



УКРАЇНА

(19) **UA** (11) **77414** (13) **C2**

(51) МПК (2006)

**C07D 295/20** (2006.01)**A01N 43/56** (2006.01)**A01N 47/30** (2006.01)**C07C 235/06** (2006.01)**C07C 271/18** (2006.01)**C07C 271/50** (2006.01)**C07C 275/24** (2006.01)**C07C 275/26** (2006.01)**C07C 275/28** (2006.01)**C07C 317/32** (2006.01)**C07C 335/00****C07D 231/20** (2006.01)**C07D 261/12** (2006.01)**C07D 409/12** (2006.01)**C07D 409/14** (2006.01)МІНІСТЕРСТВО ОСВІТИ  
І НАУКИ УКРАЇНИДЕРЖАВНИЙ ДЕПАРТАМЕНТ  
ІНТЕЛЕКТУАЛЬНОЇ  
ВЛАСНОСТІ**ОПИС**  
**ДО ПАТЕНТУ НА ВИНАХІД****(54) ЗАМІЩЕНІ АРИЛКЕТОНИ, ПРОМІЖНА СПОЛУКА ДЛЯ ЇХ ОДЕРЖАННЯ, ГЕРБИЦИДНИЙ ЗАСІБ**

1

2

**(21)** 20031211191**(22)** 29.04.2002**(24)** 15.12.2006**(86)** PCT/EP02/04701, 29.04.2002**(31)** 101 22 445.1**(32)** 09.05.2001**(33)** DE**(31)** 101 36 449.0**(32)** 26.07.2001**(33)** DE**(46)** 15.12.2006, Бюл. № 12, 2006 р.**(72)** Херрманн Штефан, DE, Хоішен Доротее, DE, Катер Крістіан, DE, Мюллер Клаус-Хельмут, AT, Шалльнер Отто, DE, Шварц Ханс-Георг, DE, Древес Марк Вільхельм, DE, Дамен Петер, DE, Фойхт Дітер, DE, Понтцен Рольф, DE**(73)** БАЕР КРОПСАЄНС АГ, DE**(56)** WO 0021924 A, 20.04.2000

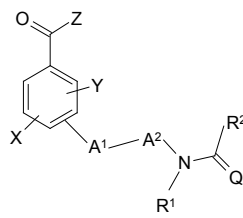
WO 9903856 A, 28.01.1999

WO 0123367 A, 05.04.2001

US 5849928 A, 15.12.1998

WO 9962520 A, 09.12.1999

WO 0068227 A, 16.11.2000

**(57)** 1. Сполуки формули (I)

(I)

в якій

A<sup>1</sup> означає О або простий зв'язок;A<sup>2</sup> означає алкандііл (алкілен), алкендііл або алкіндііл, що містить відповідно до 6 атомів вуглецю; Q означає О;R<sup>1</sup> означає водень, відповідно, в разі необхідності, заміщений ціано, галогеном, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкокси, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкілтіо, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкілсульфінілом або C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкілсульфонілом алкіл, алкокси, алкілтіо, алкілсульфініл, алкілсульфоніл або алкіламіно, які в алкільних групах містять відповідно 1-6 атомів вуглецю, діалкіламіно, який в алкільних групах містить 1-4 атоми вуглецю, відповідно, в разі необхідності, заміщений ціано або галогеном алкеніл або алкініл, що містять відповідно 2-6 атомів вуглецю, відповідно, в разі необхідності, заміщений ціано, галогеном або C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкілом циклоалкіл або циклоалкілалкіл, які в циклоалкільній групі містять відповідно 3-6 атомів вуглецю, а в алкільній частині -1-4 атоми вуглецю, відповідно, в разі необхідності, заміщений нітро, ціано, галогеном, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкілом, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-галогеналкілом, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкокси або**C2**  
(13)**77414**  
(11)**UA**  
(19)

C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-галогеналкокси арил або арилалкіл, які в арильній групі містять відповідно 6 або 10 атомів вуглецю, а в алкільній частині - 1-4 атоми вуглецю, або групу -C(Q)-R<sup>2</sup>;

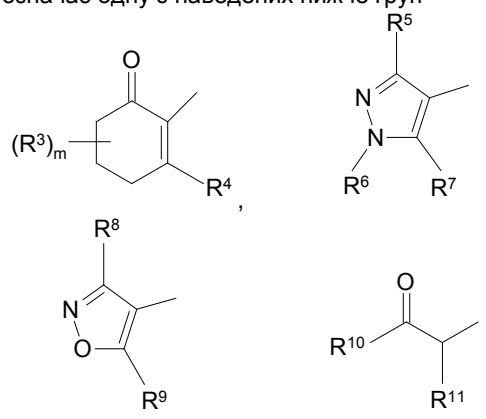
R<sup>2</sup> означає водень, аміно, ціаноаміно, нітроаміно, гідроксіаміно, гіdraзино, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкілкарбоніл, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкоксикарбоніл, відповідно, в разі необхідності, заміщений ціано, галогеном, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкокси, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкілтіо, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкілсульфінілом або C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкілсульфонілом алкіл, алкокси, алкілтіо, алкіламіно, алкоксіаміно або алкілгіdraзино, які в алкільних групах містять відповідно 1-6 атомів вуглецю, діалкіламіно, N-алкілалкоксіаміно або діалкілгіdraзино, які в алкільних групах містять відповідно 1-4 атоми вуглецю, відповідно, в разі необхідності, заміщений галогеном алкеніл, алкенілокси, алкеніламіно, алкенілоксіаміно, алкініл, алкінілокси або алкініламіно, які містять відповідно 2-6 атомів вуглецю, відповідно, в разі необхідності, заміщений ціано, галогеном або C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкілом циклоалкіл, циклоалкілокси, циклоалкіламіно, циклоалкілалкіл, циклоалкілалкокси або циклоалкілалкіламіно, які в цикло-алкільній групі містять відповідно 3-6 атомів вуглецю, а в алкільній частині відповідно 1-4 атоми вуглецю, відповідно, в разі необхідності, заміщений нітро, ціано, галогеном, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкілом, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-галогеналкілом, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкокси, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-галогеналкокси або C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкоксикарбонілом арил, арилкарбоніл, арилокси, арилоксикарбоніл, арилтіо, ариламіно, арилгіdraзино, арилалкіл, арилалкокси, арилалкілтіо або арилалкіламіно, які в арильній групі містять відповідно 6 або 10 атомів вуглецю, а в алкільній частині, в разі необхідності, містять 1-4 атоми вуглецю, або, відповідно, в разі необхідності, заміщений нітро, ціано, галогеном, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкілом, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-галогеналкілом, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкокси, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-галогеналкокси, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкілтіо, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-галогеналкілтіо або C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкоксикарбонілом моноциклічний або біциклічний гетероцикліл, гетероциклілокси, гетероциклілтіо, гетероцикліламіно, гетероциклілалкіл, гетероциклілалкокси, гетероциклілалкілтіо або гетероциклілалкіламіно, причому гетероциклільна група містить відповідно до 10 атомів вуглецю та додатково щонайменше один гетеро атом, вибраний з ряду азот (N) (щонайбільше 5 N-атомів), кисень (O) (щонайбільше 2 O-атоми), сірка (S) (щонайбільше 2 S-атоми), SO або SO<sub>2</sub>, а також, в разі необхідності, додатково означають групу, вибрану з оксо (C=O), тиоксо (C=S), іміно (C=NH), ціаноіміно (C=N-CN), нітроіміно (C=N-NO<sub>2</sub>);

X означає водень, нітро, ціано, карбокси, карбамоїл, тіокарбамоїл, галоген або, відповідно, в разі необхідності, заміщений ціано, галогеном, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкокси, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкілтіо, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкілсульфінілом або C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкілсульфонілом алкіл, алкокси, алкілтіо, алкілсульфініл, алкілсульфоніл, алкіламіно, діалкіламіно або діалкіламіносульфоніл, які в алкільних групах містять відповідно 1-6 атомів вуглецю;

Y означає водень, нітро, ціано, карбокси, карбамоїл, тіокарбамоїл, галоген або, відповідно, в разі необхідності, заміщений ціано, галогеном, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкокси, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкілтіо, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкілсульфінілом або C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкілсульфонілом алкіл, алкокси, алкілтіо, алкілсульфініл, алкілсульфоніл, алкіламіно,

діалкіламіно або діалкіламіносульфоніл, які в алкільних групах містять відповідно 1-6 атомів вуглецю;

Z означає одну з наведених нижче груп



m означає число від 0 до 3,

R<sup>3</sup> означає водень або, відповідно, в разі необхідності, заміщений фтором та/або хлором метил або етил,

R<sup>4</sup> означає гідрокси,

R<sup>5</sup> означає водень, ціано, карбамоїл, тіокарбамоїл, галоген, відповідно, в разі необхідності, заміщений ціано, галогеном, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкокси, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкілтіо, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкілсульфінілом або C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкілсульфонілом алкіл, алкокси, алкілтіо, алкілсульфініл, алкілсульфоніл або алкоксикарбоніл, які в алкільних групах містять, відповідно, 1-6 атомів вуглецю, або, в разі необхідності, заміщений ціано, галогеном або C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкілом циклоалкіл, що містить 3-6 атомів вуглецю;

R<sup>6</sup> означає водень, в разі необхідності, заміщений ціано, галогеном, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкокси, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкілтіо, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкілсульфінілом або C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкілсульфонілом алкіл, що містить 1-6 атомів вуглецю, відповідно, в разі необхідності, заміщений ціано або галогеном алкеніл або алкініл, що містять відповідно 3-6 атомів вуглецю, відповідно, в разі необхідності, заміщений ціано, галогеном або C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкілом циклоалкіл або циклоалкілалкіл, які в циклоалкільній групі містять відповідно 3-6 атомів вуглецю, а в алкільній частині, в разі необхідності, містять 1-4 атоми вуглецю, або, відповідно, в разі необхідності, заміщений нітро, ціано, галогеном, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкілом, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-галогеналкілом, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкокси, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-галогеналкокси, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкілтіо, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-галогеналкілтіо, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкілсульфінілом, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкілсульфонілом або C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-галогеналкілсульфонілом арил або арилалкіл, які в арильній групі містять відповідно 6 або 10 атомів вуглецю, а в алкільній частині, в разі необхідності, містять 1-4 атоми вуглецю;

R<sup>7</sup> означає гідрокси, формілокси, відповідно, в разі необхідності, заміщений ціано, галогеном або C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкокси алкокси, алкілкарбонілокси, алкоксикарбонілокси, алкіламінокарбонілокси або алкілсульфонілокси, які в алкільних групах містять відповідно 1-6 атомів вуглецю, відповідно, в разі необхідності, заміщений ціано або галогеном алкенілокси або алкінілокси, які містять відповідно 3-6 атомів вуглецю, або, відповідно, в разі необхідності, заміщений нітро, ціано, галогеном, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкілом, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-галогеналкілом, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкокси, C<sub>1</sub>-

C<sub>4</sub>-галогеналкокси, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкілтіо, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-галогеналкілтіо, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкілсульфінілом, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-галогеналкілсульфінілом, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкілсульфонілом або C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-галогеналкілсульфонілом арилалкокси, арилкарбонілокси, арилкарбонілалкокси або арилсульфонілокси, які в арильній групі містять відповідно 6 або 10 атомів вуглецю, а в алкільній частині, в разі необхідності, містять 1-4 атоми вуглецю; R<sup>8</sup> означає водень, ціано, карбамоїл, тіокарбамоїл, галоген або, відповідно, в разі необхідності, заміщений ціано, галогеном або C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкокси алкіл, алкілкарбоніл, алкокси, алкоксикарбоніл, алкілтіо, алкілсульфініл або алкілсульфоніл, які в алкільних групах містять відповідно 1-6 атомів вуглецю, R<sup>9</sup> означає водень, в разі необхідності, заміщений ціано, галогеном або C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкокси алкіл, або, в разі необхідності, заміщений ціано, галогеном або C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкілом циклоалкіл, який містить 3-6 атомів вуглецю;

R<sup>10</sup> означає водень, в разі необхідності, заміщений ціано, галогеном або C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкокси алкіл, або, в разі необхідності, заміщений ціано, галогеном або C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкілом циклоалкіл, що містить 3-6 атомів вуглецю;

R<sup>11</sup> означає водень, ціано, карбамоїл, галоген, або, в разі необхідності, заміщений ціано, галогеном або C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкокси алкіл, алкокси, алкоксикарбоніл, алкілтіо, алкілсульфініл або алкілсульфоніл, які в алкільних групах містять відповідно 1-6 атомів вуглецю.

