_3 -алкілсульфінілом, C_1 - C_3 -галогеналкілсульфінілом, C_1 - C_3 -алкілсульфонілом або C_1 - C_3 -

галогеналкілсульфонілом арил або арилалкіл, що містять відповідно 6 або 10 атомів вуглецю в арильній групі та, в разі необхідності, 1 або 2 атомів вуглецю в алкільній частині,

R^5 означає гідрокси, формілокси, відповідно, в разі необхідності, заміщені ціано, галогеном, C_1 - C_3 -алкокси або C_1 - C_3 -алкоксикарбонілом алкокси, алкілкарбонілокси, алкоксикарбонілокси, алкіламінокарбонілокси або алкілсульфонілокси, що містять відповідно від 1 до 4 атомів вуглецю в алкільних групах, відповідно, в разі необхідності, заміщені ціано або галогеном алкенілокси або алкінілокси, що містять відповідно 3-4 атоми вуглецю, або відповідно, в разі необхідності, заміщені нітро, ціано, галогеном, C_1 - C_3 -алкілом, C_1 - C_3 -галогеналкілом, C_1 - C_3 -алкокси, C_1 - C_3 -галогеналкокси, C_1 - C_3 -алкілтіо, C_1 - C_3 -галогеналкілтіо, C_1 - C_3 -алкілсульфінілом, C_1 - C_3 -галогеналкілсульфінілом, C_1 - C_3 -алкілсульфонілом або C_1 - C_3 -галогеналкілсульфонілом арилалкокси, арилкарбонілокси, арилкарбонілалкокси або арилсульфонілокси, що містять відповідно 6 або 10 атомів вуглецю в арильній групі та, в разі необхідності, 1 або 2 атомів вуглецю в алкільній частині,

R^6 означає водень, ціано, карбамоїл, тіокарбамоїл, галоген, або відповідно, в разі необхідності, заміщені ціано, галогеном або C_1 - C_3 -алкокси алкіл, алкілкарбоніл, алкокси, алкоксикарбоніл; алкілтіо, алкілсульфініл або алкілсульфоніл, що містять відповідно від 1 до 4 атомів вуглецю,

R^7 означає водень, в разі необхідності, заміщений ціано, галогеном або C_1 - C_3 -алкокси алкіл, що містить від 1 до 4 атомів вуглецю, або, в разі необхідності, заміщений ціано, галогеном або C_1 - C_3 -алкілом циклоалкіл, що містить від 3 до 6 атомів вуглецю,

R^8 означає водень, в разі необхідності, заміщений ціано, галогеном або C_1 - C_3 -алкокси алкіл, що містить від 1 до 4 атомів вуглецю, або, в разі необхідності, заміщений ціано, галогеном або C_1 - C_3 -алкілом циклоалкіл, що містить від 3 до 6 атомів вуглецю, та

R^9 означає водень, ціано, карбамоїл, галоген, або відповідно, в разі необхідності, заміщені ціано, галогеном або C_1 - C_3 -алкокси алкіл, алкокси, алкоксикарбоніл, алкілтіо, алкілсульфініл або алкілсульфоніл, що містять відповідно від 1 до 4 атомів вуглецю в алкільних групах.

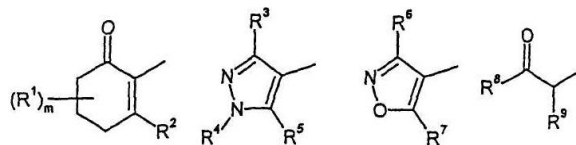
A означає найбільш переважно метилен, етан-1,2-дііл (диметилен), 1-оксаетан-1,2-дііл, 2-оксаетан-1,2-дііл, 1-тіаетан-1,2-дііл, 2-тіаетан-1,2-дііл, пропан-1,2-дііл, пропан-1,3-дііл (триметилен), 1-оксапропан-1,3-дііл, 2-оксапропан-1,3-дііл, 3-оксапропан-1,3-дііл, 1-тіапропан-1,3-дііл або 3-тіапропан-1,3-дііл.

R означає найбільш переважно нітро, ціано, фтор, хлор, бром, відповідно, в разі необхідності, заміщені ціано, фтором, хлором, метокси або етокси метил, етил, метокси або етокси, відповідно, в разі необхідності, заміщені фтором та/або хлором метилтіо, етилтіо, метилсульфініл, етилсульфініл, метилсульфоніл або етилсульфоніл, або метиламіно, етиламіно, диметиламіно або диметиламіносульфоніл.

X означає найбільш переважно нітро, ціано, фтор, хлор, бром, відповідно, в разі необхідності, заміщені ціано, фтором, хлором, метокси або етокси метил, етил, метокси або етокси, відповідно, в разі необхідності, заміщені фтором та/або хлором метилтіо, етилтіо, метилсульфініл, етилсульфініл, метилсульфоніл або етилсульфоніл, або метиламіно, етиламіно, диметиламіно або диметиламіносульфоніл.

Y означає найбільш переважно гетероцикл з ряду піролідиніл, оксопіролідиніл, піроліл, індолил, піразоліл, імідазоліл, імідазолініл, імідазолідиніл, оксоімідазидиніл, 2-оксо-1,3-діазациклопентил, 2-оксо-1,3-діазациклопентеніл, оксазолідиніл, 2-оксо-1,3-оксаза-циклопентил (2-оксооксазолідиніл), 1,2-оксазациклопентил (ізоксазолідиніл), 1,2-оксаза-циклогексил, тіазолідиніл, цанімініотіазолідиніл, оксотриазолініл, тіоксотриазолініл, оксотетразолініл, піперидиніл, оксопіперидиніл, 2-оксо-1,3-діазациклогексил, 2-оксо-1-аза-циклогептил, 2-оксо-1,3-діазациклогептил, морфолініл, піперазиніл, приєднаний до A атомом азоту, в разі необхідності, заміщений ціано, фтором, хлором, бромом, метилом, етилом, н- або і-пропілом, н-, і-, в- або трет.-бутилом, ацетилом, пропіонілом, н-або і-бутироїлом, метокси, етокси, н- або і-пропокси, метоксикарбонілом, етоксикарбонілом, н- або і-пропоксикарбонілом, метилтіо, етилтіо, н- або і-пропілтіо, метилсульфініл, етилсульфініл, метилсульфоніл або етилсульфоніл, відповідно, в разі необхідності, заміщеними ціано, фтором, хлором, бромом, метокси, етокси, метилтіо, етилтіо, метилсульфініл, етилсульфініл, метилсульфоніл або етилсульфоніл, заміщений метиламіно, етиламіно, н- або і-пропіламіно, диметиламіно або діетиламіно, відповідно, в разі необхідності, заміщеними фтором та/або хлор, заміщений етенілом, пропенілом, бутенілом, етинілом, пропінілом, бутенілом, пропенілокси, бутенілокси, пропенілітіо, бутенілітіо, пропеніламіно або бутеніламіно, відповідно, в разі необхідності, заміщеними фтором, хлором та/або бромом, заміщений циклопропілом, циклобутилом, циклопентилом, циклогексилом, циклопропілокси, циклобутилокси, циклопентилокси, циклогексилокси, циклопропілітіо, циклобутилтіо, циклопентилтіо, циклогексилтіо, циклопропіламіно, циклобутиламіно, циклопентиламіно, циклогексиламіно, циклопропілметилом, циклобутилметилом, циклопентилметилом, циклогексилметилом, циклопропілметокси, циклобутилметокси, циклопентилметокси, циклогексилметокси, циклопропілметилтіо, циклобутилметилтіо, циклопентилметилтіо, циклогексилметилтіо, циклопропілметиламіно, циклобутилметиламіно, циклопентилметиламіно або циклогексилметиламіно, відповідно, в разі необхідності, заміщеними фтором, хлором, метилом або етилом, або заміщений фенілом, фенілокси, фенілтіо, феніламіно, бензилом, бензилокси, бензилтіо або бензиламіно, відповідно, в разі необхідності, заміщеними фтором, хлором, бромом, метилом, етилом, н- або і-пропілом, н-, і-, в- або трет.-бутилом, метокси, етокси, н- або і-пропокси.

Z означає найбільш переважно одну з таких груп



причому

m означає число від 0 до 3,

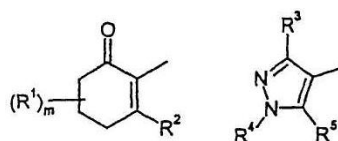
R¹ означає фтор, хлор, бром, відповідно, в разі необхідності, заміщені ціано, фтором, хлором, бромом, метокси, етокси, метилтіо, етилтіо, метилсульфініл, етилсульфініл, метилсульфоніл або етилсульфоніл метил, етил, н- або і-пропіл, метилтіо, етилтіо, н- або і-пропілтіо, або феніл, або - у випадку якщо m означає 2 - 3 - R¹, в разі необхідності, також разом з іншим залишком R¹ означає кисень, метилен або диметилен (етан-1,2-діл),

R² означає гідрокси, хлор, відповідно, в разі необхідності, заміщені фтором, хлором, метокси, етокси, метилтіо, етилтіо, метилсульфініл, етилсульфініл, метилсульфоніл або етилсульфоніл метокси, етокси, н- або і-пропокси, метилтіо, етилтіо, н- або і-пропілтіо, метилсульфініл, етилсульфініл, метилсульфоніл, етилсульфоніл, ацетилокси, пропінілокси, н- або і-бутироїлокси, метоксикарбонілокси, етоксикарбонілокси, н- або і-пропоксикарбонілокси, метоксикарбонілокси, етоксикарбонілокси, метиламінокарбонілокси, етиламінокарбонілокси, метилсульфонілокси, етилсульфонілокси, метилсульфоніламіно або етилсульфоніламіно, відповідно, в разі необхідності, заміщені фтором, хлором та/або бромом пропенілокси, бутенілокси, пропінілокси, бутенілокси, відповідно, в разі необхідності, заміщені нітро, ціано, фтором, хлором, бромом, метилом, етилом, н- або і-пропілом, дифторметилом, трифторметилом, хлордифторметил, метокси, етокси, н- або і-пропокси, дифторметокси, трифторметокси, метилтіо, етилтіо, н- або і-пропілтіо, дифторметилтіо, трифторметилтіо, метилсульфініл, етилсульфініл, трифторметилсульфініл, метилсульфоніл, етилсульфоніл, трифторметилсульфоніл, метилсульфоніл, фенілтіо, фенілсульфініл, фенілсульфоніл, фенілкарбонілокси, фенілкарбонілметокси, фенілсульфонілокси, фенілсульфоніламіно, фенілметокси, фенілметилтіо, фенілметилсульфініл або фенілметилсульфоніл,