2. Сполуки формули (I) за п. 1, які відрізняються тим, що

A<sup>2</sup> означає метилен (-CH<sub>2</sub>-), етан-1,1-дііл (-CH(CH<sub>3</sub>)-), етан-1,2-дііл (диметилен, -CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>-), пропан-1,1-дііл (-CH(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)-), пропан-1,2-дііл (-CH(CH<sub>3</sub>)CH<sub>2</sub>-), пропан-1,3-дііл (-CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>-), бутан-1,3-дііл (-CH(CH<sub>3</sub>)CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>-), бутан-1,4-дііл (-CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>-), етендііл, пропендііл, бутендііл, етиндііл, пропіндііл або бутіндііл;

R<sup>1</sup> означає водень, відповідно, в разі необхідності, заміщений ціано, фтором, хлором, бромом, метокси, етокси, н- або і-пропокси, метилтіо, етилтіо, н- або і-пропілтіо, метилсульфінілом, етилсульфінілом, н- або і-пропілсульфінілом, метилсульфонілом або етилсульфонілом метил, етил, н- або і-пропіл, н-, і-, в- або трет.-бутил, н-, і-, в- або трет.-пентил, метокси, етокси, н- або і-пропокси, н-, і-, в- або трет.-бутокси, метилтіо, н- або і-пропілтіо, н-, і-, в- або трет.-бутилтіо, метилсульфініл, етилсульфініл, н- або і-пропілсульфініл, метилсульфоніл, етилсульфоніл, метиламіно, етиламіно, н- або і-пропіламіно, н-, і-, в- або трет.-бутиламіно; диметиламіно або діетиламіно; відповідно, в разі необхідності, заміщений фтором, хлором та/або бромом етеніл, пропеніл, бутеніл, пентеніл, етиніл, пропініл, бутиніл або пентиніл; відповідно, в разі необхідності, заміщений ціано, фтором, хлором, бромом, метилом, етилом або пропілом циклопропіл, циклобутил, циклопентил, циклогексил, циклопропілметил, циклобутилметил, циклопентилметил або циклогексилметил; або, відповідно, в разі необхідності, заміщений нітро, ціано, фтором, хлором, бромом, метилом, етилом, н- або і-пропілом, н-, і-, в- або трет.-бутилом, трифторметилом, метокси, етокси, н- або і-пропокси, дифторметокси, трифторметокси, метоксикарбонілом, етоксикарбонілом, н- або і-пропоксикарбонілом феніл, фенілкарбоніл, фенокси, феноксикарбоніл, фенілтіо, феніламіно, фенілгідрозино, нафтил, нафтилокси, нафтилтіо, нафтиламіно, фенілметил, фенілетил, фенілметокси, фенілетокси, фенілметилтіо, фенілетилтіо, фенілметиламіно, фенілетиламіно, нафтилметил, нафтилетил, нафтилметокси, нафтилетокси, нафтилметиламіно або нафтилетиламіно; або, відповідно, в разі необхідності, заміщений нітро, ціано, фтором, хлором, бромом, метилом, етилом, н- або і-пропілом, н-, і-, в- або трет.-бутилом, дифторметилом, трифторметилом, дихлорметилом, трихлорметилом, хлордифторметилом, фтордихлорметилом, метокси, етокси, н- або і-пропокси, н-, і-, в- або трет.-бутокси, дифторметокси, трифторметокси, метилтіо, етилтіо, н- або і-пропілтіо, н-, і-, в- або трет.-бутилтіо, дифторметилтіо, трифторметилтіо, метоксикарбонілом, етоксикарбонілом, н-

тил, фенілметил, фенілетил, нафтилметил або нафтилетил; або групу -C(Q)-R<sup>2</sup>;

R<sup>2</sup> означає водень, аміно, ціаноаміно, нітроаміно, гідроксіаміно, гідрозино;

відповідно, в разі необхідності, заміщений ціано, фтором, хлором, метокси, етокси, н- або і-пропокси, метилтіо, етилтіо, н- або і-пропілтіо, метилсульфінілом, етилсульфінілом, н- або і-пропілсульфінілом, метилсульфонілом або етилсульфонілом метил, етил, н- або і-пропіл, н-, і-, в- або трет.-бутил, н-, і-, в- або трет.-пентил, метокси, етокси, н- або і-пропокси, н-, і-, в- або трет.-бутокси, метилтіо, етилтіо, н- або і-пропілтіо, н-, і-, в- або трет.-бутилтіо, метиламіно, етиламіно, н- або і-пропіламіно, н-, і-, в- або трет.-бутиламіно, метоксіаміно, етоксіаміно, н- або і-пропоксіаміно, н-, і-, в- або трет.-бутоксіаміно, метилгідрозино, етилгідрозино, н- або і-пропілгідрозино, н-, і-, в- або трет.-бутилгідрозино; диметиламіно, діетиламіно, N-метилметоксіаміно, диметилгідрозино або діетилгідрозино; відповідно, в разі необхідності, заміщений фтором, хлором та/або бромом етеніл, пропеніл, бутеніл, пентеніл, етиніл, пропініл, бутиніл, пентиніл, пропенілокси, бутенілокси, пентенілокси, пропенілтіо, бутенілтіо, пентенілтіо, пропеніламіно, бутеніламіно, пентеніламіно, пропенілоксіаміно, бутенілоксіаміно, етиніл, пропініл, бутиніл, пентиніл, пропінілокси, бутинілокси, пентинілокси, пропініламіно, бутиніламіно або пентиніламіно; відповідно, в разі необхідності, заміщений ціано, фтором, хлором, бромом, метилом, етилом або пропілом циклопропіл, циклобутил, циклопентил, циклогексил, циклопропілокси, циклобутилокси, циклогексилокси, циклопропіламіно, циклобутиламіно, циклопентиламіно, циклогексиламіно, циклопропіл-метил, циклобутилметил, циклопентилметил, циклогексилметил, циклопропілметокси, циклобутилметокси, циклопентилметокси, циклобутилметиламіно, циклопентилметиламіно або циклогексилметиламіно; відповідно, в разі необхідності, заміщений нітро, ціано, фтором, хлором, бромом, метилом, етилом, н- або і-пропілом, н-, і-, в- або трет.-бутилом, трифторметилом, метокси, етокси, н- або і-пропокси, дифторметокси, трифторметокси, метоксикарбонілом, етоксикарбонілом, н- або і-пропоксикарбонілом феніл, фенілкарбоніл, фенокси, феноксикарбоніл, фенілтіо, феніламіно, фенілгідрозино, нафтил, нафтилокси, нафтилтіо, нафтиламіно, фенілметил, фенілетил, фенілметокси, фенілетокси, фенілметилтіо, фенілетилтіо, фенілметиламіно, фенілетиламіно, нафтилметил, нафтилетил, нафтилметокси, нафтилетокси, нафтилметиламіно або нафтилетиламіно; або, відповідно, в разі необхідності, заміщений нітро, ціано, фтором, хлором, бромом, метилом, етилом, н- або і-пропілом, н-, і-, в- або трет.-бутилом, дифторметилом, трифторметилом, дихлорметилом, трихлорметилом, хлордифторметилом, фтордихлорметилом, метокси, етокси, н- або і-пропокси, н-, і-, в- або трет.-бутокси, дифторметокси, трифторметокси, метилтіо, етилтіо, н- або і-пропілтіо, н-, і-, в- або трет.-бутилтіо, дифторметилтіо, трифторметилтіо, метоксикарбонілом, етоксикарбонілом, н-

або і-пропоксикарбонілом моноциклічний або біциклічний гетероциклі, гетероциклілокси, гетероцикліламіно, гетероциклілалкіл, гетероциклілалкокси або гетероциклілалкіламіно з ряду фурил, фурилокси, фуриламіно, фурилметил, фурилметокси, фурилметиламіно, тієніл, тієнілметил, піролідініл, піролідініламіно, оксопіролідініл, піроліл, індоліл, піролілметил, піразоліл, піразолілокси, піразоліламіно, піразолілметил, імідазоліл, імідазолілметил, 2-оксо-1,3-діазациклопентил, оксазоліл, дигідрооксазоліл (оксазолініл), ізоксазоліл, дигідроізоксазоліл (ізоксазолініл), тетрагідроізоксазоліл (ізоксазолідініл), оксазолілметил, тіазоліл, дигідротіазоліл (тіазолініл), тетрагідротіазоліл (тіазолідініл), тіазолілметил, тіазолідініл, оксотіазолідініл, ціаноімінотіазолідініл, оксотіазолініл, оксотетразолініл, піперидиніл, піперидиніламіно, оксопіперидиніл, 2-оксо-1,3-діазациклогексил, 2-оксо-1-азациклогептил, 2-оксо-1,3-діазациклогептил, морфолініл, морфолініламіно, піперазиніл, піридиніл, піридинілокси, піридиніламіно, піридинілметил, піридинілметокси, піримідиніл, піримідинілокси, піримідинілметил, піримідинілметокси;

X означає водень, нітро, ціано, карбокси, карбамоїл, тіокарбамоїл, фтор, хлор, бром, йод; або, відповідно, в разі необхідності, заміщений ціано, фтором, хлором, метокси, етокси, метилтіо, етилтіо, метилсульфінілом, етилсульфінілом, метилсульфонілом або етилсульфонілом метил, етил, н- або і-пропіл, н-, і-, в- або трет.-бутил, метокси, етокси, н- або і-пропокси, н-, і-, в- або трет.-бутокси, метилтіо, етилтіо, н- або і-пропілтіо, н-, і-, в- або трет.-бутилтіо, метилсульфініл, етилсульфініл, н- або і-пропілсульфініл, метилсульфоніл, етилсульфоніл, н- або і-пропілсульфоніл, метиламіно, етиламіно, н- або і-пропіламіно, н-, і-, в- або трет.-бутиламіно, диметиламіно, діетиламіно, диметиламіносульфоніл або діетиламіносульфоніл, Y означає водень, нітро, ціано, карбокси, карбамоїл, тіокарбамоїл, фтор, хлор, бром, йод; або, відповідно, в разі необхідності, заміщений ціано, фтором, хлором, метокси, етокси, метилтіо, етилтіо, метилсульфінілом, етилсульфінілом, метилсульфонілом або етилсульфонілом метил, етил, н- або і-пропіл, н-, і-, в- або трет.-бутил, метокси, етокси, н- або і-пропокси, н-, і-, в- або трет.-бутокси, метилтіо, етилтіо, н- або і-пропілтіо, н-, і-, в- або трет.-бутилтіо, метилсульфініл, етилсульфініл, н- або і-пропілсульфініл, метилсульфоніл, етилсульфоніл, н- або і-пропілсульфоніл, метиламіно, етиламіно, н- або і-пропіламіно, н-, і-, в- або трет.-бутиламіно, диметиламіно, діетиламіно, диметиламіносульфоніл або діетиламіносульфоніл;

m означає число 0, 1 або 2;

R<sup>3</sup> означає водень або, відповідно, в разі необхідності, заміщений фтором та/або хлором метил або етил, R<sup>4</sup> означає гідрокси, R<sup>5</sup> означає водень, ціано, карбамоїл, тіокарбамоїл, фтор, хлор або бром; відповідно, в разі необхідності, заміщений ціано, фтором, хлором, метокси, етокси, н- або і-пропокси, метилтіо, етилтіо, н- або і-пропілтіо, метилсульфінілом, етилсульфінілом, метилсульфонілом або етилсульфонілом метил, етил, н- або і-пропіл, н-, і-, в- або трет.-бутил, метокси, етокси, н- або і-пропокси, метилтіо, етилтіо, н- або і-пропілтіо, метилсульфініл, етилсульфініл, метил-

сульфоніл, етилсульфоніл, метоксикарбоніл, етоксикарбоніл, н- або і-пропоксикарбоніл; або, відповідно, в разі необхідності, заміщений ціано, фтором, хлором, метилом або етилом циклопропіл, циклобутил, циклопентил або циклогексил;

R<sup>6</sup> означає водень, відповідно, в разі необхідності, заміщений ціано, фтором, хлором, метокси, етокси, н- або і-пропокси, метилтіо, етилтіо, н- або і-пропілтіо, метилсульфінілом, етилсульфінілом, метилсульфонілом або етилсульфонілом метил, етил, н- або і-пропіл, н-, і-, в- або трет.-бутил;

відповідно, в разі необхідності, заміщений ціано, фтором, хлором або бромом пропеніл, бутеніл, пропініл або бутиніл; відповідно, в разі необхідності, заміщений ціано, фтором, хлором, метилом або етилом циклопропіл, циклобутил, циклопентил, циклогексил, циклопропілметил, циклобутилметил, циклопентилметил або циклогексилметил; або, відповідно, в разі необхідності, заміщений нітро, ціано, фтором, хлором, бромом, метилом, етилом, н- або і-пропілом, н-, і-, в- або трет.-бутилом, трифторметилом, метокси, етокси, н- або і-пропокси, дифторметокси, трифторметокси, метилтіо, етилтіо, н- або і-пропілтіо, н-, і-, в- або трет.-бутилтіо, дифторметилтіо, трифторметилтіо, метилсульфінілом, етилсульфінілом, трифторметилсульфінілом, метилсульфонілом, етилсульфонілом або трифторметилсульфонілом феніл або фенілметил;

R<sup>7</sup> означає гідрокси, формілокси; відповідно, в разі необхідності, заміщений ціано, фтором, хлором, метокси, етокси, н- або і-пропокси метокси, етокси, н- або і-пропокси, ацетилокси, пропіонілокси, н- або і-бутироїлокси, метокси-карбонілокси, етоксикарбонілокси, н- або і-пропоксикарбонілокси, метиламінокарбонілокси, етиламінокарбонілокси, н- або і-пропіламінокарбонілокси, метилсульфонілокси, етилсульфонілокси, н- або і-пропілсульфонілокси;

відповідно, в разі необхідності, заміщений ціано, фтором, хлором або бромом пропенілокси, бутенілокси, пропінілокси або бутинілокси; або, відповідно, в разі необхідності, заміщений нітро, ціано, фтором, хлором, бромом, метилом, етилом, н- або і-пропілом, н-, і-, в- або трет.-бутилом, трифторметилом, метокси, етокси, н- або і-пропокси, дифторметокси, трифторметокси, метилтіо, етилтіо, н- або і-пропілтіо, дифторметилтіо, трифторметилтіо, метилсульфінілом, етилсульфінілом, трифторметилсульфінілом, метилсульфонілом, етилсульфонілом або трифторметилсульфонілом фенілметокси, фенілкарбонілокси, фенілкарбонілметокси або фенілсульфонілокси;

R<sup>8</sup> означає водень, ціано, карбамоїл, тіокарбамоїл, фтор, хлор або бром; або, відповідно, в разі необхідності, заміщений ціано, фтором, хлором, метокси, етокси, н- або і-пропоксиметил, етил, н- або і-пропіл, н-, і-, в- або трет.-бутил, ацетил, пропіоніл, н- або і-бутироїл, метокси, етокси, н- або і-пропокси, метоксикарбоніл, етоксикарбоніл, н- або і-пропоксикарбоніл, метилтіо, етилтіо, н- або і-пропілтіо, метилсульфініл, етилсульфініл, метилсульфоніл або етилсульфоніл;

R<sup>9</sup> означає водень; відповідно, в разі необхідності, заміщений ціано, фтором, хлором, метокси, етокси, н- або і-пропоксиметил, етил, н- або і-пропіл, н-

, і-, в- або трет.-бутил; або, відповідно, в разі необхідності, заміщений ціано, фтором, хлором, метилом або етилом циклопропіл, циклобутил, циклопентил або циклогексил;

$R^{10}$  означає водень; відповідно, в разі необхідності, заміщений ціано, фтором, хлором, метокси, етокси, н- або і-пропоксиметил, етил, н- або і-пропіл, н-, і-, в- або трет.-бутил; або, відповідно, в разі необхідності, заміщений ціано, фтором, хлором, метилом або етилом циклопропіл, циклобутил, циклопентил або циклогексил;

$R^{11}$  означає водень, ціано, карбамоїл, фтор, хлор або бром; або, відповідно, в разі необхідності, заміщений ціано, фтором, хлором, метокси, етокси, н- або і-пропоксиметил, етил, н- або і-пропіл, н-, і-, в- або трет.-бутил, метокси, етокси, н- або і-пропокси, метоксикарбоніл, етоксикарбоніл, н- або і-пропоксикарбоніл, метилтіо, етилтіо, н- або і-пропілтіо, метилсульфініл, етилсульфініл, метилсульфоніл або етилсульфоніл.