R³ означає водень, ціано, фтор, хлор, бром, відповідно, в разі необхідності, заміщені ціано, фтором, хлором, метокси, етокси, н- або і-пропокси, метилтіо, етилтіо, н-або і-пропілтіо, метилсульфініл, етилсульфініл, метилсульфоніл або етилсульфоніл метил, етил, н- або і-пропіл, метокси, етокси, н- або і-пропокси, метилтіо, етилтіо, н- або і-пропілтіо, метилсульфініл, етилсульфініл, метилсульфоніл, етилсульфоніл, метоксикарбоніл, етоксикарбоніл, н- або і-пропоксикарбоніл, або відповідно, в разі необхідності, заміщені ціано, фтором, хлором, бромом, метилом, етилом, н- або і-пропілом циклопропіл, циклобутил, циклопентил або циклогексил,

R⁸ означає водень, відповідно, в разі необхідності, заміщені ціано, фтором, хлором, метокси, етокси, n- або i-пропокси метил, етил, n- або i-

п, А, Х та Y мають вказані вище значення та Z означає одну з таких груп



R^3 означає водень, відповідно, в разі необхідності, заміщені фтором, хлором, метокси, етокси, метилтіо, етилтіо, метилсульфінілом, етилсульфінілом, метилсульфонілом або етилсульфонілом метил або етил, метокси, етокси, метилтіо, етилтіо, метилсульфініл, етилсульфініл, метилсульфо-

ніл, етилсульфоніл, метоксикарбоніл, етоксикарбоніл, н- або і-пропоксикарбоніл, або циклопропіл,

R^4 означає метил, етил, н- або і-пропіл,

R^5 означає гідрокси, відповідно, в разі необхідності, заміщені фтором, хлором, метокси, етокси, н- або і-пропокси, метоксикарбонілом, етоксикарбонілом, н- або і-пропоксикарбонілом метокси, етокси, н- або і-пропокси, ацетилокси, пропіонілокси, н- або і-бутироїлокси, метоксикарбонілокси, етоксикарбонілокси, н- або і-пропоксикарбонілокси, метиламінокарбонілокси, етиламінокарбонілокси, н- або і-пропіламінокарбонілокси, метилсульфонілокси, етилсульфонілокси, н- або і-пропілсульфонілокси, відповідно, в разі необхідності, заміщені фтором, хлором або бромом пропенілокси, бутенілокси, пропінілокси або бутинілокси, або відповідно, в разі необхідності, заміщені нітро, ціано, фтором, хлором, бромом, метилом, етилом, н- або і-пропілом, трифторметилом, метокси, етокси, н- або і-пропокси, дифторметокси, трифторметокси, метилтію, етилтію, н- або і-пропілтію, трифторметилтію, метилсульфінілом, етилсульфінілом, трифторметилсульфінілом, метилсульфонілом, етилсульфонілом або трифторметилсульфонілом фенілметокси, фенілкарбонілокси, фенілкарбонілметокси або фенілсульфонілокси.

Крім того абсолютну перевагу надають сполукам формули (I), в яких

п, R, A, X та Z мають вказані вище значення та Y означає 4- - 12-членний насичений або ненасичений, моно- або біциклічний гетероцикл,

в разі необхідності, заміщений гідрокси, меркапто, ціано, галогеном,

заміщений алкілом, алкілкарбонілом, алкокси, алкоксикарбонілом, алкілтію, алкілсульфінілом або алкілсульфонілом, які відповідно, в разі необхідності, заміщений ціано, галогеном, C_1 - C_4 -алкокси, C_1 - C_4 -алкілтію, C_1 - C_4 -алкілсульфінілом або C_1 - C_4 -алкілсульфонілом та відповідно містять від 1 до 6 атомів вуглецю в алкільних групах,

заміщений алкіламіно або діалкіламіно, які відповідно, в разі необхідності, заміщені галогеном та містять відповідно від 1 до 6 атомів вуглецю в алкільних групах,

заміщений алкенілом, алкінілом, алкенілокси, алкенілію або алкеніламіно, які відповідно, в разі необхідності, заміщені галогеном та містять відповідно від 1 до 6 атомів вуглецю в алкенільних або алкінільних групах,

заміщений циклоалкілом, циклоалкілокси, циклоалкілтію, циклоалкіламіно, циклоалкілалкілом, циклоалкілалкокси, циклоалкілалкілтію або циклоалкілалкіламіно, які відповідно, в разі необхідності, заміщені галогеном та/або C_1 - C_4 -алкілом та містять відповідно від 3 до 6 атомів вуглецю в циклоалкільних групах та, в разі необхідності, від 1 до 4 атомів вуглецю в алкільній частині, або

заміщений фенілом, фенілокси, фенілтію, феніламіно, бензилом, бензилокси, бензилтію або бензиламіно, які відповідно, в разі необхідності, заміщені галогеном, C_1 - C_4 -алкілом або C_1 - C_4 -алкокси,

який містить від 1 до 3 атомів азоту, одну оксогрупу та, в разі необхідності, додатково один атом

кисню, атом сірки, одну SO-групу або SO_2 -групу, 1 або 2 оксо-групи ($C=O$), 1 або 2 тіоксо-групи ($C=S$) або від 1 до 3 ціаніміно-груп ($C=N-CN$) як компоненти гетеро циклу та приєднаний до A атомом азоту.

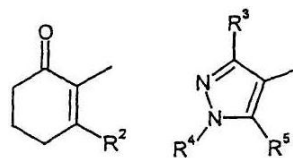
Абсолютну перевагу надають також сполукам формули (I), в яких

п означає число 0,

A означає метилен,

X означає хлор, ціано, метокси, метилсульфоніл або трифторметил, Y означає відповідно, в разі необхідності, заміщені метилом, етилом, н- або і-пропілом, н-, і-, в- або трет.-бутилом 2-оксо-1,3-діазациклопентил або 2-оксо-1,3-діазациклогексил або, в разі необхідності, заміщений метилом, етилом, метокси, етокси, метилтію або етилтію оксотриазолініл або оксотетразолініл, та

Z означає одну з таких груп



причому

R^2 означає гідрокси, відповідно, в разі необхідності, заміщені фтором, хлором, метокси, етокси, н- або і-пропокси, метилтію, етилтію, н- або і-пропілтію, метилсульфінілом, етилсульфінілом, метилсульфонілом або етилсульфонілом метокси, етокси, н- або і-пропокси, метилтію, етилтію, н- або і-пропілтію, ацетилокси, пропіонілокси, н- або і-бутироїлокси, метоксикарбонілокси, етоксикарбонілокси, н- або і-пропоксикарбонілокси, метоксикарбонілокси, етоксикарбонілокси, метиламінокарбонілокси, етиламінокарбонілокси, метилсульфонілокси, етилсульфонілокси, метилсульфоніламіно або етилсульфоніламіно, відповідно, в разі необхідності, заміщені фтором та/або хлором пропенілокси, бутенілокси, пропінілокси, бутинілокси, відповідно, в разі необхідності, заміщені нітро, ціано, фтором, хлором, бромом, метилом, етилом, н- або і-пропілом, трифторметилом, метокси, етокси, дифторметокси, трифторметокси, метилтію, етилтію, трифторметилтію, метилсульфініл, етилсульфінілом, трифторметилсульфінілом, метилсульфонілом, етилсульфонілом, трифторметилсульфонілом фенілокси, фенілтію, фенілкарбонілокси, фенілкарбонілметокси, фенілсульфонілокси, фенілсульфоніламіно, фенілметокси, фенілметилтію,

R^3 означає водень, відповідно, в разі необхідності, заміщені фтором, хлором, метокси, етокси, метилтію, етилтію, метилсульфінілом, етилсульфінілом, метилсульфонілом або етилсульфонілом метил або етил, метокси, етокси, метилтію, етилтію, метилсульфініл, етилсульфініл, метилсульфоніл, етилсульфоніл, метоксикарбоніл, етоксикарбоніл, н- або і-пропоксикарбоніл, або циклопропіл,

R^4 означає метил, етил, н- або і-пропіл,

R^5 означає гідрокси, відповідно, в разі необхідності, заміщені фтором, хлором, метокси, еток-

си, н- або і-пропокси, метоксикарбонілом, етокси-карбонілом, н- або і-пропоксикарбонілом метокси, етокси, н- або і-пропокси, або ацетилокси, пропіо-нілокси, н-або і-бутироїлокси, метоксикарбонілокси, етоксикарбонілокси, н- або і-пропоксикарбонілокси, метиламінокарбонілокси, етиламінокарбонілокси, н- або і-пропіламінокарбонілокси, метилсульфонілокси, етилсульфонілокси, н- або і-пропілсульфонілокси, відповідно, в разі необхідності, заміщені фтором, хлором або бромом пропенілокси, бутенілокси, пропінілокси або бутинілокси, або відповідно, в разі необхідності, заміщені нітро, ціано, фтором, хлором, бромом, метилом, етилом, н- або і-пропілом, трифторметилом, метокси, етокси, н- або і-пропокси, дифторметокси, трифторметокси, метилтіо, етилтіо, н- або і-пропілтіо, трифтормети-літо, метилсульфінілом, етилсульфінілом, три-фторметилсульфінілом, метилсульфонілом, етил-сульфонілом або трифторметилсульфонілом фенілметокси, фенілкарбонілокси, фенілкарбоніл-метокси або фенілсульфонілокси.

Згідно з винаходом перевагу надають сполу-кам формули (I), в якій вказані вище комбінації мають переважні значення.

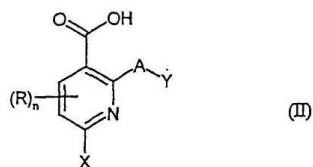
Згідно з винаходом особливу перевагу нада-ють сполукам формули (I), в якій вказані вище комбінації мають особливо переважні значення.

Згідно з винаходом найбільшу перевагу нада-ють сполукам формули (I), в якій вказані вище комбінації мають найбільш переважні значення.

Вказані вище загальні або переважні визна-чення залишків стосуються як кінцевих продуктів формули (I), так і необхідних для їх одержання вихідних або проміжних продуктів. Ці визначення залишків в будь-якій послідовності можна комбіну-вати між собою, а також із вказаними вище пере-важними областями значень. Крім того окремі ви-значення можуть випадати.

Нові заміщені піридилкетони формули (I) відрі-зняються сильною селективною гербіцидною акти-вністю.

Нові заміщені піридилкетони формули (I) оде-ржують шляхом взаємодії заміщених піридинкар-бонових кислот загальної формули (II)



в якій

п, А, R, X та Y мають вказані вище значення,

- або їх реакційноздатних похідних, таких як, наприклад, відповідні галогеніди кислоти, ціаніди кислоти або естери -

зі сполуками загальної формули(III)

H-Z (III)

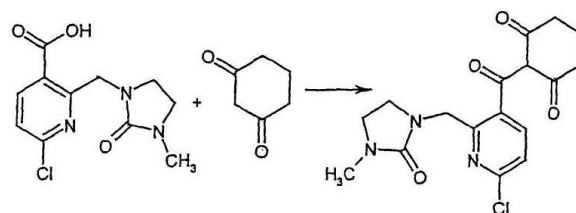
в якій

Z має вказане вище значення,

в разі необхідності, в присутності засобу дегід-ратації, а також, в разі необхідності, в присутності одного або кількох агентів, що допомагають здійс-ненню реакції та, в разі необхідності, в присутності одного або кількох розріджувачів,

та, в разі необхідності, після здійснення спо-собу згідно з винаходом одержані таким чином сполуки загальної формули (I) в рамках визначен-ня замісників піддають подальшій взаємодії (на-приклад, заміщенню, окисленню або відновленню) до одержання інших сполук загальної формули (I) звичайними методами.

Якщо як вихідні речовини застосовують, на-приклад, 6-хлор-2-(3-метил-2-оксо-імідазолідин-1-ілметил)нікотинову кислоту та циклогексан-1,3-діон, то здійснення реакції згідно з винаходом де-монструє наведена нижче схема:



Заміщені піридинкарбонові кислоти, які як ви-хідні речовини застосовують для одержання спо-лук загальної формули (I), визначаються загаль-ною формулою (II). У формулі (II) п, А, R, X та Y мають переважно значення, вказані вище при опи-сі сполук загальної формули (I) та визначені як переважні, особливо переважні, найбільш перева-жні або абсолютно переважні для п, А, R, X та Y. Вихідні речовини формули (II) не відомі з літера-турних джерел та як нові речовини є об'єктом да-ного винаходу.

Сполуки, які також застосовують як вихідні ре-човини у способі одержання сполук загальної фо-рмули (I) згідно з винаходом, визначаються загаль-ною формулою (III). У формулі (III) Z переважно має значення, вказані вище при описі сполук загаль-ної формули (I) та визначені як переважні, особ-ливо переважні, найбільш переважні або абсолю-тно переважні для Z.

Вихідні сполуки загальної формули (III) є відо-мими органічними продуктами синтезу.

Спосіб для одержання сполук формули (I) згі-дно з винаходом здійснюють переважно із засто-суванням одного або кількох агентів, що допома-гають здійсненню реакції. Як агенти, що допомагають здійсненню реакції, застосовують в основному звичайні неорганічні або органічні ос-нови або акцептори кислоти. До них належать пе-реважно ацетати, аміді, карбонати, гідрокарбона-ти, гідриди, гідроксиди або алканолати лужних або лужноземельних металів, так як, наприклад, аце-тат натрію, калію або кальцію, амід літію, натрію, калію або кальцію, карбонат натрію, калію або кальцію, гідрокарбонат натрію, калію або кальцію, гідрид літію, натрію, калію або кальцію, гідроксид літію, натрію, калію або кальцію, метанолат, ета-нолат, н- або і-пропанолат, н-, і-, в- або трет.-бутанолат натрію або калію, а також основні орга-нічні сполуки азоту, такі як, наприклад, тримети-

ламін, триетиламін, трипропіламін, трибутиламін, етилдіізопропіламін, N,N-диметилциклогексиламін, дициклогексиламін, етилдициклогексиламін, N,N-диметиланілін, N,N-диметилбензиламін, піридин, 2-метил-, 3-метил-, 4-метил-, 2,4-диметил-, 2,6-диметил-, 3,4-диметил- та 3,5-диметилпіридин, 5-етил-2-метилпіридин, 4-диметиламінопіридин, N-метилпіперидин, N-етилпіперидин, N-метилморфолін, N-етилморфолін, 1,4-діазабіцикло[2.2.2]-октан (DABCO), 1,5-діазабіцикло[4.3.0]-нон-5-ен (DBN) або 1,8-діазабіцикло[5.4.0]-ундец-7-ен (DBU).

Спосіб для одержання сполук формули (I) згідно з винаходом здійснюють, в разі необхідності, із застосуванням агентів дегідратациї. При цьому можуть бути застосовані придатні для зв'язування води хімічні речовини. Прикладами таких агентів є дициклогексилкарбодіїмід, карбоніл-біс-імідазол та ангідрид пропанфосфонової кислоти, переважно дициклогексилкарбодіїмід та ангідрид пропанфосфонової кислоти.

Спосіб одержання сполук загальної формули (I) згідно з винаходом здійснюють переважно в присутності одного або кількох розріджувачів. Як розріджувачі застосовують передусім інертні органічні розчинники. До них належать зокрема аліфатичні, аlicиклічні або ароматичні, в разі необхідності, галогеновані вуглеводні, такі як, наприклад, бензин, бензол, толуол, ксилол, хлорбензол, дихлорбензол, петролейний етер, гексан, циклогексан, дихлорметан, хлороформ, тетрахлорвуглець; етери, такі як діетиловий етер, діізопропіловий етер, діоксан, тетрагідрофуран або диметиловий або діетиловий етер етиленгліколю; кетони, такі як ацетон, бутанон або метилізобутиловий кетон; нітрили, такі як ацетонітрил, пропіонітрил або бутіронітрил; аміді, такі як N,N-диметилформамід, N,N-диметилацетамід, N-метилформанілід, N-метилпіролідон або триамід гексаметилфосфорної кислоти; естери, такі як метиловий естер оцтової кислоти або етиловий естер оцтової кислоти, сульфоксиди, такі як диметилсульфоксид.

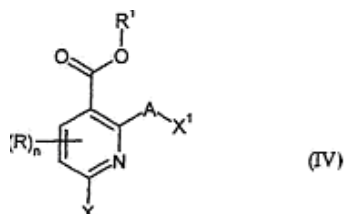
Реакційні температури при здійсненні способу одержання сполук формули (I) згідно з винаходом можна варіювати у широкому діапазоні. Загалом працюють при температурі від 0 °C до 150°C, переважно від 10°C до 120°C.

Спосіб одержання сполук формули (I) згідно з винаходом загалом здійснюють при нормальному тиску. Хоча можливо також здійснювати спосіб згідно з винаходом при підвищеному або пониженому тиску - загалом від 0,1 бар до 10 бар.

Для здійснення способу одержання сполук формули (I) згідно з винаходом вихідні речовини загалом застосовують у приблизних еквімолярних кількостях. Хоча один із компонентів можна також застосовувати у надлишку. Взаємодію здійснюють загалом у придатному розріджувачі в присутності агента, що допомагає здійсненню реакції, а реакційну суміш кілька годин перемішують при необхідній температурі. Обробка відбувається звичайними способами (див. приклади одержання).

Нові заміщені піридинкарбонові кислоти загальної формули (II) на першій стадії одержують

шляхом взаємодії заміщених естерів піридинкарбонових кислот загальної формули (IV)



в якій

n, A, R та X мають вказані вище значення, R¹ означає алкіл (зокрема метил, етил, n- або і-пропіл, n-, і-, в- або трет.-бутил) або арилалкіл (зокрема бензил) та

X¹ означає галоген (зокрема хлор або бром), зі сполуками загальної формули (V)

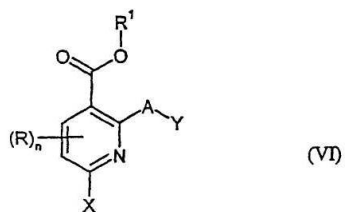
M-Y (V)

в якій

Y має вказане вище значення та

M означає водень або еквівалент металу (зокрема літій, натрій або калій),

в разі необхідності, в присутності одного або кількох агентів, що допомагають здійсненню реакції та, в разі необхідності, в присутності одного або кількох розріджувачів, та одержані таким способом естери карбонових кислот загальної формули (VI)



на другій стадії звичайними методами перетворюють на карбонові кислоти формули (II).

Заміщені естери піридинкарбонових кислот, які як вихідні речовини застосовують для одержання сполук загальної формули (II), визначаються загальною формулою (IV). У формулі (IV) n, A, R, X мають переважно значення, вказані вище при описі сполук загальної формули (I) та визначені як переважні, особливо переважні, найбільш переважні або абсолютно переважні для n, A, R, X.