3. Сполуки формули (I) за п. 1, які відрізняються тим, що

$A^2$  означає метилен ( $-CH_2-$ ), етан-1,2-діл (диметилен,  $-CH_2CH_2-$ ) або пропан-1,3-діл ( $-CH_2CH_2CH_2-$ );  $R^1$  означає водень; відповідно, в разі необхідності, заміщений ціано, фтором, хлором, метокси, етокси, метилтіо, етилтіо, метилсульфініл, етилсульфініл, метилсульфоніл або етилсульфоніл метил, етил, н- або і-пропіл, н- або і-бутил; метокси, етокси, н- або і-пропокси, метилтіо, етилтіо, н- або і-пропілтіо, метиламіно, етиламіно, н- або і-пропіламіно; диметиламіно; відповідно, в разі необхідності, заміщений фтором та/або хлором пропеніл, бутеніл, етиніл, пропініл або бутиніл; відповідно, в разі необхідності, заміщений ціано, фтором, хлором або метилом циклопропіл, циклобутил, циклопентил, циклогексил, циклопропілметил, циклобутилметил, циклопентилметил або циклогексилметил; або, відповідно, в разі необхідності, заміщений нітро, ціано, фтором, хлором, бромом, метилом, етилом, н- або і-пропілом, н-, і-, в- або трет.-бутилом, трифторметилом, метокси, етокси, н- або і-пропокси, дифторметокси або трифторметокси феніл, фенілметил або фенілетил; або групу  $-C(Q)-R^2$ ;

$R^2$  означає водень, аміно, гідроксіаміно, гіdraзино; відповідно, в разі необхідності, заміщений 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, н-, і-, в- або трет.-бутил, метокси, етокси, н- або і-пропокси, метилтіо, етилтіо, н- або і-пропілтіо, метиламіно, етиламіно, н- або і-пропіламіно, метоксіаміно, етоксіаміно, н- або і-пропоксиаміно; диметиламіно; N-метилметоксіаміно;

диметилгіdraзино; відповідно, в разі необхідності, заміщений фтором та/або хлором етеніл, пропеніл, бутеніл, пропенілокси, бутенілокси, пропенілтіо, бутенілтіо, пропеніламіно, бутеніламіно, етиніл, пропініл, бутиніл, пропінілокси, бутинілокси, пропініламіно або бутиніламіно; відповідно, в разі необхідності, заміщений ціано, фтором, хлором або метилом циклопропіл, циклобутил, циклопентил, циклогексил, циклопропілметил, циклобутил-

метил, циклопентилметил або циклогексилметил; відповідно, в разі необхідності, заміщений нітро, ціано, фтором, хлором, бромом, метилом, етилом, н- або і-пропілом, н-, і-, в- або трет.-бутилом, трифторметилом, метокси, етокси, н- або і-пропокси, дифторметокси, трифторметокси, метоксикарбонілом, етоксикарбонілом, н- або і-пропоксикарбонілом феніл, феніламіно, фенілметил або фенілетил; або, відповідно, в разі необхідності, заміщений нітро, ціано, фтором, хлором, бромом, метилом, етилом, н- або і-пропілом, н-, і-, в- або трет.-бутилом, дифторметилом, трифторметилом, дихлорметилом, трихлорметилом, хлордифторметилом, фтордихлорметилом, метокси, етокси, н- або і-пропокси, дифториметокси, трифторметокси, метилтіо, етилтіо, н- або і-пропілтіо, дифторметилтіо, трифторметилтіо, метоксикарбонілом, етоксикарбонілом, н- або і-пропоксикарбонілом моноциклічний або біциклічний гетероциклі або гетероцикліалкіл з ряду фурил, фурилметил, тієніл, тієнілметил, піролідініл, оксопіролідініл, піроліл, піролілметил, піразоліл, піразолілметил, імідазоліл, імідазолілметил, 2-оксо-1,3-діазациклопентил, оксазоліл, ізоксазоліл, оксазолілметил, ізоксазолідініл, тіазоліл, тіазолілметил, піперидиніл, оксопіперидиніл, 2-оксо-1,3-діазаціклогексил, морфолініл, піперазиніл, піридиніл, піридинілметил, піримідиніл, піримідинілметил;

X означає водень, нітро, ціано, фтор, хлор, бром, йод, метил, етил, н- або і-пропіл, дифторметил, трифторметил, дихлорметил, трихлорметил, метоксиметил, метилтіометил, метилсульфінілметил, метилсульфонілметил, метокси, етокси, дифторметокси, трифторметокси, метилтіо, етилтіо, метилсульфініл, етилсульфініл, метилсульфоніл, етилсульфоніл або диметиламіносульфоніл;

Y означає водень, нітро, ціано, фтор, хлор, бром, йод, метил, етил, дифторметил, трифторметил, дихлорметил, трихлорметил, метоксиметил, метилтіометил, метилсульфінілметил, метилсульфонілметил, метокси, етокси, дифторметокси, трифторметокси, метилтіо, етилтіо, метилсульфініл, етилсульфініл, метилсульфоніл або диметиламіносульфоніл;

m означає число 0 або 1;

$R^3$  означає водень або, відповідно, в разі необхідності, заміщений фтором та/або хлором метил або етил,

$R^4$  означає гідрокси,

$R^5$  означає водень, ціано, фтор, хлор; відповідно, в разі необхідності, заміщений фтором та/або хлором 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, заміщений ціано, фтором, хлором або метилом циклопропіл;

$R^6$  означає водень; відповідно, в разі необхідності, заміщений ціано, фтором, хлором, метокси або етокси метил, етил, н- або і-пропіл, н-, і-, в- або трет.-бутил; відповідно, в разі необхідності, заміщений фтором або хлором пропеніл, бутеніл, пропініл або бутиніл; відповідно, в разі необхідності, заміщений фтором, хлором або метилом цикло-

ропіл, циклобутил, циклопентил або циклогексил; або, відповідно, в разі необхідності, заміщений фтором, хлором, бромом, метилом, етилом, н- або і-пропілом, трифторметилом, метокси, етокси, н- або і-пропокси, дифторметокси або трифторметокси феніл або фенілметил;

$R^7$  означає гідрокси; формілокси; відповідно, в разі необхідності, заміщений ціано, фтором, хлором, метокси, етокси, н- або і-пропокси 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, заміщений фтором та/або хлором пропенілокси, бутенілокси, пропінілокси або бутинілокси; або, відповідно, в разі необхідності, заміщений нітро, ціано, фтором, хлором, бромом, метилом, етилом, н- або і-пропілом, трифторметилом, метокси, етокси, н- або і-пропокси, дифторметокси або трифторметокси фенілметокси, фенілкарбонілокси, фенілкарбонілметокси або фенілсульфонілокси;

$R^8$  означає водень, ціано, фтор, хлор, бром; або, відповідно, в разі необхідності, заміщений фтором, хлором, метокси або етокси метил, етил, н- або і-пропіл, ацетил, пропіоніл, н- або і-бутироїл, метокси, етокси, н- або і-пропокси, метоксикарбоніл, етоксикарбоніл, н- або і-пропоксикарбоніл, метилтіо, етилтіо, н- або і-пропілтіо, метилсульфініл, етилсульфініл, метилсульфоніл або етилсульфоніл;

$R^9$  означає водень; відповідно, в разі необхідності, заміщений фтором, хлором, метокси або етокси метил, етил, н- або і-пропіл; або, відповідно, в разі необхідності, заміщений фтором, хлором або метилом циклопропіл,  $R^{10}$  означає водень; відповідно, в разі необхідності, заміщений фтором, хлором, метокси або етокси метил, етил, н- або і-пропіл; або, відповідно, в разі необхідності, заміщений фтором, хлором, метокси або етокси метил, етил, н- або і-пропіл, метокси, етокси, н- або і-пропокси, метоксикарбоніл, етоксикарбоніл, н- або і-пропоксикарбоніл, метилтіо, етилтіо, н- або і-пропілтіо, метилсульфініл, етилсульфініл, метилсульфоніл або етилсульфоніл.

4. Сполуки формули (I) за п. 1, які відрізняються тим, що

$R^1$  означає водень; відповідно, в разі необхідності, заміщений фтором, хлором, метокси або етокси метил, етил, н- або і-пропіл; метокси або етокси, або групу  $-C(Q)-R^2$ .

$R^2$  означає водень, аміно, гіdraзино; відповідно, в разі необхідності, заміщений фтором, хлором, метокси або етокси метил, етил або н-, або і-пропіл; метиламіно, етиламіно, н- або і-пропіламіно або диметиламіно; відповідно, в разі необхідності, заміщений фтором, хлором метилом циклопропіл, циклобутил, циклопентил або циклогексил; відповідно, в разі необхідності, заміщений нітро, ціано, фтором, хлором, бромом, метилом, етилом або н-

або і-пропілом, метокси, етокси, н- або і-пропокси феніл, феніламіно, фенілметил або фенілетил; або, відповідно, в разі необхідності, заміщений нітро, ціано, фтором, хлором, бромом, метилом, етилом, дифторметилом, трифторметилом, дихлорметилом, трихлорметилом, хлордифторметилом, фтордихлорметилом, метокси, етокси, метилтіо, етилтіо, дифторметилтіо, трифторметилтіо, метоксикарбонілом або етоксикарбонілом фурил, фурилметил, тієніл, тієнілметил, піроліл або піролілметил;

$X$  означає водень, нітро, фтор, хлор, бром, метил, етил або трифторметил;

$Y$  означає водень, нітро, ціано, фтор, хлор, бром, йод, метил, етил, дифторметил, трифторметил, дихлорметил, трихлорметил, метоксиметил, метилтіометил, метилсульфінілметил, метилсульфонілметил, метокси, етокси, дифторметокси, трифторметокси, метилтіо, етилтіо, метилсульфініл, етилсульфініл, метилсульфоніл, етилсульфоніл або диметиламіносальфоніл;

$R^3$  означає водень або, відповідно, в разі необхідності, заміщений фтором та/або хлором метил або етил;

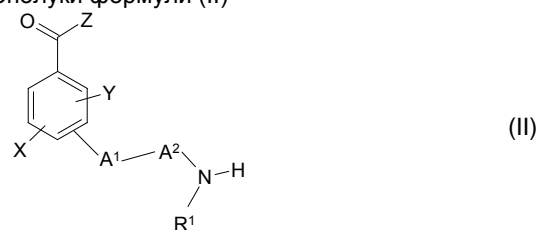
$R^4$  означає гідрокси;

$R^5$  означає водень, фтор, хлор або, відповідно, в разі необхідності, заміщений фтором та/або хлором метил, етил, метокси або етокси;

$R^6$  означає водень або, відповідно, в разі необхідності, заміщений фтором, хлором, метокси або етокси метил, етил, н- або і-пропіл, або н-, і-, в- або трет.-бутил;

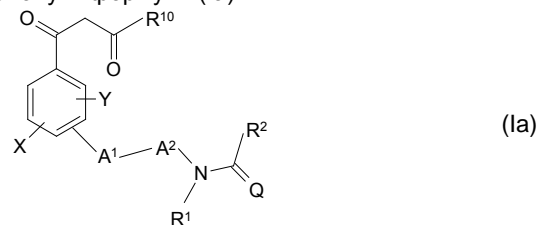
$R^7$  означає гідрокси; відповідно, в разі необхідності, заміщений фтором або хлором метокси або етокси; або, в разі необхідності, заміщений нітро, ціано, фтором, хлором, бромом, метилом, етилом, трифторметилом, метокси або етокси фенілметокси.

5. Сполуки формули (II)



в якій  $A^1$ ,  $A^2$ ,  $R^1$ ,  $X$ ,  $Y$  та  $Z$  мають вказані в п. 1 значення.

6. Сполуки формули (Ia)



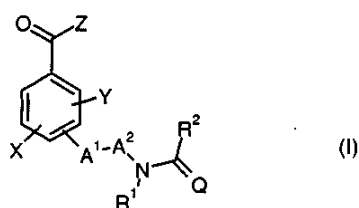
в якій  $A^1$ ,  $A^2$ ,  $Q$ ,  $R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^{10}$ ,  $X$  та  $Y$  мають вказані в п. 1 значення.

7. Гербіцидний засіб, який відрізняється тим, що містить щонайменше одну сполуку за одним з пп. 1-4 та звичайні наповнювачі.

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

Відомо, що певні заміщені арилкетони проявляють гербіцидні властивості [див. EP-A-090262, EP-A-135191, EP-A-186118, EP-A-186119, EP-A-186120, EP-A-319075, EP-A-352543, EP-A-418175, EP-A-487357, EP-A-527036, EP-A-527037, EP-A-560483, EP-A-609797, EP-A-609798, EP-A-625505, EP-A-625508, EP-A-636622, US-A-5804532, US-A-5834402, US-A-5846906, US-A-5863865, WO-A-95/31466, WO-A-96/26192, WO-A-96/26193, WO-A-96/26200, WO-A-96/26206, WO-A-97/27187, WO-A-97/35850, WO-A-97/41105, WO-A-97/41116, WO-A-97/41117, WO-A-97/41118, WO-A-97/43270, WO-A-97/46530, WO-A-98/28981, WO-A-98/31681, WO-A-98/31682, WO-A-99/03856, WO-A-99/07688, WO-A-99/07697, WO-A-99/10327, WO-A-99/10328, WO-A-00/05221 та передусім WO-A-00/21924]. Хоча ефективність цих сполук не в усіх випадках є задовільною.