Сполуки, які також застосовують як вихідні речовини у способі одержання сполук загальної формули (II) згідно з винаходом, визначаються загальною формулою (V). У формулі (V) Y переважно має значення, вказані вище при описі сполук загальної формули (I) та визначені як переважні, особливо переважні, найбільш переважні або абсолютно переважні для Y. Вихідні речовини формули (V) є відомими органічними продуктами синтезу.

Спосіб одержання сполук формули (II) згідно з винаходом здійснюють переважно із застосуванням одного або кількох агентів, що допомагають здійсненню реакції. Як агенти, що допомагають здійсненню реакції, застосовують в основному звичайні неорганічні або органічні основи або ак-

цептори кислоти. До них належать переважно ацетати, аміди, карбонати, гідрокарбонати, гідриди, гідроксиди або алканолати лужних або лужноземельних металів, так як, наприклад, ацетат натрію, калію або кальцію, амід літію, натрію, калію або кальцію, карбонат натрію, калію або кальцію, гідрокарбонат натрію, калію або кальцію, гідрид літію, натрію, калію або кальцію, гідроксид літію, натрію, калію або кальцію, метанолат, етанолат, н- або і-пропанолат, н-, і-, в- або трет.-бутанолат натрію або калію, а також основні органічні сполуки азоту, такі як, наприклад, триметиламін, триетиламін, трипропіламін, трибутиламін, етилдїізопропіламін, N,N-диметилциклогексиламін, дициклогексиламін, етилдициклогексиламін, N,N-диметиланілін, N,N-диметилбензиламін, піридин, 2-метил-, 3-метил-, 4-метил-, 2,4-диметил-, 2,6-диметил-, 3,4-диметил- та 3,5-диметилпіридин, 5-етил-2-метилпіридин, 4-диметиламінопіридин, N-метилпіридин, N-етилпіридин, N-метилморфолін, N-етилморфолін, 1,4-діазабіцикло[2.2.2]-октан (DABCO), 1,5-діазабіцикло[4.3.0]-нон-5-ен (DBN) або 1,8-діазабіцикло[5.4.0]-ундец-7-ен (DBU). Перевагу надають гідриду натрію, карбонату калію та триетиламіну.

Спосіб одержання сполук загальної формули (II) згідно з винаходом здійснюють переважно в присутності одного або кількох розріджувачів. Як розріджувачі застосовують передусім інертні органічні розчинники. До них належать зокрема аліфатичні, аліциклічні або ароматичні, в разі необхідності, галогеновані вуглеводні, такі як, наприклад, бензин, бензол, толуол, ксилол, хлорбензол, дихлорбензол, петролейний етер, гексан, циклогексан, дихлорметан, хлороформ, тетрахлорвуглець; етери, такі як діетиловий етер, діізопропіловий етер, діоксан, тетрагідрофуран (THF) або диметиловий або діетиловий етер етиленгліколю; кетони, такі як ацетон, бутанон або метилізобутиловий кетон; нітрили, такі як ацетонітрил, пропіонітрил або бутіронітрил; аміди, такі як N,N-диметилформамід (DMF), N,N-диметилацетамід, N-метилформанілід, N-метилпіролідон або триамід гексаметилфосфornoї кислоти; естери, такі як метиловий естер оцтової кислоти або етиловий естер оцтової кислоти, сульфоксиди, такі як диметилсульфоксид. Перевагу надають ацетонітрилу, THF та DMF. Як розріджувачі на другій стадії застосовують передусім інертні органічні розчинники та їх водні суміші. До них належать зокрема аліфатичні, аліциклічні або ароматичні, в разі необхідності, галогеновані вуглеводні, такі як, наприклад, бензин, бензол, толуол, ксилол, хлорбензол, дихлорбензол, петролейний етер, гексан, циклогексан, дихлорметан, хлороформ, тетрахлорвуглець; етери, такі як діетиловий етер, діізопропіловий етер, діоксан, тетрагідрофуран (THF) або диметиловий або діетиловий етер етиленгліколю; кетони, такі як ацетон, бутанон або метилізобутиловий кетон; нітрили, такі як ацетонітрил, пропіонітрил або бутіронітрил; аміди, такі як N,N-диметилформамід (DMF), N,N-диметилацетамід, N-метилформанілід, N-метилпіролідон або триамід гексаметилфосфornoї кислоти; естери, такі як метиловий естер оц-

тової кислоти або етиловий естер оцтової кислоти, сульфоксиди, такі як диметилсульфоксид. Перевагу надають THF та сумішам із THF та води.

Реакційні температури при здійсненні способу одержання сполук формули (II) згідно з винаходом можна варіювати у широкому діапазоні. Загалом працюють при температурі від 0°C до 150°C, переважно від 10°C до 120°C, особливо переважно від 20°C до температури кипіння застосовуваного розріджувача.

Спосіб одержання сполук формули (II) згідно з винаходом загалом здійснюють при нормальному тиску. Хоча можливо також здійснювати спосіб згідно з винаходом при підвищеному або пониженому тиску - загалом від 0,1бар до 10бар.

Для здійснення способу згідно з винаходом вихідні речовини загалом застосовують у приблизних еквімолярних кількостях. Хоча один із компонентів можна також застосовувати у надлишку. Взаємодію здійснюють загалом у придатному розріджувачі в присутності агента, що допомагає здійсненню реакції, а реакційну суміш кілька годин перемішують при необхідній температурі. Обробка відбувається звичайними способами, наприклад, шляхом фільтрування, кристалізації або хроматографії (див. приклади одержання).

Сполуки формули (VI) можна піддавати взаємодії або безпосередньо ("in situ") до одержання сполук формули (II) або ізолювати перед наступною взаємодією.

Активні речовини згідно з винаходом можуть бути застосовані як дефоліанти, десиканти, засоби знищення трави та, зокрема, як засоби боротьби з бур'янами. Під бур'янами в широкому сенсі слід розуміти всі рослини, що ростуть в місцях, де вони є небажаними. Активність речовин згідно з винаходом як гербіцидів повної дії або селективних гербіцидів залежить в основному від застосовуваної кількості.

Активні речовини згідно з винаходом можна застосовувати, наприклад, у боротьбі з такими рослинами:

Дводольні бур'яни родів: *Abutilon* (абутилон), *Amaranthus* (амарант), *Ambrosia* (амброзія), *Anoda*, *Anthemis* (пунавка), *Aphanes*, *Atriplex* (лобода), *Bellis* (маргаритка), *Bidens* (черега), *Capsella* (вівчарська сумка), *Carduus* (будяк), *Cassia* (касія), *Centaurea* (волошка), *Chenopodium* (марь), *Cirsium* (бодяк), *Convolvulus* (в'юнок), *Datura* (дурман), *Desmodium*, *Emex*, *Erysimum* (жовтушник), *Euphorbia* (молочай), *Galeopsis*, *Galinsoga* (галінзоба), *Galium* (подмареник), *Hibiscus* (гібіскус), *Ipomoea* (іпомея), *Kochia* (кохія), *Lamium* (яснотка), *Lepidium* (блошечник), *Lindernia*, *Matricaria* (матрикарія), *Mentha* (м'ята), *Mercurialis* (пролесник), *Mullugo*, *Myosotis* (незабудка), *Paraver* (мак), *Pharbitis*, *Plantago* (подорожник), *Polygonum* (горець), *Portulaca* (портулак), *Ranunculus* (жовтець), *Raphanus* (редька), *Rorippa*, *Rotala*, *Rumex* (щавель), *Salsola* (солянка), *Senecio* (крестовник), *Sesbania* (сесбанія), *Sida* (сида), *Sinapis* (гірчиця), *Solanum* (паслен), *Sonchus* (осот), *Sphenoclea*, *Stellaria* (звездчатка), *Taraxacum* (кульбаба), *Thlaspi*, *Trifolium* (конюшина), *Urtica* (кропива),

Veronica (вероніка), Viola (фіалка), Xanthium (дурнишник).

Дводольні культурні рослини родів: Arachis (арахіс), Beta (буряк), Brassica (капуста), Cucumis (огірок), Cucurbita (гарбуз), Helianthus (соняшник), Daucus (морква), Glycine (соє), Gossypium (бавовник), Ipomoea (іпомея), Lactuca (латук), Linum (льон), Lycopersicon (томат), Nicotiana (тютюн), Phaseolus (квасоля), Pisum (горох), Solanum (паслен), Vicia (вика).

Однодольні бур'яни родів: Aegilops (ерілопс), Agropyron (житняк), Agrostis (мітлиця), Alopecurus (лисохвіст), Apera, Avena (овес), Brachiaria, Bromus (багаття), Cenchrus, Commelina (комеліна), Cyperus (сиріт), Dactyloctenium, Digitaria (росичка), Echinochloa (єжовник), Eleocharis (болотниця), Eleusine (елевсіна), Eragrostis (полевичка), Eriochloa, Festuca (овсяниця), Fimbristylis, Heteranthera, Imperata, Ischaemum, Leptochloa, Lolium (плевел), Monochoria, Panicum (просо), Paspalum (гречка), Phalaris (канареечник), Phleum (тимопіївка), Poa (мятлик), Rottboellia, Sagittaria (стрелолист), Scirpus (очерет), Setaria (щетинник), Sorghum (сорого).

Однодольні культурні рослини родів: Allium (цибуля), Ananas (ананас), Asparagus (спаржа), Avena (овес), Hordeum (ячмін), Oryza (рис), Panicum (просо), Saccharum (цукровий очерет), Secale (жито), Sorghum (сорого), Triticale (тритикале), Triticum (пшениця), Zea (кукурудза).

Однак, застосування активних речовин згідно з винаходом не обмежується цими родами, а поширюється і на інші рослини.