Вже були описані нові заміщені арилкетони формули (I)



в якій

A¹ означає простий зв'язок або O (кисень), S (сірку), SO або SO₂,

A² означає алкандиїл (алкілен), алкендиїл або алкіндиїл,

Q означає O (кисень) або S (сірку),

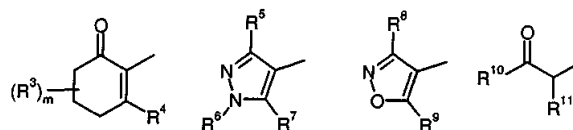
R¹ означає водень або відповідно, в разі необхідності, заміщений алкіл, алкокси, алкілтіо, алкілсульфініл, алкілсульфоніл, алкіламіно, діалкіламіно, алкеніл, алкініл, циклоалкіл, циклоалкілалкіл, арил або арилалкіл, або групу -C(Q)-R²,

R² означає водень, аміно, ціаноаміно, нітроаміно, гідроксиаміно, гіdraзино, або відповідно, в разі необхідності, заміщений алкіл, алкілкарбоніл, алкокси, алкоксикарбоніл, алкілтіо, алкіламіно, діалкіламіно, алкоксиаміно, N-алкілалкоксиаміно, алкілгіdraзино, діалкілгіdraзино, алкеніл, алкенілокси, алкеніламіно, алкенілоксиаміно, алкініл, алкінілокси, алкініламіно, циклоалкіл, циклоалкілокси, циклоалкіламіно, циклоалкілалкіл, циклоалкілалкокси, циклоалкілалкіламіно, арил, арилкарбоніл, арилокси, арилоксикарбоніл, арилтіо, ариламіно, арилгіdraзино, арилалкіл, арилалкокси, арилалкілтіо, арилалкіламіно, гетероцикліл, гетероциклілокси, гетероциклілтіо, гетероцикліламіно, гетероциклілалкіл, гетероциклілалкокси, гетероциклілалкілтіо або гетероциклілалкіламіно,

X означає водень, нітро, ціано, карбокси, карбамоїл, тіокарбамоїл, галоген, або відповідно, в разі необхідності, заміщений алкіл, алкокси, алкіл-

тіо, алкілсульфініл, алкілсульфоніл, алкіламіно, діалкіламіно або діалкіламіносульфоніл,

Y означає водень, нітро, ціано, карбокси, карбамоїл, тіокарбамоїл, галоген, або відповідно, в разі необхідності, заміщений алкіл, алкокси, алкілтіо, алкілсульфініл, алкілсульфоніл, алкіламіно, діалкіламіно або діалкіламіносульфоніл, та Z означає одну з наведених нижче груп



причому

m означає число від 0 до 6,

R³ означає водень, галоген або відповідно, в разі необхідності, заміщений алкіл, алкілтіо або арил, або - у випадку, якщо m означає 2 - в разі необхідності, також разом з другим залишком R³ означає кисень або алкандиїл (алкілен),

R⁴ означає гідрокси, формілокси, галоген, або, в разі необхідності, заміщений алкокси, алкілтіо, алкілсульфініл, алкілсульфоніл, алкілкарбонілокси, алкоксикарбонілокси, алкіламінокарбонілокси, алкілсульфонілокси, алкенілокси, алкінілокси, арилокси, арилтіо, арилсульфініл, арилсульфоніл, арилкарбонілокси, арилкарбонілалкокси, арилсульфонілокси, арилалкокси, арилалкілтіо, арилалкілсульфініл або арилалкілсульфоніл,

R⁵ означає водень, ціано, карбамоїл, тіокарбамоїл, галоген, або, в разі необхідності, заміщений алкіл, алкокси, алкілтіо, алкілсульфініл, алкілсульфоніл, алкоксикарбоніл або циклоалкіл,

R⁶ означає водень або відповідно, в разі необхідності, заміщений алкіл, алкеніл, алкініл, циклоалкіл, циклоалкілалкіл, арил або арилалкіл,

R⁷ означає гідрокси, формілокси, або відповідно, в разі необхідності, заміщений алкокси, алкілкарбонілокси, алкоксикарбонілокси, алкіламінокарбонілокси, алкілсульфонілокси, алкенілокси, алкінілокси, арилалкокси, арилкарбонілокси, арилкарбонілалкокси або арилсульфонілокси,

R⁸ означає водень, ціано, карбамоїл, тіокарбамоїл, галоген, або відповідно, в разі необхідності, заміщений алкіл, алкілкарбоніл, алкокси, алкоксикарбоніл, алкілтіо, алкілсульфініл або алкілсульфоніл,

R⁹ означає водень або відповідно, в разі необхідності, заміщений алкіл або циклоалкіл,

R¹⁰ означає водень або відповідно, в разі необхідності заміщений, алкіл або циклоалкіл, та

R¹¹ означає водень, ціано, карбамоїл, галоген, або відповідно, в разі необхідності, заміщений алкіл, алкокси, алкоксикарбоніл, алкілтіо, алкілсульфініл або алкілсульфоніл. Залишок X знаходиться переважно в положенні (2) фенільного кільця. У визначеннях вуглеводневі ланцюги, такі як алкіл або алкандиїл - також у зв'язку з гетероатомами, такими як алкокси - є відповідно нерозгалуженими або розгалуженими.

Якщо сполуки загальної формули (I) можуть

існувати у різних стереоізомерних формах, то вирахід охоплює також можливі стереоізомерні форми.

Переважні замісники або переважні області значень згаданих вище та нижче залишків наведені нижче.

A<sup>1</sup> означає переважно O або простий зв'язок.

A<sup>2</sup> означає переважно алкандиїл (алкілен), алкендиїл або алкіндиїл, що містить відповідно до 6 атомів вуглецю.

Q означає переважно O (кисень).

R<sup>1</sup> означає переважно водень, відповідно, в разі необхідності, заміщений ціано, галогеном, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкокси, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкілтію, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкілсульфінілом або C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкілсульфонілом алкіл, алкокси, алкілтію, алкілсульфініл, алкілсульфоніл або алкіламіно, які в алкільних групах містять відповідно 1-6 атомів вуглецю, діалкіламіно, які в алкільних групах містять переважно 1-4 атоми вуглецю, відповідно, в разі необхідності, заміщений ціано або галогеном алкеніл або алкініл, що містять відповідно 2-6 атомів вуглецю, відповідно, в разі необхідності, заміщений ціано, галогеном або C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкілом циклоалкіл або циклоалкілалкіл, які в циклоалкільній групі містять відповідно 3-6 атомів вуглецю, а в алкільній частині - 1-4 атоми вуглецю, відповідно, в разі необхідності, заміщений нітро, ціано, галогеном, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкілом, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-галогеналкілом, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкокси або C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-галогеналкокси арил або арилалкіл, які в арильній групі містять відповідно 6 або 10 атомів вуглецю, а в алкільній частині - 1-4 атоми вуглецю, або групу -C(Q)-R<sup>2</sup>.

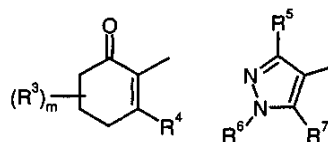
R<sup>2</sup> означає переважно водень, аміно, ціаноаміно, нітроаміно, гідроксиаміно, гідразино, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкілкарбоніл, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкоксикарбоніл, відповідно, в разі необхідності, заміщений ціано, галогеном, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкокси, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкілтію, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкілсульфінілом або C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкілсульфонілом алкіл, алкокси, алкілтію, алкіламіно, алкоксиаміно або алкілгідразино, які в алкільних групах містять відповідно 1-6 атомів вуглецю, діалкіламіно, N-алкілалкоксиаміно або діалкілгідразино, які в алкільних групах містять відповідно 1-4 атоми вуглецю, відповідно, в разі необхідності, заміщений галогеном алкеніл, алкенілокси, алкеніламіно, алкенілоксиаміно, алкініл, алкінілокси або алкініламіно, які містять відповідно 2-6 атомів вуглецю, відповідно, в разі необхідності, заміщені ціано, галогеном або C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкілом циклоалкіл, циклоалкілокси, циклоалкіламіно, циклоалкілалкіл, циклоалкілалкокси або циклоалкілалкіламіно, які в циклоалкільній групі містять відповідно 3-6 атомів вуглецю, а в алкільній частині відповідно 1-4 атомам вуглецю, відповідно, в разі необхідності, заміщений нітро, ціано, галогеном, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкілом, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-галогеналкілом, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкокси, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-галогеналкокси або C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкоксикарбонілом арил, арилкарбоніл, арилокси, арилоксикарбоніл, арилтію, ариламіно, арилгідразино, арилалкіл, арилалкокси, арилалкілтію або арилалкіламіно, які в арильній групі містять відповідно 6 або 10 атомів вуглецю, а в алкільній частині, в разі необхідності, містять 1-4 атоми вуглецю, або відповідно, в разі необхідності, заміщений нітро, ціано, галогеном, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкілом, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-галогеналкілом, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкокси, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-галогеналкокси, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкілтію, C<sub>1</sub>-

C<sub>4</sub>-галогеналкілтію або C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкоксикарбонілом моноциклічний або біциклічний гетероцикліл, гетероциклілокси, гетероциклілтію, гетероцикліламіно, гетероциклілалкіл, гетероциклілалкокси, гетероциклілалкілтію або гетероциклілалкіламіно, причому гетероциклільна група містить відповідно до 10 атомів вуглецю та додатково щонайменше один гетеро атом, вибраний з ряду азот (N) (щонайбільше 5 N-атомів), кисень (O) (щонайбільше 2 O-атоми), сірка (S) (щонайбільше 2 S-атоми), SO або SO<sub>2</sub>, а також, в разі необхідності, додатково означають групу, вибрану з оксо (C=O), тіоксо (C=S), іміно (C=NH), ціаноіміно (C=N-CN), нітроіміно (C=N-NO<sub>2</sub>).

X означає переважно водень, нітро, ціано, карбокси, карбамоїл, тіокарбамоїл, галоген, або відповідно, в разі необхідності, заміщений ціано, галогеном, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкокси, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкілтію, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкілсульфінілом або C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкілсульфонілом алкіл, алкокси, алкілтію, алкілсульфініл, алкілсульфоніл, алкіламіно, діалкіламіно або діалкіламіносульфоніл, які в алкільних групах містять відповідно 1-6 атомів вуглецю.

Y означає переважно водень, нітро, ціано, карбокси, карбамоїл, тіокарбамоїл, галоген, або відповідно, в разі необхідності, заміщений ціано, галогеном, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкокси, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкілтію, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкілсульфінілом або C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкілсульфонілом алкіл, алкокси, алкілтію, алкілсульфініл, алкілсульфоніл, алкіламіно, діалкіламіно або діалкіламіносульфоніл, які в алкільних групах містять відповідно 1-6 атомів вуглецю.

Z означає переважно одну з наведених нижче груп



m означає переважно число від 0 до 3.

R<sup>3</sup> означає переважно водень, галоген, відповідно в разі необхідності заміщений ціано, галогеном, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкокси, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкілтію, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкілсульфінілом або C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкілсульфонілом алкіл або алкілтію, які містять відповідно 1-6 атомів вуглецю, або феніл, або - у випадку, якщо m означає 2, - в разі необхідності, також разом з другим залишком R<sup>3</sup> означає кисень або алкандиїл (алкілен), що містить 3-5 атомів вуглецю.

R<sup>4</sup> означає переважно гідрокси, формілокси, галоген, відповідно, в разі необхідності, заміщений ціано, галогеном, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкокси, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкілтію, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкілсульфінілом або C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкілсульфонілом алкокси, алкілтію, алкілсульфініл, алкілсульфоніл, алкілкарбонілокси, алкоксикарбонілокси, алкіламінокарбонілокси або алкілсульфонілокси, які містять відповідно 1-6 атомів вуглецю, відповідно, в разі необхідності, заміщений галогеном алкенілокси або алкінілокси, що містять відповідно 3-6 атомів вуглецю, відповідно, в разі необхідності, заміщений нітро, ціано, галогеном, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкілом, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-галогеналкілом, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкокси, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-галогеналкокси, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкілтію, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-галогеналкілтію, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкілсульфінілом, C<sub>1</sub>-



галогеналкілсульфінілом,  $C_1$ - $C_4$ -алкілсульфонілом або  $C_1$ - $C_4$ -галогеналкілсульфонілом арилокси, арилтію, арилсульфініл, арилсульфоніл, арилкарбонілокси, арилкарбоніалкокси, арилсульфонілокси, арилалкокси, арилалкілтію, арилалкілсульфініл або арилалкілсульфоніл, які в арильній групі містять відповідно 6 або 10 атомів вуглецю, а в алкільній частині, в разі необхідності, містять 1-4 атоми вуглецю.

$R^5$  означає переважно водень, ціано, карбамоїл, тіокарбамоїл, галоген, 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 алкіл, алкокси, алкілтію, алкілсульфініл, алкілсульфоніл або алкоксикарбоніл, які в алкільних групах містять відповідно 1-6 атомів вуглецю, або, в разі необхідності, заміщений ціано, галогеном або  $C_1$ - $C_4$ -алкілом циклоалкіл, що містить 3-6 атомів вуглецю.

$R^6$  означає переважно водень, 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 алкіл, що містить 1-6 атомів вуглецю, відповідно, в разі необхідності, заміщений ціано або галогеном алкеніл або алкініл, що містять відповідно 3-6 атомів вуглецю, відповідно, в разі необхідності, заміщений ціано, галогеном або  $C_1$ - $C_4$ -алкілом циклоалкіл або циклоалкілалкіл, які в циклоалкільній групі містять відповідно 3-6 атомів вуглецю, а в алкільній частині, в разі необхідності, містять 1-4 атоми вуглецю, або відповідно, в разі необхідності, заміщений нітро, ціано, галогеном,  $C_1$ - $C_4$ -алкілом,  $C_1$ - $C_4$ -галогеналкілом,  $C_1$ - $C_4$ -алкокси,  $C_1$ - $C_4$ -галогеналкокси,  $C_1$ - $C_4$ -алкілтію,  $C_1$ - $C_4$ -галогеналкілтію,  $C_1$ - $C_4$ -алкілсульфінілом,  $C_1$ - $C_4$ -галогеналкілсульфінілом,  $C_1$ - $C_4$ -алкілсульфонілом або  $C_1$ - $C_4$ -галогеналкілсульфонілом арил або арилалкіл, які в арильній групі містять відповідно 6 або 10 атомів вуглецю, а в алкільній частині, в разі необхідності, містять 1-4 атоми вуглецю.