Запропоновані згідно з винаходом активні речовини в залежності від концентрації є придатними для повного знищення бур'янів, наприклад, на промисловому устаткуванні та рейкових шляхах, на дорогах та площах з ростом або без росту дерев. Також можливе застосування запропонованих згідно з винаходом активних речовин для боротьби з бур'янами в багаторічних культурах, наприклад, при посадці деревних, декоративних, плодових, винних, цитрусових, горіхових, бананових, кавових, чайних, каучукових, олійно-пальмових, какао, фруктових-ягідних та хмелевих культур, на декоративних газонах та спортивних площадках, на пасовищах, а також для селективної боротьби з бур'янами в однолітніх культурах.

Запропоновані згідно з винаходом сполуки формули (I) проявляють сильну гербіцидну активність та мають широкий спектр дії при обробці ґрунту та зелених частин рослин над поверхнею землі. Вони також є найбільш придатними для селективної боротьби з однодольними та дводольними бур'янами в однодольних та дводольних культурах, при обробці як перед сходженням, так і після сходження рослин.

Запропоновані згідно з винаходом активні речовини у визначеній концентрації або нормі витрати також можуть бути застосовані для боротьби з тваринними шкідниками та грибовими або бактеріальними захворюваннями рослин. Вони, в разі необхідності, також можуть бути застосовані як

проміжні або первинні продукти для синтезу інших активних речовин.

Згідно з винаходом можна обробляти всі рослини або частини рослин. Під рослинами при цьому розуміють всі рослини та популяції рослин, як бажані і небажані дикоростучі рослини або культурні рослини (включаючи, культурні рослини природного походження). Культурними рослинами можуть бути рослини, які можна одержати звичайними методами культивування та оптимізації або біотехнологічними та генно-інженерними методами або комбінацією цих методів, включаючи трансгенні рослини та сорти рослин, що захищаються або не захищаються законом про охорону нових сортів рослин. Під частинами рослин потрібно розуміти всі надземні та підземні частини та органи рослин, такі як парост, лист, квітка та корінь, причому слід назвати, наприклад, листи, голки, стебла, стовбури, квіти, плодові тіла, плоди та насіння, а також корені, бульби та ризоми. До частин рослин належить також зібраний врожай та вегетативний і генеративний матеріал для розмноження, наприклад, черешки, бульби, ризоми, відводки та насіння.

Згідно з винаходом обробку рослин та частин рослин за допомогою активних речовин здійснюють безпосередньо або шляхом впливу на їх оточення, середовище їх росту або закрите сховище відповідно до звичайних методів обробки, наприклад, шляхом занурення, мілкокрапельного обприскування, випару, створення штучного туману, розкидання, намазування, а у випадку матеріалу для розмноження, особливо у випадку насіння, шляхом одношарового або багатшарового покриття.

Активні речовини можуть бути перетворені в звичайні препаративні форми, такі як розчини, емульсії, порошки, що змочуються, суспензії, порошки, дисти для запилення, пасти, розчинні порошки, грануляти, концентрати емульсій та суспензій, природні та синтетичні речовини, просочені активною речовиною, а також мікрокапсульовані в полімерні речовини.

Зазначені препаративні форми одержують відомим способом, наприклад, змішуванням активних речовин з розріджувачами, наприклад, рідкими розчинниками та/або твердими носіями, в разі необхідності, з використанням поверхнево-активних речовин, наприклад, емульгаторів та/або диспергаторів та/або піноутворювачів.

У випадку використання води як розріджувача можуть, наприклад, використовуватися і органічні розчинники як допоміжні засоби, що поліпшують розчинення. Як рідкі розчинники по суті мають на увазі: ароматичні сполуки, такі як ксиліл, толуол або алкілнафталіни, хлоровані ароматичні сполуки та хлоровані аліфатичні вуглеводні, такі як хлорбензоли, хлоретилени або метиленхлорид, аліфатичні вуглеводні, такі як циклогексан або парафіни, наприклад, фракції нафти, мінеральні масла та рослинні олії, спирти, такі як бутанол або гліколь, а також їх естери та етери, кетони, такі як ацетон, метилетилкетон, метилізобутилкетон або циклогексанон, сильнополярні розчинники, такі як диметилформамід та диметилсульфоксид, а також воду.

Як тверді носії мають на увазі: наприклад, солі амонію та помели природних каменів, таких як каоліни, глиноземи, тальк, крейда, кварц, атапульгіт, монтморилоніт або діатомова земля та помели синтетичних каменів, такі як високодисперсна кремнієва кислота, окис алюмінію та силікати, як тверді носії для гранулятів мають на увазі: подрібнені та фракціоновані природні кам'яні породи, такі як кальцит, мрамур, пемза, сепіоліс, доломіт, а також синтетичні грануляти з неорганічного або органічного борошна, а також грануляти з органічного матеріалу, такого як тирса, шкарлупа кокосових горіхів, кукурудзяні качани та стебла тютюну; як емульгатори та/або піноутворюючі засоби мають на увазі: наприклад, неіоногенні та аніонні емульгатори, такі як поліоксиетиленовий естер жирної кислоти, поліоксиетиленовий етер жирного спирту, наприклад, алкіларилполігліколевий етер, алкілсульфонати, алкілсульфати, арилсульфонати, а також гідролізати білку; як диспергуючі засоби мають на увазі: наприклад, відпрацьовані лігнінсульфітні луги та метилцеллюлозу.

В рецептурах можуть бути застосовані речовини, що поліпшують адгезію, такі як карбоксиметилцелюлоза, природні або синтетичні порошокоподібні, зернисті або латексоподібні полімери, такі як гуміарабік, полівініловий спирт, полівінілацетат, а також природні фосфоліпіди, такі як кефаліни та лецитини, та синтетичні фосфоліпіди. Іншими добавками можуть бути мінеральні масла та рослинні олії.

Можуть застосовуватися барвники, такі як неорганічні пігменти, наприклад, оксид заліза, оксид титану, фероціан синій та органічні барвники, такі як алізарин-, азо- та металфталоціанінові барвники та слідові кількості живильних мікроелементів, такі як солі заліза, марганцю, бору, міді, кобальту, молібдену та цинку.

Рецептури містять, як правило, від 0,1 до 95ваг % активної речовини, переважно, від 0,5 до 90ваг % активної речовини.

Запропоновані згідно з даним винаходом активні речовини можуть бути використані у своїй препаративній формі або бути змішані з відомими гербіцидами та/або речовинами, що застосовують при боротьбі з бур'янами для поліпшення сумісності з культурними рослинами (захисні речовини), причому є можливим використання готової препаративної форми або сумішей у резервуарі. Також можливі суміші з агентами для боротьби з бур'янами, що містять один або кілька відомих гербіцидів та одну захисну речовину.

Для змішування використовують відомі гербіциди, наприклад,

ацетохлор, ацифлуорфен(-натрій), аклоніфен, алахлор, алоксидим(-натрій), аметрин, амікарбазон, амідохлор, амідосульфурон, анілофос, асулам, атразин, азафенідин, азимсульфурон, бефлубетамід, беназолін(-етил), бенфурезат, бенсульфурон(-метил), бентазон, бензфендізон, бензобіциклон, бензофенап, бензоілпроп(-етил), біалафос, біфенокс, біспірибак(-натрій), бромобутид, бромофеноксим, бромоксиніл, бутахлор, бутафенацил(-аліл), бутроксидим, бутилат, кафенстрол, калоксидим, карбетамід, карфентразон(-

етил), хлометоксифен, хлорамбен, хлорідазон, хлорімулон(-етил), хлорнітрофен, хлорсульфурон, хлортолулон, цинідон(-етил), цинметилін, ціносульфурон, клефоксидим, клетодим, клодинафоп(-пропаргіл), кломазон, кломепроп, клопіралід, клопірасульфурон(-метил), клорансулам(-метил), кумілулон, ціаназин, цибуترین, циклоат, циклосульфамурон, циклоксидим, цигалофоп(-бутил), 2,4-D, 2,4-DB, десмедифам, діалат, дикамба, дихлорпроп(-P), диклофоп(-метил), диклосулам, діетатил(-етил), дифензокват, дифлуфенікан, дифлуфензопір, димефурон, димепіперат, диметаклор, диметаметрин, диметенамід, димексифлам, динітрамін, дифенамід, дикват, дитіопір, діурон, димрон, епроподан, ЕРТС, еспрокарб, еталфлураліін, етаметсульфурон(-метил), етофумезат, етоксифен, етоксисульфурон, етобензанід, феноксапроп(-P-етил), фентразамід, флампроп(-ізопропіл, -ізопропіл-L, -метил), флазасульфурон, флорасулам, флуазифоп(-P-бутил), флуазолат, флукарбазон(-натрій), флуфенацет, флуфенпір, флуметсулам, флуміклорак(-пентил), флуміоксазин, флуміпропіл, флуметсулам, флуометурон, фторохлоридон, фтороглікофен(-етил), флупоксам, флупропацил, флупірсульфурон(-метил, -натрій), флуренол(-бутил), флуридон, флуороксіпір(-бутоксіпропіл, -метил), флупримідол, флуртамон, флутіацет(-метил), флутіамід, фомезафен, форамсульфурон, глюфозинат(-амоній), гліфозат(-ізопропіламоній), галосафен, галоксифоп(-етоксиетил, -P-метил), гексазинон, імазаметабенз(-метил), імазаметапір, імазамокс, імазапік, імазапір, імазахін, імазетатпір, імазосульфурон, йодосульфурон(-метил, -натрій), іюксиніл, ізопропалін, ізопротурон, ізоурон, ізоксабен, ізоксахлортол, ізоксафлутол, ізоксапірифоп, кетоспірадокс, лактофен, ленацил, лінулон, МСРА, мекопроп, мефенацет, мезотріон, метамітрон, метатахлор, метабензтіазурон, метобензулон, метобромурон, (альфа-)метолахлор, метосулам, метоксурон, метрибузин, метсульфурон(-метил), молінат, монолінулон, напроанілід, напропамід, небурон, нікосульфурон, норфлуразон, орбенкарб, оризалін, оксадіаргіл, оксадіазон, оксасульфурон, оксацикломефон, оксифторфен, паракват, пеларгонова кислота, пендиметалін, пендралін, пентоксазон, пентоксамід, фенмедифам, піколінафен, піперофос, претілахлор, примісульфурон(-метил), профлуразол, профоксидим, прометрин, пропахлор, пропаніл, пропаквізафоп, пропізохлор, пропоксикарбазон(-натрій), пропізамід, просульфокарб, просульфурон, пірафлуфен(-етил), піразогіл, піразолат, піразосульфурон(-етил), піразоксифен, пірибензоксим, пірибутикарб, піридат, піридатол, пірифталід, піримінобак(-метил), піритіобак(-натрій), хінхлорак, хінмерак, хінокламін, хінзалофоп(-P-етил, -P-тефурил), римсульфурон, сетоксидим, симазин, симетрин, сулькотріон, сульфентразон, сульфометурон(-метил), сульфозат, сульфосульфурон, тебутам, тебутіурон, тепралоксидим, тербутилазин, тербутрин, тенілхлор, тіафлуамід, тіазопір, тидіазимін, тифенсульфурон(-метил), тіобенкарб, тіокарбазил, тралоксидим, триалат, триасульфурон, трибенурон(-метил), триклопір, тридифан, трифлураліл, трифлуксисуль-