$R^7$  означає переважно гідрокси, формілокси, відповідно, в разі необхідності, заміщений ціано, галогеном або  $C_1$ - $C_4$ -алкокси алкокси, алкілкарбонілокси, алкоксикарбонілокси, алкіламінокарбонілокси або алкілсульфонілокси, які в алкільних групах містять відповідно 1-6 атомів вуглецю, відповідно, в разі необхідності, заміщений ціано або галогеном алкенілокси або алкінілокси, які містять відповідно 3-6 атомів вуглецю, або відповідно, в разі необхідності, заміщений нітро, ціано, галогеном,  $C_1$ - $C_4$ -алкілом,  $C_1$ - $C_4$ -галогеналкілом,  $C_1$ - $C_4$ -алкокси,  $C_1$ - $C_4$ -галогеналкокси,  $C_1$ - $C_4$ -алкілтію,  $C_1$ - $C_4$ -галогеналкілтію,  $C_1$ - $C_4$ -алкілсульфінілом,  $C_1$ - $C_4$ -галогеналкілсульфінілом,  $C_1$ - $C_4$ -алкілсульфонілом або  $C_1$ - $C_4$ -галогеналкілсульфонілом арилалкокси, арилкарбонілокси, арилкарбоніалкокси або арилсульфонілокси, які в арильній групі містять відповідно 6 або 10 атомів вуглецю, а в алкільній частині, в разі необхідності, містять 1-4 атоми вуглецю.

$R^8$  означає переважно водень, ціано, карбамоїл, тіокарбамоїл, галоген, або відповідно, в разі необхідності, заміщений ціано, галогеном або  $C_1$ - $C_4$ -алкокси алкіл, алкілкарбоніл, алкокси, алкоксикарбоніл, алкілтію, алкілсульфініл або алкілсуль-

фоніл, які в алкільних групах містять відповідно 1-6 атомів вуглецю.

$R^9$  означає переважно водень, в разі необхідності, заміщений ціано, галогеном або  $C_1$ - $C_4$ -алкокси алкіл, або, в разі необхідності, заміщений ціано, галогеном або  $C_1$ - $C_4$ -алкілом циклоалкіл, який містить 3-6 атомів вуглецю.

$R^{10}$  означає переважно водень, в разі необхідності, заміщений ціано, галогеном або  $C_1$ - $C_4$ -алкокси алкіл, або, в разі необхідності, заміщений ціано, галогеном або  $C_1$ - $C_4$ -алкілом циклоалкіл, що містить 3-6 атомів вуглецю.

$R^{11}$  означає переважно водень, ціано, карбамоїл, галоген, або, в разі необхідності, заміщений ціано, галогеном або  $C_1$ - $C_4$ -алкокси алкіл, алкокси, алкоксикарбоніл, алкілтію, алкілсульфініл або алкілсульфоніл, які в алкільних групах містять відповідно 1-6 атомів вуглецю.

$A^2$  означає особливо переважно метилен ( $-CH_2-$ ), етан-1,1-диіл ( $-CH(CH_3)-$ ), етан-1,2-диіл (диметилен,  $-CH_2CH_2-$ ), пропан-1,1-диіл ( $-CH(C_2H_5)-$ ), пропан-1,2-диіл ( $-CH(CH_3)CH_2-$ ), пропан-1,3-диіл ( $-CH_2CH_2CH_2-$ ), бутан-1,3-диіл ( $-CH(CH_3)CH_2CH_2-$ ), бутан-1,4-диіл ( $-CH_2CH_2CH_2CH_2-$ ), етендиіл, пропендиіл, бутендиіл, етиндиіл, пропіндиіл або бутіндиіл.

$R^1$  означає особливо переважно водень, відповідно, в разі необхідності, заміщений ціано, фтором, хлором, бромом, метокси, етокси,  $n$ - або  $i$ -пропокси, метилтію, етилтію,  $n$ - або  $i$ -пропілтію, метилсульфінілом, етилсульфініл,  $n$ - або  $i$ -пропілсульфінілом, метилсульфонілом або етилсульфонілом метил, етил,  $n$ - або  $i$ -пропіл,  $n$ -,  $i$ -,  $v$ - або трет.-бутил,  $n$ -,  $i$ -,  $v$ - або трет.-пентил, метокси, етокси,  $n$ - або  $i$ -пропокси,  $n$ -,  $i$ -,  $v$ - або трет.-бутокс, метилтію, етилтію,  $n$ - або  $i$ -пропілтію,  $n$ -,  $i$ -,  $v$ - або трет.-бутилтію, метилсульфініл, етилсульфініл,  $n$ - або  $i$ -пропілсульфініл, метилсульфоніл, етилсульфоніл, метиламіно, етиламіно,  $n$ - або  $i$ -пропіламіно,  $n$ -,  $i$ -,  $v$ - або трет.-бутиламіно; диметиламіно або діетиламіно; відповідно, в разі необхідності, заміщений фтором, хлором та/або бромом етеніл, пропеніл, бутеніл, пентеніл, етиніл, пропініл, бутиніл або пентиніл; відповідно, в разі необхідності, заміщений ціано, фтором, хлором, бромом, метилом, етилом або пропілом циклопропіл, циклобутил, циклопентил, циклогексил, циклопропілметил, циклобутилметил, циклопентилметил або циклогексилметил; або відповідно, в разі необхідності, заміщений нітро, ціано, фтором, хлором, бромом, метилом, етилом,  $n$ - або  $i$ -пропілом,  $n$ -,  $i$ -,  $v$ - або трет.-бутилом, трифторметилом, метокси, етокси,  $n$ - або  $i$ -пропокси, дифторметокси або трифторметокси феніл, нафтил, фенілметил, фенілетил, нафтилметил або нафтілетил; або групу  $-C(Q)-R^2$ .

$R^2$  означає особливо переважно водень, аміно, ціаноаміно, нітроаміно, гідроксиаміно, гідразино; відповідно, в разі необхідності, заміщений ціано, фтором, хлором, метокси, етокси,  $n$ - або  $i$ -пропокси, метилтію, етилтію,  $n$ - або  $i$ -пропілтію, метилсульфінілом, етилсульфінілом,  $n$ - або  $i$ -пропілсульфінілом, метилсульфонілом або етилсульфонілом метил, етил,  $n$ - або  $i$ -пропіл,  $n$ -,  $i$ -,  $v$ - або трет.-бутил,  $n$ -,  $i$ -,  $v$ - або трет.-пентил, метокси, етокси,  $n$ - або  $i$ -пропокси,  $n$ -,  $i$ -,  $v$ - або трет.-

бутокс, метилтію, етилтію, н- або і-пропілтію, н-, і-, в- або трет.-бутилтію, метиламіно, етиламіно, н- або і-пропіламіно, н-, і-, в- або трет.-бутиламіно, метоксиаміно, етоксиаміно, н- або і-пропоксиаміно, н-, і-, в- або трет.-бутоксиаміно, метилгідразино, етилгідразино, н- або і-пропілгідразино, н-, і-, в- або трет.-бутилгідразино; диметиламіно, діетиламіно, N-метилметоксиаміно, диметилгідразино або діетилгідразино; відповідно, в разі необхідності, заміщений фтором, хлором та/або бромом етеніл, пропеніл, бутеніл, пентеніл, етиніл, пропініл, бутиніл, пентиніл, пропенілокси, бутенілокси, пентенілокси, пропеніламіно, бутеніламіно, пентеніламіно, пропенілоксиаміно, бутенілоксиаміно, пентенілоксиаміно, етиніл, пропініл, бутиніл, пентиніл, пропінілокси, бутинілокси, пентинілокси, пропініламіно, бутиніламіно або пентиніламіно; відповідно, в разі необхідності, заміщений ціано, фтором, хлором, бромом, метилом, етилом або пропілом циклопропіл, циклобутил, циклопентил, циклогексил, циклопропілокси, циклобутилокси, циклопентилокси, циклогексилокси, циклопропіламіно, циклобутиламіно, циклопентиламіно, циклогексиламіно, циклопропілметил, циклобутилметил, циклопентилметил, циклогексилметил, циклопропілметокси, циклобутилметокси, циклопентилметокси, циклогексилметокси, циклопропілметиламіно, циклобутилметиламіно, циклопентилметиламіно або циклогексилметиламіно; відповідно, в разі необхідності, заміщений нітро, ціано, фтором, хлором, бромом, метилом, етилом, н- або і-пропілом, н-, і-, в- або трет.-бутилом, трифторметилом, метокси, етокси, н- або і-пропокси, дифторметокси, трифторметокси, метоксикарбонілом, етоксикарбонілом, н- або і-пропоксикарбонілом, феніл, фенілкарбоніл, фенокси, феноксикарбоніл, фенілтію, феніламіно, фенілгідразино, нафтил, нафтилокси, нафтилтію, нафтиламіно, фенілметил, фенілетил, фенілметокси, фенілетокси, фенілметилтію, фенілетилтію, фенілметиламіно, фенілетиламіно, нафтилметил, нафтілетил, нафтилметокси, нафтілетокси, нафтилметиламіно або нафтілетиламіно; або відповідно, в разі необхідності, заміщений нітро, ціано, фтором, хлором, бромом, метилом, етилом, н- або і-пропілом, н-, і-, в- або трет.-бутилом, дифторметил, трифторметилом, дихлорметилом, трихлорметилом, хлордифторметилом, фтордихлорметилом, метокси, етокси, н- або і-пропокси, н-, і-, в- або трет.-бутокс, дифторметокси, трифторметокси, метилтію, етилтію, н- або і-пропілтію, н-, і-, в- або трет.-бутилтію, дифторметилтію, трифторметилтію, метоксикарбонілом, етоксикарбонілом, н- або і-пропоксикарбонілом моноциклічний або біциклічний гетероцикліл, гетероциклілокси, гетероцикліламіно, гетероциклілалкіл, гетероциклілалкокси або гетероциклілалкіламіно з ряду фурил, фурилокси, фуриламіно, фурилметил, фурилметокси, фурилметиламіно, тіеніл, тіенілметил, піролідиніл, піролідиніламіно, оксопіролідиніл, піроліл, індоліл, піролілметил, піразоліл, піразолілокси, піразоліламіно, піразолілметил, імідазоліл, імідазолілметил, 2-оксо-1,3-діазациклопентил, оксазоліл, дигідрооксазоліл (оксазолініл), ізоксазоліл, дигідроізоксазоліл (ізоксазолініл), тетрагідроізоксазоліл (ізоксазо-

лідиніл), оксазоліл метил, тіазоліл, дигідротіазоліл (тіазолініл), тетрагідротіазоліл (тіазолідиніл), тіазолілметил, тіазолідиніл, оксотіазолідиніл, ціаноімінотіазолідиніл, оксотіазолініл, оксотетразолініл, піперидиніл, піперидиніламіно, оксопіперидиніл, 2-оксо-1,3-діазациклогексил, 2-оксо-1-азациклогептил, 2-оксо-1,3-діазациклогептил, морфолініл, морфолініламіно, піперазиніл, піридиніл, піридинілокси, піридиніламіно, піридинілметил, піридинілметокси, піримідиніл, піримідинілокси, піримідинілметил, піримідинілметокси.

X означає особливо переважно водень, нітро, ціано, карбокси, карбамоїл, тіокарбамоїл, фтор, хлор, бром, йод; або відповідно, в разі необхідності, заміщений ціано, фтором, хлором, метокси, етокси, метилтію, етилтію, метилсульфінілом, етилсульфінілом, метилсульфонілом або етилсульфонілом метил, етил, н- або і-пропіл, н-, і-, в- або трет.-бутил, метокси, етокси, н- або і-пропокси, н-, і-, в- або трет.-бутокс, метилтію, етилтію, н-або і-пропілтію, н-, і-, в- або трет.-бутилтію, метилсульфініл, етилсульфініл, н- або і-пропілсульфініл, метилсульфоніл, етилсульфоніл, н- або і-пропілсульфоніл, метиламіно, етиламіно, н- або і-пропіламіно, н-, і-, в- або трет.-бутиламіно, диметиламіно, діетиламіно, диметиламіносульфоніл або діетиламіносульфоніл.

Y означає особливо переважно водень, нітро, ціано, карбокси, карбамоїл, тіокарбамоїл, фтор, хлор, бром, йод; або відповідно, в разі необхідності, заміщений ціано, фтором, хлором, метокси, етокси, метилтію, етилтію, метилсульфінілом, етилсульфінілом, метилсульфонілом або етилсульфонілом метил, етил, н- або і-пропіл, н-, і-, в- або трет.-бутил, метокси, етокси, н- або і-пропокси, н-, і-, в-або трет.-бутокс, метилтію, етилтію, н-або і-пропілтію, н-, і-, в- або трет.-бутилтію, метилсульфініл, етилсульфініл, н- або і-пропілсульфініл, метилсульфоніл, етилсульфоніл, н- або і-пропілсульфоніл, метиламіно, етиламіно, н- або і-пропіламіно, н-, і-, в- або трет.-бутиламіно, диметиламіно, діетиламіно, диметиламіносульфоніл або діетиламіносульфоніл. m означає особливо переважно число 0, 1 або 2.

R<sup>3</sup> означає особливо переважно водень, фтор, хлор або бром; відповідно, в разі необхідності, заміщений ціано, фтором, хлором, метокси, етокси, н- або і-пропокси, метилтію, етилтію, н- або і-пропілтію, метилсульфінілом, етилсульфінілом, метилсульфонілом або етилсульфонілом метил, етил, н- або і-пропіл, н-, і-, в- або трет.-бутил, метилтію, етилтію, н- або і-пропілтію, н-, і-, в- або трет.-бутилтію; або феніл; або якщо m означає 2 - в разі необхідності, разом із другим залишком R<sup>3</sup> означає кисень, пропан-1,3-дііл або бутан-1,4-дііл.