фурон, трифлусульфурон(-метил), тритосульфурон.

Для змішування можуть також бути застосовані відомі захисні речовини, наприклад, AD-67, BAS-145138, беноксакор, клоквінтоцет(-мексил), ціометриніл, 2,4-D, DKA-24, дихлормід, димрон, фенклорим, фенхлоразол(-етил), флуразол, флуксофенім, фурилазол, ізоксадифен(-етил), МСРА, мекопроп(-Р), мефенпір(-діетил), MG-191, оксабетриніл, PPG-1292, R-29148.

Також можлива суміш з іншими відомими активними речовинами, такими як фунгіциди, інсектициди, акарициди, нематоциди, речовини для захисту від птахів, речовини для підживлення рослин та засоби для поліпшення структури ґрунту.

Активні речовини можна застосовувати як такі, у вигляді їх препаративних форм або приготованих з них шляхом подальшого розведення форм застосування, таких як готові до використання розчини, суспензії, емульсії, порошки, пасти та грануляти. Застосування здійснюють звичайним способом, наприклад, шляхом поливання, обприскування, мілкокрапельного обприскування, розкидання.

Згідно з винаходом активні речовини можна наносити як до, так і після появи сходів рослин. Їх можна також вносити перед посівом у ґрунт.

Використовувана кількість активної речовини може коливатися в широких межах. Вона залежить від роду бажаного ефекту. Загалом норми витрат становлять від 1г до 10кг, переважно від 5г до 5кг, активної речовини на гектар поверхні ґрунту.

Як вже було зазначено вище, згідно з винаходом можна обробляти всі рослини та їх частини. У переважному варіанті здійснення обробляють види та сорти рослин, а також їх частини, вирощені або одержані за умов біологічного розведення, такі як схрещування або злиття протопластів. В іншому переважному варіанті здійснення обробляють трансгенні рослини та сорти рослин, одержані генетичними методами, в разі необхідності, у комбінації із звичайними методами (генетично модифіковані організми) та їх частини. Поняття «частини» або «частини рослин» або «органи рослин» було пояснене вище.

Особливо переважно згідно з винаходом обробляють рослини відповідних комерційно доступних або зазвичай використовуваних сортів. Під сортами рослин розуміють рослини з визначеними властивостями (ознаками), що одержують умовним розведенням, мутагенезом або рекомбінантними методиками ДНК. Це можуть бути сорти, біотипи та генотипи.

Залежно від виду або сорту рослин, їх місцезнаходження та умов росту (ґрунт, клімат, період вегетації, харчування) в результаті обробки згідно з винаходом можуть спостерігатися нададитивні («синергічні») ефекти. Так, наприклад, можливе зниження кількості застосовуваних речовин та/або розширення спектру дії та/або посилення дії речовин та засобів, застосовуваних згідно з винаходом, також у комбінації з іншими агрохімічними активними речовинами, поліпшення росту культурних рослин, підвищена толерантність культурних рослин по відношенню до високих або низьких темпе-

ратур, підвищена толерантність до браку вологості або вмісту солей у воді або ґрунті, підвищена продуктивність при цвітінні, полегшення збору врожаю, прискорення дозрівання, більш високий врожай, більш висока якість та/або більш висока поживність продуктів врожаю, краще збереження та/або краща перероблюваність продуктів врожаю, що виходять за межі власне очікуваних ефектів.

До переважних трансгенних (одержаних з використанням генних технологій) рослин або сортів рослин згідно з винаходом належать всі рослини, які містять генетичний матеріал, модифікований за генною технологією, що додає цим рослинам особливо вигідні цінні властивості. Прикладами таких властивостей є кращий ріст рослин, підвищена толерантність по відношенню до високих або низьких температур, підвищена толерантність до браку вологості або до вмісту солей у воді або у ґрунті, підвищена продуктивність при цвітінні, полегшення збору врожаю, прискорення дозрівання, більш високий врожай, більш висока якість та/або більш висока поживність продуктів врожаю, більша тривалість збереження та/або краща здатність до переробки продуктів врожаю. До інших та особливо переважних прикладів таких властивостей належать підвищена стійкість рослин до тваринних шкідників та до мікроорганізмів, таких як комахи, кліщі, патогенні для рослин грибки, бактерії та/або віруси, а також підвищена толерантність рослин до певних гербіцидних активних речовин. Як приклади трансгенних рослин слід згадати важливі культурні рослини, такі як зернові (пшениця, рис), кукурудза, соя, картопля, бавовна, рапс, а також фруктові рослини (із плодами яблук, груш, плодами цитрусових та винограду), причому особливу перевагу надають кукурудзі, сої, картоплі, бавовні та рапсу. До особливо переважних властивостей належать підвищена стійкість рослин до комах у зв'язку з токсинами, що утворюються в рослинах, особливо такими, які створюються за допомогою генетичного матеріалу з *Bacillus Thuringiensis* (наприклад, за допомогою генів CryIA(a), CryIA(b), CryIA(c), CryIIA, CryIIIA, CryIIIB2, Cry9c, Cry2Ab, Cry3Bb та CryIF, а також їх комбінацій) у рослинах (надалі "Бт. рослини"). До особливо переважних властивостей належать також підвищена стійкість рослин по відношенню до грибів, бактерій та вірусів завдяки набутій системній стійкості (SAR), системіну, фітоалексину, еліциторам, а також генам резистентності та відповідно експериментованим протеїнам та токсинам. Крім того до особливо переважних властивостей належать також підвищена толерантність рослин по відношенню до певних гербіцидно активних речовин, наприклад, імідазолінів, сульфонілкарбамідів, гліфозатів або фосфінотрицину (наприклад, "PAT"-ген). Гени, що забезпечують бажані властивості, можуть зустрічатися в трансгенних рослинах в комбінаціях між собою. Прикладами "Бт. рослин" є сорти кукурудзи, бавовни, сої та картоплі, наявні у продажу під торговельними марками YIELD GARD® (наприклад, кукурудза, бавовна, соя), KnockOut® (наприклад, кукурудза), StarLink® (наприклад, кукурудза), Bollgard® (бавовна), Nucotn® (бавовна) та NewLeaf® (картопля). Прикладами толерантних до

гербіцидів рослин є сорти кукурудзи, бавовни та сої, наявні у продажу під торговельними марками Roundup Ready® (толерантність по відношенню до гліфозату, наприклад, кукурудза, бавовна, соя), Liberty Link® (толерантність по відношенню до фосфінотрицину, наприклад, рапс), IML® (толерантність по відношенню до імідазолінонів) та STS® (толерантність по відношенню до сульфонілкарбамідів, наприклад, кукурудза). Стійкі до гербіцидів сорти рослин (звичайно вирощені в умовах толерантності по відношенню до гербіцидів) наявні у продажу під назвою Clearfield® (наприклад, кукурудза). Зрозуміло, що ці висловлення справедливі і для сортів рослин, що будуть створені в майбутньому або які в майбутньому потраплять на ринок, з цими або в майбутньому створеними генетичними властивостями.

Згадані вище рослини згідно з винаходом особливо переважно можуть бути оброблені сполуками загальної формули (I) або сумішами активних речовин згідно з винаходом, при цьому поряд з високою активністю у боротьбі з бур'янами трансгенні рослини або сорти рослин проявляють згадані вище синергічні ефекти. Вказані вище у зв'язку з активними речовинами або сумішами переважні значення стосуються також обробки цих рослин. Особливо переважною є обробка рослин сполуками або сумішами, спеціально зазначеними в даному тексті.

Одержання та застосування активних речовин згідно з винаходом демонструють наведені нижче приклади.

Приклади одержання

Приклад 1

Приклад 1



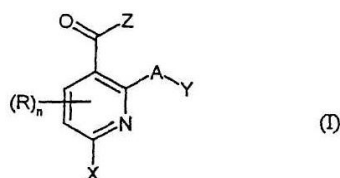
Суміш з 1,00г (3,63ммоль) 6-трифторметил-2-(3-метил-2-оксоімідазолідин-1-іл-метил)нікотинової кислоти, 0,41г (3,63ммоль) циклогексан-1,3-діону, 0,90г (4,35ммоль) дициклогексилкарбодііміду та 30мл ацетонітрилу перемішують протягом 18 годин при кімнатній температурі (приблизно 20°C). Після цього до цієї суміші додають 0,75г (7,25ммоль) триетиламіну та 0,15г (1,45ммоль)

триметилсилілціаніду, та реакційну суміш протягом 18 годин перемішують при кімнатній температурі. Потім концентрують при пониженому тиску, у залишок при перемішуванні додають 10%-ний водний розчин карбонату натрію, поміщають у діетиловий етер та фільтрують. Водну фазу фільтрату відокремлюють, підкислюють 2N соляною кислотою та екстрагують метиленхлоридом. Органічний розчин екстракту промивають водою, висушують сульфатом натрію та фільтрують. Фільтрат концентрують, а залишок очищують шляхом препаративної HPLC (високопродуктивна рідинна хроматографія).