R<sup>4</sup> означає особливо переважно гідрокси, формілокси, фтор або хлор, відповідно, в разі необхідності, заміщений ціано, 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, метилсульфініл, етилсульфініл, метилсульфоніл, етилсульфоніл, ацетилокси, пропіонілокси, н- або і-бутироїлокси,



тиламіно; відповідно, в разі необхідності, заміщений фтором та/або хлором пропеніл, бутеніл, етиніл, пропініл або бутиніл; відповідно, в разі необхідності, заміщений ціано, фтором, хлором або метилом циклопропіл, циклобутил, циклопентил, циклогексил, циклопропілметил, циклобутилметил, циклопентилметил або циклогексилметил; або відповідно, в разі необхідності, заміщений нітро, ціано, фтором, хлором, бромом, метилом, етилом, н- або і-пропілом, н-, і-, в- або трет.-бутилом, трифторметилом, метокси, етокси, н- або і-пропокси, дифторметокси або трифторметокси феніл, фенілметил або фенілетил; або групу  $-C(Q)-R^2$ .

$R^2$  означає найбільш переважно водень, аміно, гідроксиаміно, гіdraзино; відповідно, в разі необхідності, заміщений ціано, фтором, хлором, метокси, етокси, н- або і-пропокси, метилтіо, етилтіо, н- або і-пропілтіо, метилсульфінілом, етилсульфінілом, метилсульфонілом або етилсульфонілом метил, етил, н- або і-пропіл, н-, і-, в- або трет.-бутил, метокси, етокси, н- або і-пропокси, метилтіо, етилтіо, н- або і-пропілло, метиламіно, етиламіно, н- або і-пропіламіно, метоксиаміно, етоксиаміно, н- або і-пропоксиаміно; диметиламіно; N-метилметоксиаміно; диметилгіdraзино; відповідно, в разі необхідності, заміщений фтором та/або хлором етеніл, пропеніл, бутеніл, пропенілокси, бутенілокси, пропенілтіо, бутенілтіо, пропеніламіно, бутеніламіно, етиніл, пропініл, бутиніл, пропінілокси, бутинілокси, пропініламіно або бутиніламіно; відповідно, в разі необхідності, заміщений ціано, фтором, хлором або метилом циклопропіл, циклобутил, циклопентил, циклогексил, циклопропілметил, циклобутилметил, циклопентилметил або циклогексилметил; відповідно, в разі необхідності, заміщений нітро, ціано, фтором, хлором, бромом, метилом, етилом, н- або і-пропілом, н-, і-, в- або трет.-бутилом, трифторметилом, метокси, етокси, н- або і-пропокси, дифторметокси, трифторметокси, метоксикарбонілом, етоксикарбонілом, н- або і-пропоксикарбонілом феніл, феніламіно, фенілметил або фенілетил; або відповідно, в разі необхідності, заміщений нітро, ціано, фтором, хлором, бромом, метилом, етилом, н- або і-пропілом, н-, і-, в- або трет.-бутилол, дифторметилом, трифторметилом, дихлорметилом, трихлорметилом, хлордифторметилом, фтордихлорметилом, метокси, етокси, н- або і-пропокси, дифторметокси, трифторметокси, метилтіо, етилтіо, н- або і-пропілтіо, дифторметилтіо, трифторметилтіо, метоксикарбонілом, етоксикарбонілом, н- або і-пропоксикарбонілом моноциклічний або біциклічний гетероцикліл або гетероциклілалкіл з ряду фурил, фурилметил, тіеніл, тіенілметил, піролідініл, оксопіролідініл, піроліл, піролілметил, піразоліл, піразолілметил, імідазоліл, імідазолілметил, 2-оксо-1,3-діазациклопентил, оксазоліл, ізоксазоліл, оксазолілметил, ізоксазолідініл, тіазоліл, тіазолілметил, піперидиніл, оксопіперидиніл, 2-оксо-1,3-діазациклогексил, морфолініл, піперазиніл, піридиніл, піридинілметил, піримідиніл, піримідинілметил.

X означає найбільш переважно водень, нітро, ціано, фтор, хлор, бром, йод, метил, етил, н- або і-пропіл, дифторметил, трифторметил, дихлорметил, трихлорметил, метоксиметил, метилтіометил,

метилсульфінілметил, метилсульфонілметил, метокси, етокси, дифторметокси, трифторметокси, метилтіо, етилтіо, метилсульфініл, етилсульфініл, метилсульфоніл, етилсульфоніл або диметиламіносульфоніл.

Y означає найбільш переважно водень, нітро, ціано, фтор, хлор, бром, йод, метил, етил, дифторметил, трифторметил, дихлорметил, трихлорметил, метоксиметил, метилтіометил, метилсульфінілметил, метилсульфонілметил, метокси, етокси, дифторметокси, трифторметокси, метилтіо, етилтіо, метилсульфініл, етилсульфініл, метилсульфоніл, етилсульфоніл або диметиламіносульфоніл. m означає найбільш переважно число 0 або 1.

$R^3$  означає найбільш переважно водень; відповідно, в разі необхідності, заміщений фтором та/або хлором метил, етил, н- або і-пропіл, метилтіо, етилтіо, н- або і-пропілтіо; або феніл; або - у випадку, якщо m означає 2, - в разі необхідності також разом із другим залишком  $R^3$  означає кисень, пропан-1,3-дііл або бутан-1,4-дііл.

$R^4$  означає найбільш переважно гідрокси; формілокси; відповідно, в разі необхідності, заміщений фтором та/або хлором 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, метиламінокарбонілокси, етиламінокарбонілокси, н- або і-пропіламінокарбонілокси, метилсульфонілокси, етилсульфонілокси, н- або і-пропілсульфонілокси; відповідно, в разі необхідності, заміщений фтором та/або хлором пропенілокси, бутенілокси, пропінілокси або бутинілокси; відповідно, в разі необхідності, заміщений нітро, ціано, фтором, хлором, бромом, метилом, етилом, н- або і-пропілом, трифторметилом, метокси, етокси, н- або і-пропокси, дифторметокси або трифторметокси фенілокси, фенілтіо, фенілсульфініл, фенілсульфоніл, фенілкарбонілокси, фенілкарбонілметокси, фенілсульфонілокси, фенілметокси, фенілметилтіо, фенілметилсульфініл або фенілметилсульфоніл.

$R^5$  означає найбільш переважно водень, ціано, фтор, хлор; відповідно, в разі необхідності, заміщений фтором та/або хлором 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, заміщений ціано, фтором, хлором або метилом циклопропіл.

$R^6$  означає найбільш переважно водень; відповідно, в разі необхідності, заміщений ціано, фтором, хлором, метокси або етокси метил, етил, н- або і-пропіл, н-, і-, в- або трет.-бутил; відповідно, в разі необхідності, заміщений фтором або хлором пропеніл, бутеніл, пропініл або бутиніл; відповідно, в разі необхідності, заміщений фтором, хлором або метилом циклопропіл, циклобутил, циклопентил або циклогексил; або відповідно, в разі необхідності, заміщений фтором, хлором, бромом, метилом, етилом, н- або і-пропілом, трифторметилом, метокси, етокси, н- або і-пропокси, дифторметокси або трифторметокси

феніл або фенілметил.

$R^7$  означає найбільш переважно гідрокси; формілокси; відповідно, в разі необхідності, заміщений ціано, фтором, хлором, метокси, етокси, н- або і-пропокси метокси, етокси, н- або і-пропокси, ацетилокси, пропіонілокси, н- або і-бутироілокси, метоксикарбонілокси, етоксикарбонілокси, н- або і-пропоксикарбонілокси, метиламінокарбонілокси, етиламінокарбонілокси, н- або і-пропіламінокарбонілокси, метилсульфонілокси, етилсульфонілокси, н- або і-пропілсульфонілокси; відповідно, в разі необхідності, заміщений фтором та/або хлором пропенілокси, бутенілокси, пропінілокси або бутинілокси; або відповідно, в разі необхідності, заміщений нітро, ціано, фтором, хлором, бромом, метилом, етилом, н- або і-пропілом, трифторметилом, метокси, етокси, н- або і-пропокси, диформетокси або трифторметокси фенілметокси, фенілкарбонілокси, фенілкарбонілметокси або фенілсульфонілокси.

$R^8$  означає найбільш переважно водень, ціано, фтор, хлор, бром; або відповідно, в разі необхідності, заміщений фтором, хлором, метокси або етокси метил, етил, н- або і-пропіл, ацетил, пропіоніл, н- або і-бутироіл, метокси, етокси, н- або і-пропокси, метоксикарбоніл, етоксикарбоніл, н- або і-пропоксикарбоніл, метилтіо, етилтіо, н- або і-пропілтіо, метилсульфініл, етилсульфініл, метилсульфоніл або етилсульфоніл.

$R^9$  означає найбільш переважно водень; відповідно, в разі необхідності, заміщений фтором, хлором, метокси або етокси метил, етил, н- або і-пропіл; або відповідно, в разі необхідності, заміщений фтором, хлором або метилом циклопропіл.

$R^{10}$  означає найбільш переважно водень; відповідно, в разі необхідності, заміщений фтором, хлором, метокси або етокси метил, етил, н- або і-пропіл; або відповідно, в разі необхідності, заміщений фтором, хлором або метилом циклопропіл.

$R^{11}$  означає найбільш переважно водень, ціано, фтор, хлор, бром; або відповідно, в разі необхідності, заміщений фтором, хлором, метокси або етокси метил, етил, н- або і-пропіл, метокси, етокси, н- або Апропокси, метоксикарбоніл, етоксикарбоніл, н- або і-пропоксикарбоніл, метилтіо, етилтіо, н- або Апропілтіо, метилсульфініл, етилсульфініл, метилсульфоніл або етилсульфоніл.

$R^1$  означає абсолютно переважно водень; відповідно, в разі необхідності, заміщений фтором, хлором, метокси або етокси метил, етил, н- або і-пропіл; метокси або етокси або групу  $-C(Q)-R^2$ .

$R^2$  означає абсолютно переважно водень, аміно, гідразино; відповідно, в разі необхідності, заміщений фтором, хлором, метокси або етокси метил, етил або н- або і-пропіл; метиламіно, етиламіно, н- або і-пропіламіно або диметиламіно; відповідно, в разі необхідності, заміщений фтором, хлором метилом циклопропіл, циклобутил, циклопентил або циклогексил; відповідно, в разі необхідності, заміщений нітро, ціано, фтором, хлором, бромом, метилом, етилом або н- або і-пропілом, метокси, етокси, н- або і-пропокси феніл, феніламіно, фенілметил або фенілетил; або відповідно, в разі необхідності, заміщений нітро, ціано, фтором, хлором, бромом, метилом, етилом, диформетилом, трифторметилом, дихлорметилом, трихлор-

метилом, хлордифторметилом, фтордихлорметилом, метокси, етокси, метилтіо, етилтіо, диформетилтіо, трифторметилтіо, метоксикарбонілом або етоксикарбонілом фурил, фурилметил, тіеніл, тіенілметил, піроліл або піролілметил.

$X$  означає абсолютно переважно водень, нітро, фтор, хлор, бром, метил, етил або трифторметил.

$Y$  означає абсолютно переважно водень, нітро, ціано, фтор, хлор, бром, йод, метил, етил, диформетил, трифторметил, дихлорметил, трихлорметил, метоксиметил, метилтіометил, метилсульфінілметил, метилсульфонілметил, метокси, етокси, диформетокси, трифторметокси, метилтіо, етилтіо, метилсульфініл, етилсульфініл, метилсульфоніл, етилсульфоніл або диметиламіносульфоніл.

$R^3$  означає абсолютно переважно водень або відповідно, в разі необхідності, заміщений фтором та/або хлором метил або етил.  $R^4$  означає абсолютно переважно гідрокси.

$R^5$  означає абсолютно переважно водень, фтор, хлор або відповідно, в разі необхідності, заміщений фтором та/або хлором метил, етил, метокси або етокси.

$R^6$  означає абсолютно переважно водень або відповідно, в разі необхідності, заміщений фтором, хлором, метокси або етокси метил, етил, н- або і-пропіл або н-, і-, в-або трет.-бутил.

$R^7$  означає абсолютно переважно гідрокси; відповідно, в разі необхідності, заміщений фтором або хлором метокси або етокси; або, в разі необхідності, заміщений нітро, ціано, фтором, хлором, бромом, метилом, етилом, трифторметилом, метокси або етокси фенілметокси.

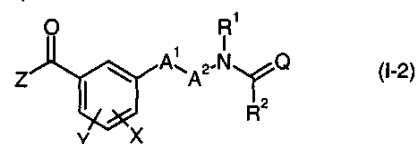
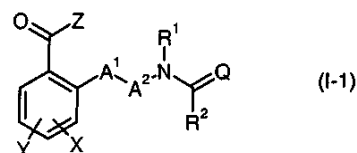
Згідно з винаходом перевагу надають сполукам формули (I), в яких представлені комбінації сполук, які, як наведено вище, мають переважні значення.

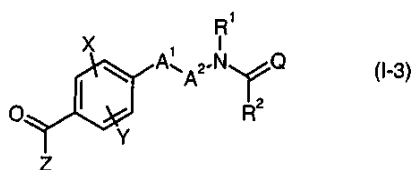
Згідно з винаходом особливу перевагу надають сполукам формули (I), в яких представлені комбінації сполук, які, як наведено вище, мають особливо переважні значення.

Згідно з винаходом найбільшу перевагу надають сполукам формули (I), в яких представлені комбінації сполук, які, як наведено вище, мають найбільш переважні значення.

Згідно з винаходом абсолютно перевагу надають сполукам формули (I), в яких представлені комбінації сполук, які, як наведено вище, мають абсолютно переважні значення.

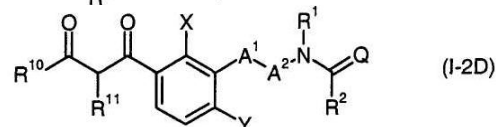
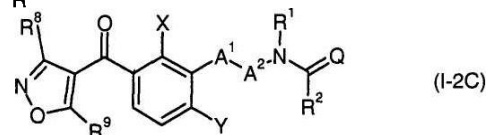
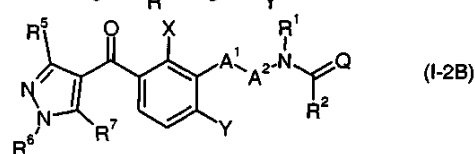
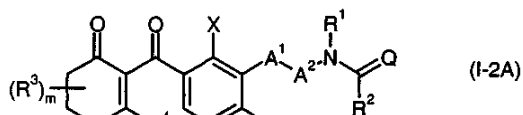
Безперечно перевагу надають сполукам формул (I-1)-(I-3):





При цьому  $A^1$ ,  $A^2$ ,  $Q$ ,  $R^1$ ,  $R^2$ ,  $X$ ,  $Y$  та  $Z$  мають відповідно значення, наведені вище як переважні або найбільш переважні.