Одержують 0,23г (16% від теор.) 2-[2-(3-метил-2-оксоімідазолідин-1-ілметил)-6-трифторметилпіридин-3-карбоніл]циклогексан-1,3-діону.

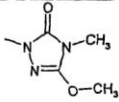
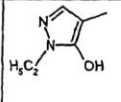
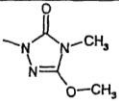
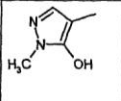
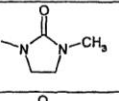
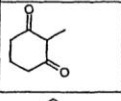
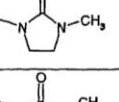
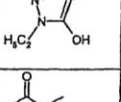
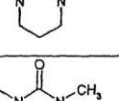
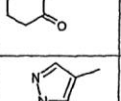
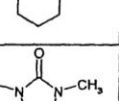
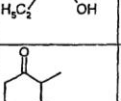
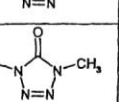
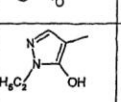
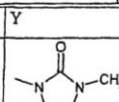
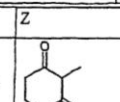
LogP=2,14.

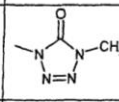
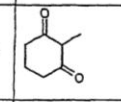
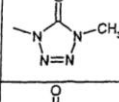
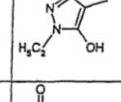
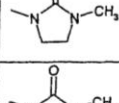
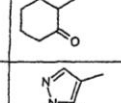
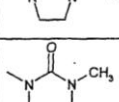
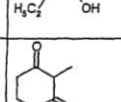
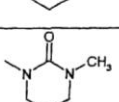
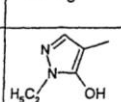
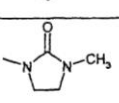
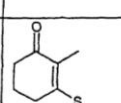

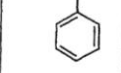
Аналогічно прикладу 1, а також відповідно до загального опису способу одержання згідно з винаходом можуть також бути одержані, наприклад, наведені нижче в таблиці 1 сполуки загальної формули (I).

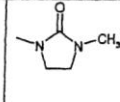
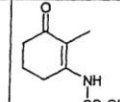
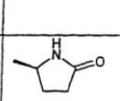
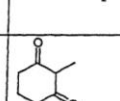
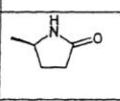
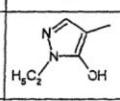
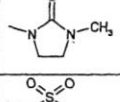
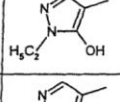
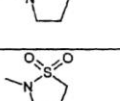
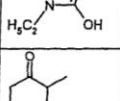
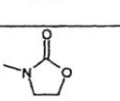
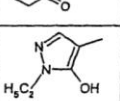
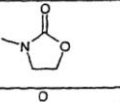
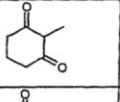
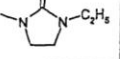
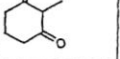
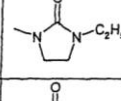
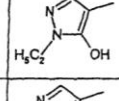


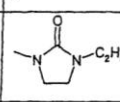
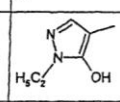
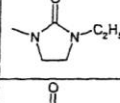
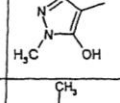
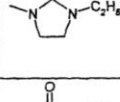
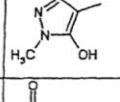
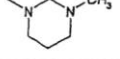
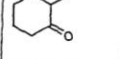
Таблиця 1: приклади сполук формули (I), n означає відповідно число 0

Прикл. №	A	X	Y	Z	Фіз. показн.
2	CH ₂	CF ₃			logP=2,23 ^{a)}
3	CH ₂	CF ₃			logP=1,79 ^{a)}
4	CH ₂	CF ₃			logP=1,49 ^{a)}
5	CH ₂	CF ₃			logP=2,01 ^{a)}

Прикл. №	A	X	Y	Z	Фіз. показн.
6	CH ₂	CF ₃			logP=1,59 ^{a)}
7	CH ₂	CF ₃			logP=1,36 ^{a)}
8	CH ₂	SO ₂ CH ₃			
9	CH ₂	SO ₂ CH ₃			
10	CH ₂	SO ₂ CH ₃			
11	CH ₂	SO ₂ CH ₃			
12	CH ₂	CF ₃			
13	CH ₂	CF ₃			

Прикл. №	A	X	Y	Z	Фіз. показн.
14	CH ₂	SO ₂ CH ₃			
15	CH ₂	SO ₂ CH ₃			
16	CH ₂	OCH ₃			
17	CH ₂	OCH ₃			
18	CH ₂	Cl			
19	CH ₂	Cl			
20	CH ₂	CF ₃			

Прикл. №	A	X	Y	Z	Фіз. показн.
21	CH ₂	CF ₃			
22	OCH ₂	CF ₃			logP=2,09 ^{a)}
23	OCH ₂	CF ₃			logP=1,66 ^{a)}
24	CH ₂	CF ₃			logP=1,54 ^{a)}
25	CH ₂	CF ₃			logP=1,64 ^{a)}
26	CH ₂	CF ₃			logP=2,19 ^{a)}
27	CH ₂	CF ₃			logP=1,49 ^{a)}
28	CH ₂	CF ₃			logP=1,97 ^{a)}
29	CH ₂	CF ₃			logP=2,31 ^{a)}

Прикл. №	A	X	Y	Z	Фіз. показн.
30	CH ₂	CF ₃			logP=1,75 ^{a)}
31	CH ₂	CF ₃			logP=1,51 ^{a)}
32	CH ₂	CF ₃			logP=1,41 ^{a)}
33	CH ₂	CF ₃			logP=2,19 ^{a)}

Зазначені в таблицях значення logP визначають відповідно до інструкції Європ. Співтовариства 79/831, V. A8, шляхом високопродуктивної рідинної хроматографії на фазоінверсійній колоні (C 18). Температура: 43°C.

(а) Елюенти для визначення в кислому середовищі: 0,1% водний розчин фосфорової кислоти, ацетонітрил; лінійний градієнт від 10% до 90% ацетонітрилу - відповідні результати вимірювання наведені в таблиці 1 під літерою ^{a)}.

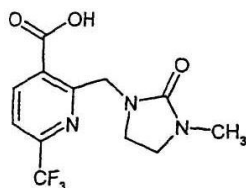
(б) Елюенти для визначення в нейтральному середовищі: 0,01-молярний водний фосфатний буферний розчин, ацетонітрил; лінійний градієнт від 10% до 90% ацетонітрилу - відповідні результати вимірювання наведені в таблиці 1 під літерою ^{b)}.

Калібрування здійснюють за допомогою нерозгалужених алкан-2-онів (з 3-16 атомами вуглецю), значення $\log P$ яких відомі (визначення значень $\log P$ на основі часу здатності до утримування за допомогою лінійної інтерполяції між двома сусідніми ал канонами).

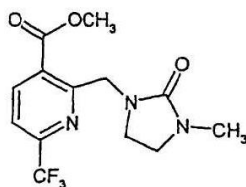
Значення лямбда-макс визначають за допомогою Уф-спектров від 200нм до 400нм у максимумах хроматографических сигналів.

Вихідні речовини Формули (II):

Приклад II-1:



Стадія 1

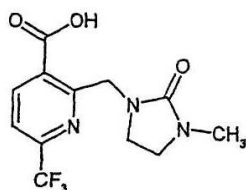


Суміш з 6,2г (62,0ммоль) 1-метил-2-оксоімідазолідину, 2,5г (62,0ммоль) гідриду натрію та 100мл ацетонітрилу протягом 60 хвилин перемішують при температурі 80°C. Після цього при кімнатній температурі (приблизно 20°C) додають 18,5г (62,0ммоль) метилового естеру 2-бромметил-6-трифторметилнікотинової кислоти, та реакційну суміш протягом 18 годин перемішують при кімнатній температурі. Потім обережно додають 100мл води, підкислюють 2N соляною кислотою та струшують з метиленхлоридом. Органічну фазу відділяють, промивають водою, висушують сульфатом натрію та фільтрують. Фільтрат концентрують при пониженому тиску, а залишок очищують шляхом колонкової хроматографії (силікагель, метиленхлорид/ацетонітрил=9:1).

Як другу фракцію одержують 3,2г (13% від теор.) метилового естеру 6-трифторметил-2-(3-метил-2-оксоімідазолідин-1-ілметил)нікотиновоїкислоти.

$\log P=1,99$.

Стадія 2

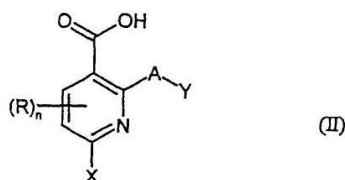


Суміш з 2,8г (8,8ммоль) метилового естеру 6-трифторметил-2-(3-метил-2-оксоімідазолідин-1-ілметил)нікотинової кислоти, 0,35г гідроксиду натрію, 50мл води та 50мл тетрагідрофурану протягом 18 годин перемішують при кімнатній температурі (приблизно 20°C). Після цього при пониженому тиску розчин концентрують до одержання приблизно половини об'єму, потім роздіджують водою та струшують з діетиловим етером. Водну фазу відділяють, підкислюють 2N соляною кислотою та екстрагують етиловим естером оцтової кислоти. Органічний розчин екстракту промивають водою та концентрують при пониженому тиску. Залишок дигерують діетиловим етером, а кристалічний продукт, що випав у осад, ізолюють відсмоктуванням.

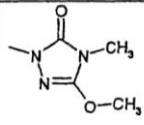
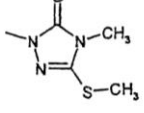
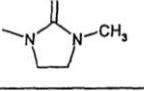
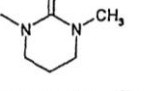
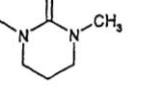
Одержують 1,2г (43% від теор.) 6-трифторметил-2-(3-метил-2-оксоімідазолідин-1-ілметил)нікотинової кислоти.

$\log P=1,62$.

Аналогічно можуть бути одержані, наприклад, також наведені нижче в таблицях 2 або 3 сполуки загальних формул (II) або (VI).

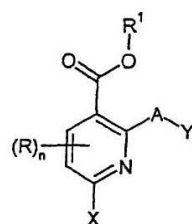


Таблиця 2: приклади сполук формули (II) (п означає при цьому відповідно число 0)

Прикл. №	A	X	Y	Фіз. показн.
II-2	CH ₂	CF ₃		$\log P=1,52^a$
II-3	CH ₂	CF ₃		$\log P=1,72^a$
II-4	CH ₂	SO ₂ CH ₃		
II-5	CH ₂	CF ₃		$\log P=1,82^a$
II-6	CH ₂	SO ₂ CH ₃		

Прикл. №	A	X	Y	Фіз. показн.
II-7	CH ₂	CF ₃		
II-8	CH ₂	SO ₂ CH ₃		
II-9	CH ₂	OCH ₃		
II-10	CH ₂	OCH ₃		
II-11	CH ₂	OCH ₃		
II-12	CH ₂	Cl		
II-13	CH ₂	Cl		
II-14	CH ₂	Cl		
II-15	CH ₂	CN		

Прикл. №	A	X	Y	Фіз. показн.
II-16	CH ₂	CN		
II-17	CH ₂	CN		
II-18	CH ₂	CH ₃		
II-19	CH ₂	CH ₃		
II-20	CH ₂	CH ₃		
II-21	CH ₂	CF ₃		logP=1,59 ^{a)}
II-22	CH ₂	CF ₃		
II-23	CH ₂	CF ₃		logP=1,86 ^{a)}

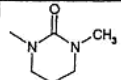
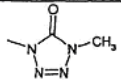
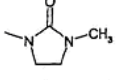
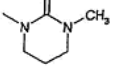
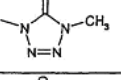
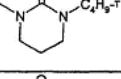
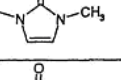
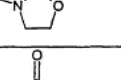
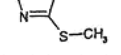


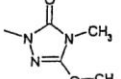
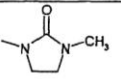
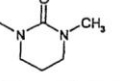
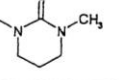
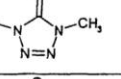
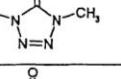
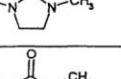
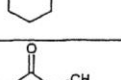
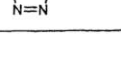
(VI)

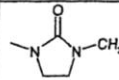
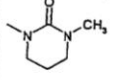
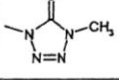
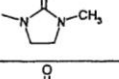
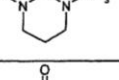
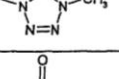
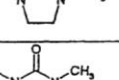
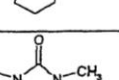
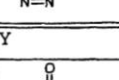
Таблиця 3: приклади сполук формули (VI) (n означає при цьому відповідно число 0)

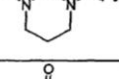
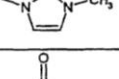
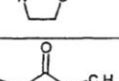
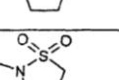

Прикл. №	A	R ¹	X	Y	Фіз. показн.
VI-1	CH ₂	CH ₃	CF ₃		logP=2,14 ^{a)}
VI-2	CH ₂	CH ₃	CF ₃		logP=1,88 ^{a)}
VI-3	CH ₂	CH ₃	SO ₂ CH ₃		
VI-4	CH ₂	CH ₃	CF ₃		
VI-5	CH ₂	CH ₃	SO ₂ CH ₃		

Прикл. №	A	R ¹	X	Y	Фіз. показн.
VI-6	CH ₂	CH ₃	CF ₃		
VI-7	CH ₂	CH ₃	SO ₂ CH ₃		
VI-8	CH ₂	CH ₃	OCH ₃		
VI-9	CH ₂	CH ₃	OCH ₃		
VI-10	CH ₂	CH ₃	OCH ₃		
VI-11	CH ₂	CH ₃	Cl		
VI-12	CH ₂	CH ₃	Cl		
VI-13	CH ₂	CH ₃	Cl		
VI-14	CH ₂	CH ₃	CN		

Прикл. №	A	R ¹	X	Y	Фіз. показн.
VI-15	CH ₂	CH ₃	CN		
VI-16	CH ₂	CH ₃	CN		
VI-17	CH ₂	CH ₃	CH ₃		
VI-18	CH ₂	CH ₃	CH ₃		
VI-19	CH ₂	CH ₃	CH ₃		
VI-20	CH ₂	CH ₃	CF ₃		
VI-21	CH ₂	CH ₃	CF ₃		
VI-22	CH ₂	CH ₃	CF ₃		logP=1,88 ^{*)}
VI-23	CH ₂	τ-C ₄ H ₉	CF ₃		

Прикл. №	A	R ¹	X	Y	Фіз. показн.
VI-24	CH ₂	τ-C ₄ H ₉	CF ₃		
VI-25	CH ₂	τ-C ₄ H ₉	SO ₂ CH ₃		
VI-26	CH ₂	τ-C ₄ H ₉	CF ₃		
VI-27	CH ₂	τ-C ₄ H ₉	SO ₂ CH ₃		
VI-28	CH ₂	τ-C ₄ H ₉	CF ₃		
VI-29	CH ₂	τ-C ₄ H ₉	SO ₂ CH ₃		
VI-30	CH ₂	τ-C ₄ H ₉	OCH ₃		
VI-31	CH ₂	τ-C ₄ H ₉	OCH ₃		
VI-32	CH ₂	τ-C ₄ H ₉	OCH ₃		

Прикл. №	A	R ¹	X	Y	Фіз. показн.
VI-33	CH ₂	τ-C ₄ H ₉	Cl		
VI-34	CH ₂	τ-C ₄ H ₉	Cl		
VI-35	CH ₂	τ-C ₄ H ₉	Cl		
VI-36	CH ₂	τ-C ₄ H ₉	CN		
VI-37	CH ₂	τ-C ₄ H ₉	CN		
VI-38	CH ₂	τ-C ₄ H ₉	CN		
VI-39	CH ₂	τ-C ₄ H ₉	CH ₃		
VI-40	CH ₂	τ-C ₄ H ₉	CH ₃		
VI-41	CH ₂	τ-C ₄ H ₉	CH ₃		

Прикл. №	A	R ¹	X	Y	Фіз. показн.
VI-42	CH ₂	τ-C ₄ H ₉	CF ₃		
VI-43	CH ₂	τ-C ₄ H ₉	CF ₃		
VI-44	CH ₂	τ-C ₄ H ₉	CF ₃		
VI-45	CH ₂	CH ₃	CF ₃		logP=2,24 ^{*)}
VI-46	CH ₂	CH ₃	CF ₃		logP=2,07 ^{*)}

Приклади застосування

Приклад А

Обробка до сходження

Розчинник: 5ваг. частин ацетону,

Емульгатор: 1ваг. частина алкіларилгліколевого етеру

Для одержання необхідної композиції активних речовин 1 вагову частину активної речовини перемішують із вказаною кількістю розчинника, додають вказану кількість емульгатора, концентрат розріджують до необхідної концентрації водою.

Насіння рослин висівають ґрунт за нормальних умов. Через 24 години ґрунт обприскують композицією активної речовини так, що на одиницю поверхні наносять бажану кількість активної речовини.

вини. При цьому концентрацію активних речовин у аерозолі для обприскування вибирають таким чином, що 1000л води на гектар поверхні ґрунту містять бажану кількість активної речовини.

Через три тижні визначають ступінь пошкодження в % у порівнянні з розвитком рослин необробленої контрольної групи. При цьому:

0% означає ніякого ефекту (як в необробленій контрольній групі рослин)

100% означає повне знищення.

В цьому дослідженні сполуки з прикладів одержання 1, 2, 3, 4, 5 та 6 поряд з високою сумісністю з культурними рослинами, такими як, наприклад, кукурудза, соя та пшениця, проявляють також високу активність у боротьбі з бур'янами.

Приклад В

Обробка після сходження

Розчинник: 5ваг. частин ацетону,

Емульгатор: 1ваг. частини алкіларилгліколевого етеру

Для одержання необхідної композиції активних речовин 1 вагову частину активної речовини пе-

ремішують із вказаною кількістю розчинника, додають вказану кількість емульгатора, концентрат розріджують до необхідної концентрації водою.

Рослини, що досягли висоти від 5 до 15см, обприскують композицією активних речовин так, що бажану кількість активної речовини наносять на одиницю поверхні. При цьому концентрацію активних речовин у аерозолі для обприскування вибирають таким чином, що 1000л води на гектар поверхні ґрунту містять бажану кількість активної речовини.

Через три тижні визначають ступінь пошкодження в % у порівнянні з розвитком рослин необробленої контрольної групи. При цьому:

0% означає ніякого ефекту (як в необробленій контрольній групі рослин)

100% означає повне знищення.

В цьому дослідженні сполуки з прикладів одержання 1, 2, 3, 4 та 5 поряд з високою сумісністю з культурними рослинами, такими як, наприклад, кукурудза та рапс, проявляють також високу активність у боротьбі з бур'янами.