Крім того безперечну перевагу надають сполукам загальної формули (I-2A) - (I-2D):



При цьому  $m$ ,  $A^1$ ,  $A^2$ ,  $Q$ ,  $R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^3$ ,  $R^4$ ,  $R^5$ ,  $R^6$ ,  $R^7$ ,  $R^8$ ,  $R^9$ ,  $R^{10}$ ,  $R^{11}$ ,  $X$  та  $Y$  мають значення, наведені вище як переважні або найбільш переважні.

Із сполук формул (I-1)-(I-3), а також (I-2A)-(I-2D) абсолютно безперечну перевагу надають таким сполукам, в яких  $A^1$  означає простий зв'язок, а  $A^2$  означає метилен.

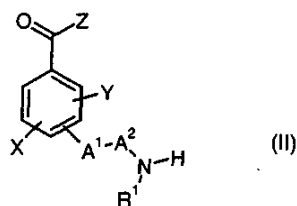
Крім того із сполук формул (I-1)-(I-3), а також (I-2A)-(I-2D) абсолютно безперечну перевагу надають таким сполукам, в яких  $A^1$  означає  $O$  (кисень), а  $A^2$  означає етан-1,2-диїл (диметилен).

Наведені вище загальні або переважні визначення залишків стосуються як кінцевих продуктів формули (I), так і відповідно необхідних для одержання вихідних або проміжних продуктів. Ці визначення залишків можна в будь-якій послідовності комбінувати як між собою, так і з залишками, визначеними як переважні.

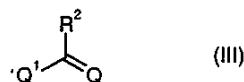
Нові заміщені арилкетони формули (I) вирізняються сильною та селективною гербіцидною ефективністю.

Нові заміщені арилкетони формули (I) одержують шляхом взаємодії

(a) аміносполук загальної формули (II)



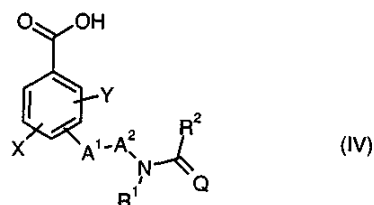
в якій  $A^1$ ,  $A^2$ ,  $R^1$ ,  $X$ ,  $Y$  та  $Z$  мають наведені вище значення, зі сполуками загальної формули (III)



в якій  $Q$  та  $R^2$  мають наведені вище значення, а  $Q^1$  означає галоген, алкокси, алкілтію, арилокси або арилтію, переважно хлор, бром, метокси, етокси, метилтію, етилтію, фенілокси або фенілтію, - або, в разі необхідності, з відповідними ізо(тіо)ціанатами -

в разі необхідності, в присутності одного або кількох агентів, що допомагають здійсненню реакції, та, в разі необхідності, в присутності одного або кількох розріджувачів, або шляхом взаємодії

(b) карбонових кислот загальної формули (IV)



в якій  $A^1$ ,  $A^2$ ,  $Q$ ,  $R^1$ ,  $R^2$ ,  $X$  та  $Y$  мають наведені вище значення

- або їх похідних, здатних вступати в реакцію, таких як відповідні галогеніди кислоти, ціаніди кислоти або естери -

зі сполуками загальної формули (V)

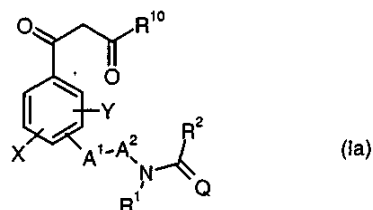


в якій

$Z$  має наведене вище значення,

в разі необхідності, в присутності одного агента дегідратування, а також, в разі необхідності, в присутності одного або кількох агентів, що допомагають здійсненню реакції, та, в разі необхідності, в присутності одного або "кількох розріджувачів, або шляхом взаємодії

(c) заміщених бензоїлкетонів загальної формули (Ia)



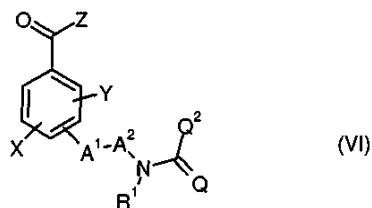
в якій  $A^1$ ,  $A^2$ ,  $Q$ ,  $R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^{10}$ ,  $X$  та  $Y$  мають наведені вище значення, з естером ортомурашиної кислоти або з  $N,N$ -

диметилформамацеталем, або з естером ціаномурашиної кислоти, або з карбоновим дисульфідом (сірковуглець) та з агентом алкілування, а також з гідроксиламіном або його кислотним адуктом

в разі необхідності, в присутності одного або кількох агентів, що допомагають здійсненню реакції, та, в разі необхідності, в присутності одного або кількох розріджувачів,

або шляхом взаємодії

(d) арилкетонів загальної формули (VI)



в якій  $A^1$ ,  $A^2$ ,  $Q$ ,  $R^1$ ,  $X$ ,  $Y$  та  $Z$  мають наведені вище значення, а

$Q^2$  означає галоген, алкокси, алкілтію, арилокси або арилтію, переважно хлор, бром, метокси, етокси, метилтію, етилтію, фенілокси або фенілтію, - або, в разі необхідності, відповідних ізо(тіо)ціанатів - зі сполуками загальної формули (VII)



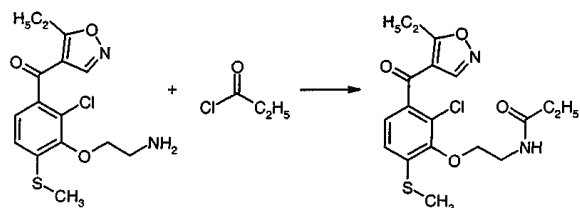
в якій

$R^2$  має наведені вище значення,

в разі необхідності, в присутності одного або кількох агентів, що допомагають здійсненню реакції, та, в разі необхідності, в присутності одного або кількох розріджувачів,

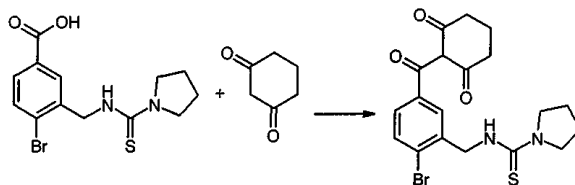
та, в разі необхідності, після одержання згідно з винаходом сполук загальної формули (I) згідно зі способами (a), (b), (c) або (d) шляхом подальшої взаємодії в рамках визначених замісників (наприклад, шляхом заміщення, окислення або відновлення) ці сполуки перетворюють на інші сполуки загальної формули (I) звичайними способами.

Якщо як вихідні речовини застосовують, наприклад, [3-(2-аміноетокси)-2-хлор-4-метилтіофеніл]-(5-етил-4-ізоксазоліл)метанон та хлорид пропіонової кислоти, то згідно з винаходом наведена нижче схема демонструє проведення реакції відповідно до способу (a):



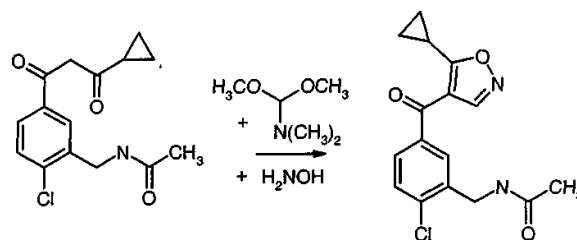
Якщо як вихідні речовини застосовують, наприклад, 4-бром-3-[(1-піролідинілтіоксометил)аміно]метилбензойну кислоту та циклогексан-1,3-діон, то згідно з винаходом наведена нижче схема демонструє проведен-

ня реакції відповідно до способу (b):

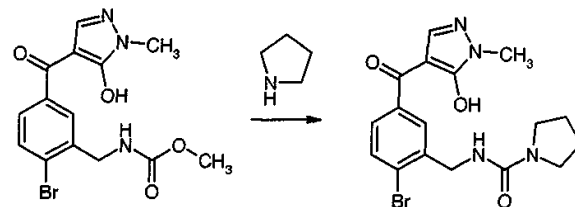


Якщо як вихідні речовини застосовують, наприклад,

N-[2-хлор-5-(3-циклопропіл-3-оксопропанол)бензил]ацетамід, діетилацетат N,N-диметилформамаїду та гідроксиламін, то згідно з винаходом наведена нижче схема демонструє, проведення реакції відповідно до способу (c):



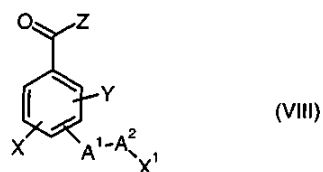
Якщо як вихідні речовини застосовують, наприклад, О-метильовий естер N-[[2-броМ-5-[(5-гідрокси-1-метил-1Н-піразол-4-іл)карбоніл]феніл]метил]карбамідної кислоти та піролідин, то згідно з винаходом наведена нижче схема демонструє проведення реакції відповідно до способу (d):



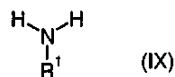
Аміносполуки, які як вихідні речовини згідно зі способом (a) застосовують для одержання сполук загальної формули (I), визначаються загальною формулою (II). У загальній формулі (II)  $A^1$ ,  $A^2$ ,  $R^1$ ,  $X$ ,  $Y$  та  $Z$  переважно мають значення, наведені згідно з винаходом у зв'язку із описом сполук загальної формули (I) та визначені як переважні, особливо переважні, найбільш переважні або абсолютно переважні для  $A^1$ ,  $A^2$ ,  $R^1$ ,  $X$ ,  $Y$  та  $Z$ .

Вихідні речовини загальної формули (II) ще не відомі з літературних джерел, як нові речовини вони також є об'єктом даної заявки.

Нові аміносполуки загальної формули (II) одержують шляхом взаємодії галогенних сполук загальної формули (VIII)



в якій  
 $A^1$ ,  $A^2$ , X, Y та Z мають наведені вище значення, а  
 $X^1$  означає галоген (переважно фтор, хлор, бром або йод, зокрема хлор або бром),  
 з аміаком або аміносполуками загальної формули (IX)



в якій  
 $R^1$  має наведені вище значення,  
 в разі необхідності, в присутності розріджувача, такого як тетрагідрофуран, в разі необхідності, при підвищеному тиску та температурі від  $0^\circ\text{C}$  до  $100^\circ\text{C}$  (див. приклади одержання).

Первинні продукти загальної формули (VIII) відомі та/або можуть бути одержані відомими способами [див. WO-A-95/31446, WO-A-00/68227, приклади одержання]. Первинні продукти загальної формули (IX) є відомими продуктами синтезу.

(Ті)оксосполуки, які як вихідні речовини згідно зі способом (а) застосовують для одержання сполук загальної формули (I), визначаються загальною формулою (III). У загальній формулі (III) Q та  $R^1$  переважно мають значення, наведені згідно з винаходом у зв'язку із описом сполук загальної формули (I) та визначені як переважні, особливо переважні, найбільш переважні або абсолютно переважні для  $A^1$ ,  $A^2$ ,  $R^1$ , X, Y та Z;  $Q^1$  означає переважно фтор, хлор, бром,  $C_1$ - $C_4$ -алкокси,  $C_1$ - $C_4$ -алкілтію, фенокси або фенілтію, зокрема хлор, метокси, етокси або фенокси.

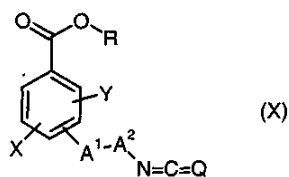
Вихідні речовини загальної формули (III) є відомими продуктами синтезу.

Карбонові кислоти, які як вихідні речовини згідно зі способом (б) застосовують для одержання сполук загальної формули (I), визначаються загальною формулою (IV). У загальній формулі (IV)  $A^1$ ,  $A^2$ , Q,  $R^1$ ,  $R^2$ , X та Y переважно мають значення, наведені згідно з винаходом у зв'язку із описом сполук загальної формули (I) та визначені як переважні, особливо переважні, найбільш переважні або абсолютно переважні для  $A^1$ ,  $A^2$ , Q,  $R^1$ ,  $R^2$ , X та Y.

Вихідні речовини загальної формули (IV) ще не відомі з літературних джерел, як нові речовини вони також є об'єктом даної заявки.

Нові карбонові кислоти загальної формули (IV) одержують шляхом взаємодії

( $\alpha$ ) ізо(тіо)ціанатів загальної формули (X)



в якій  
 $A^1$ ,  $A^2$ , Q, X та Y мають наведені вище значення, а

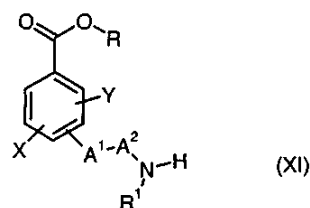
R означає водень, еквівалент лужного або лужноземельного металу (переважно натрій або ка-

лій), або алкіл (переважно  $C_1$ - $C_4$ -алкіл, зокрема метил або етил), зі сполуками загальної формули (VII)



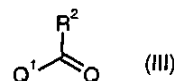
в якій  
 $R^2$  має наведене вище значення,

в разі необхідності, в присутності розріджувача, такого як, наприклад, ацетонітрил або етанол, при температурі від  $0^\circ\text{C}$  до  $100^\circ\text{C}$ , а після цього, в разі необхідності, здійснюють омилення естеру відомими способами (див. приклади одержання), або шляхом взаємодії  
 ( $\beta$ ) аміносполук загальної формули (XI)



в якій  
 $A^1$ ,  $A^2$ ,  $R^1$ , X та Y мають наведені вище значення, а

R означає водень, еквівалент лужного або лужноземельного металу (переважно натрій або калій), або алкіл (переважно  $C_1$ - $C_4$ -алкіл, зокрема метил або етил), з (ті)оксосполуками загальної формули (III)



в якій  
 Q та  $R^2$  мають наведені вище значення, а  
 $Q^1$  означає галоген, алкокси, алкілтію, арилокси або арилтію, переважно хлор, бром, метокси, етокси, метилтію, етилтію, фенілокси або фенілтію,  
 - або, в разі необхідності, з відповідними ізо(тіо)ціанатами - в разі необхідності, в присутності одного або кількох агентів, які допомагають здійсненню реакції, таких як, наприклад, карбонат калію або триетиламін, та, в разі необхідності, в присутності одного або кількох розріджувачів, таких як, наприклад, ацетонітрил або N,N-диметилформамід, при температурі від  $0^\circ\text{C}$  до  $100^\circ\text{C}$ .

Сполуки, які крім того як вихідні речовини згідно зі способом (б) застосовують для одержання сполук загальної формули (I), визначаються загальною формулою (V). У загальній формулі (V) Z переважно має значення, наведені згідно з винаходом у зв'язку із описом сполук загальної формули (I) та визначені як переважні, особливо переважні, найбільш переважні або абсолютно переважні для Z.

Вихідні речовини загальної формули (V) є відомими органічними синтезованими хімікатами.

Заміщені бензоїлкетони, які як вихідні речовини згідно зі способом (с) застосовують для одержання сполук загальної формули (I), визначаються загальною формулою (Ia). У загальній формулі (Ia)



$A^1$ ,  $A^2$ , Q,  $R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^{10}$ , X та Y переважно мають значення, наведені у зв'язку із описом сполук загальної формули (I) та визначені як переважні, особливо переважні, найбільш переважні або абсолютно переважні для  $A^1$ ,  $A^2$ , Q,  $R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^{10}$ , X та Y. Вихідні речовини загальної формули (Ia) як нові речовини є також об'єктом даної заявки; їх можна одержати відповідно до способів (a) або (b) згідно з винаходом.

Арилкетони, які як вихідні речовини згідно зі способом (d) застосовують для одержання сполук загальної формули (I), визначаються загальною формулою (VI). У загальній формулі (VI)  $A^1$ ,  $A^2$ , Q,  $R^1$ , X, Y та Z переважно мають значення, наведені згідно з винаходом у зв'язку із описом сполук загальної формули (I) та визначені як переважні, особливо переважні, найбільш переважні або абсолютно переважні для  $A^1$ ,  $A^2$ , Q,  $R^1$ , X, Y та Z;  $Q^2$  означає переважно фтор, хлор, бром,  $C_1$ - $C_3$ -алкокси,  $C_1$ - $C_3$ -алкілтіо, фенокси або фенілтіо, зокрема хлор, метокси, етокси або фенокси.

Вихідні речовини формули (VI) можуть бути одержані відомими фахівцям способами.

Сполуки, які крім того як вихідні речовини згідно зі способом (d) застосовують для одержання сполук загальної формули (I), визначаються загальною формулою (VII). У загальній формулі (VII)  $R^2$  переважно має значення, наведене згідно з винаходом у зв'язку із описом сполук загальної формули (I) та визначене як переважне, особливо переважне, найбільш переважне або абсолютно переважне для  $R^2$ .

Вихідні речовини загальної формули (VII) є відомими органічними сполуками.

Ізо(тіо)ціанати, які як вихідні речовини згідно зі способом (v) застосовують для одержання сполук загальної формули (IV), визначаються загальною формулою (X). У загальній формулі (X)  $A^1$ ,  $A^2$ , Q, X та Y переважно мають значення, наведені згідно з винаходом у зв'язку із описом сполук загальної формули (I) та визначені як переважні, особливо переважні, найбільш переважні або абсолютно переважні для  $A^1$ ,  $A^2$ , Q, X та Y.

Вихідні речовини загальної формули (X) можуть бути одержані відомими фахівцям способами.

Аміносполуки, які як вихідні речовини згідно зі способом (3) застосовують для одержання сполук загальної формули (IV), визначаються загальною формулою (XI). У загальній формулі (XI)  $A^1$ ,  $A^2$ ,  $R^1$ , X та Y переважно мають значення, наведені згідно з винаходом у зв'язку із описом сполук загальної формули (I) та визначені як переважні, особливо переважні, найбільш переважні або абсолютно переважні для  $A^1$ ,  $A^2$ ,  $R^1$ , X та Y. Вихідні речовини загальної формули (XI) можуть бути одержані відомими фахівцям способами.

Згідно з винаходом способи (a), (b), (c) та (d) проводять переважно у присутності одного або кількох агентів, які допомагають здійсненню реакції. Як такі агенти для проведення способів (a), (b), (c) та (d) згідно з винаходом придатними є звичайні неорганічні або органічні основи або акцептори кислоти. Сюди належать переважно ацетати, амід, карбонати, гідрокарбонати, гідриди, гідроксиди або алканолати лужних або лужноземельних ме-

талів, такі 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, n- або i-пропанолат, n-, i-, v- або трет.-бутанолат натрію або калію; а також основні органічні сполуки азоту, такі як, наприклад, триметиламін, триетиламін, трипропіламін, трибутиламін, етилдіізопропіламін, N,N-диметилциклогексиламін, дициклогексиламін, етилдциклогексиламін, 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).

Як інші агенти, що допомагають здійсненню реакції, для проведення способів (a), (b), (c) та (d) згідно з винаходом застосовують також міжфазні каталізатори. Прикладами таких каталізаторів є:

бромід тетрабутиламонію, хлорид тетрабутиламонію, хлорид тетраоктиламонію, гідросульфат тетрабутиламонію, хлорид метилтриоктиламонію, хлорид гексадецилтриметиламонію, бромід гексадецилтриметиламонію, хлорид бензилтриметиламонію, хлорид бензилтриетиламонію, гідроксид бензилтриметиламонію, гідроксид бензилтриетиламонію, хлорид бензилтрибутиламонію, бромід бензилтрибутиламонію, бромід тетрабутилфосфонію, хлорид тетрабутилфосфонію, бромід трибутилгексадецилфосфонію, хлорид бутилтрифенілфосфонію, бромід етилтриоктилфосфонію, бромід тетрафенілфосфонію.

Згідно з винаходом спосіб (b) для одержання нових заміщених арилкетонів загальної формули (I) здійснюють, в разі необхідності, у присутності агенту дегідратування. Ним є придатні для зв'язування води хімікати.

Їх прикладами є дициклогексилкарбодіїмід, карбоніл-б/с-імідазол та ангідрид пропанфосфонові кислоти.

Особливо придатними агентами дегідратування є дициклогексилкарбодіїмід та ангідрид пропанфосфонові кислоти.

Згідно з винаходом способи одержання сполук загальної формули (I) здійснюють переважно при застосуванні розріджувачів. Як розріджувачі для здійснення способів (a), (b), (c) та (d) згідно з винаходом застосовують поряд з водою передусім інертні органічні розчинники. Сюди 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, диметиловий або діетиловий етер етиленгліколю; кетони, такі як ацетон, бутанон або метилізобутилкетон; нітрили, такі як ацетонітрил, пропіонітрил або бутіронітрил; амід, 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, спитри, такі як метанол, етанол, *n*- або *i*-пропанол, монометиловий етер етиленгліколю, моноетиловий етер етиленгліколю, монометиловий етер діетиленгліколю, моноетиловий етер діетиленгліколю, їх суміші з водою або чиста вода.

Температуру реакції при здійсненні способів (а), (б), (с) та (д) згідно з винаходом можна варіювати у широких межах. Загалом робоча температура становить від 0°C до 150°C, переважно від 10°C до 120°C.

Згідно з винаходом загалом способи здійснюються при нормальному. Можливо також здійснювати способи при підвищеному або пониженому тиску - загалом від 0,1 бар до 10 бар.

Для проведення способів згідно з винаходом вихідні речовини застосовують загалом у приблизно еквімолярних кількостях. Хоча можливо також один з компонентів застосовувати у більшій кількості. Взаємодія загалом відбувається у придатному розріджувачі в присутності агента, що допомагає здійсненню реакції, реакційну суміш при цьому перемішують протягом кількох годин при необхідній температурі. Взаємодію здійснюють звичайними способами (див. приклади одержання).

Активні речовини згідно з винаходом можуть бути застосовані як дефоліанти, десиканти, агенти придушення росту трав та зокрема як агенти для знищення бур'янів. Під бур'янами у широкому смислі розуміють усі рослини, що виростають у тих місцях, де вони є небажаними. Тотальна або селективна гербіцидна дія запропонованих згідно з даним винаходом речовин звичайно залежить від норми їх витрати.

Активні речовини згідно з даним винаходом можуть бути використані, наприклад, для таких рослин:

Дводольні бур'яни родів: *Abutilon* (абутилон), *Amaranthus* (амарант), *Ambrosia* (амброзія), *Anoda*, *Anthemis* (пупавка), *Aphanes*, *Atriplex* (лобода), *Bellis* (маргаритка), *Bidens* (чепра), *Capsella* (вічарська сумка), *Carduus* (будяк), *Cassia* (касія), *Centaurea* (волошка), *Chenopodium* (марь), *Cirsium* (бодяк), *Convolvulus* (в'юнок), *Datura* (дурман), *Desmodium*, *Emex*, *Erysimum* (жовтушник), *Euphorbia* (молочай), *Galeopsis*, *Galinsoga* (галинзога), *Galium* (подмареник), *Hibiscus* (гібіскус), *Ipomoea* (іпомея), *Kochia* (кокія), *Lamium* (яснотка), *Lepidium* (блощинник), *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* (сесбания), *Sida* (сида), *Sinapis* (гірчиця), *Solanum* (паслен), *Sonchus* (осот), *Spenoclea*, *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* (соя), *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* (егілопс), *Agropyron* (житняк), *Agrostis* (мітлиця), *Alopecurus* (лисохвіст), *Apera*, *Avena* (овес), *Brachiaria*, *Bromus* (багаття), *Cenchrus*, *Commelina* (комеліна), *Cynodon* (свинорий), *Cyperus* (сіль), *Dactyloctenium*, *Digitaria* (росичка), *Echinochloa* (ежовник), *Eleocharis* (болотниця), *Eleusine* (елевсіна), *Eragrostis* (полеви́чка), *Eriochloa*, *Festuca* (овсяниця), *Fimbristylis*, *Heteranthera*, *Imperata*, *Ischaemum*, *Leptochloa*, *Lolium* (плевел), *Monochoria*, *Panicum* (про́со), *Paspalum* (гречка), *Phalaris* (канаре́єчник), *Phleum* (тимофі́вка), *Poa* (мя́тлик), *Rottboellia*, *Sagittaria* (стрелолист), *Scirpus* (очерет), *Setaria* (щетинник), *Sorghum* (со́рго).

Однодольні культурні рослини родів: *Allium* (цибуля), *Ananas* (ананас), *Asparagus* (спаржа), *Avena* (овес), *Hordeum* (ячмінь), *Oryza* (рис), *Panicum* (про́со), *Saccharum* (цукровий очерет), *Secale* (жито), *Sorghum* (со́рго), *Triticale* (тритика́ле), *Triticum* (пшени́ця), *Zea* (кукурудза).

Застосування активних речовин згідно з даним винаходом ніяким чином не обмежується зазначеними видами, а також так само поширюється на інші рослини.

Активні речовини згідно з даним винаходом 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 активних речовин згідно з даним винаходом для боротьби з бур'янами в багаторічних культурах, наприклад, при посадці деревних, декоративних, плодових, винних, цитрусових, горіхових, бананових, кавових, чайних, каучукових, оліє-пальмових, какао, фруктово-ягідних та хмелевих культур, на декоративних газонах та спортивних майданчиках, на пасовищах, а також для селективної боротьби з бур'янами в однолітніх культурах.

Сполуки формули (I) згідно з даним винаходом демонструють сильну гербіцидну активність та широкий спектр дії при обробці ґрунту та зелених частин рослин над поверхнею землі. Також активні речовини згідно з даним винаходом 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.

Згідно з винаходом активні речовини у визначеній концентрації або нормі витрати можуть також бути використані для боротьби з тваринними шкідниками та грибковими або бактеріальними захворюваннями рослин. Вони, в разі необхідності, також можуть бути використані як проміжні або первинні продукти для синтезу інших активних речовин.

Згідно з винаходом можна обробляти всі рослини або частини рослин. Під рослинами при цьо-

му розуміють всі рослини та популяції рослин, такі як бажані та 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 поєднанням цих методів, включаючи трансгенні рослини та сорти рослин, що захищаються або не захищаються законом про охорону нових сортів рослин. Під частинами рослин слід розуміти всі надземні та підземні частини та органи рослин, такі як парості, лист, квітка та корінь, наприклад, листи, голки, стебла, стовбури, квіти, плодові тіла, плоди та насіння, а також корені, бульби та ризоми. До частин рослин належать також зібраний врожай, а також вегетативний та генеративний матеріал для розмноження, наприклад, черешки, бульби, ризоми, відводки та насіння.

Як було вже зазначено вище, згідно з винаходом можлива обробка всіх рослин або їх частин. У переважному варіанті здійснення обробляють дикоростучі рослини (бур'яни, шкідливі рослини), види та сорти рослин (культурні рослини), а також їх частини, вирощені та/або одержані за умов біологічного розведення, наприклад, схрещуванням або злиттям протопластів. В іншому переважному варіанті здійснення обробляють трансгенні рослини та сорти рослин, одержані за генотехнологічними методами, в разі необхідності, у комбінації з умовними методами (генетично модифіковані організми) та їх частини. Поняття «частини» або «частини рослин» або «органи рослин» пояснено вище.

Під сортами рослин розуміють рослини з визначеними властивостями (ознаками), що одержують умовним розведенням, мутагенезом або рекомбінантними методиками ДНК. Це можуть бути сорти, біотики та генотипи.

До трансгенних (отриманих з використанням генних технологій) рослин або сортів рослин, які підлягають обробці, згідно з винаходом, відносять всі рослини, що одержали генетичний матеріал при модифікації за генною технологією, який додає цим рослинам особливі вигідні цінні властивості. Прикладами таких властивостей є кращий ріст рослин, підвищена толерантність по відношенню до високих або низьких температур, підвищена толерантність до нестачі вологи або до змісту 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, покращена довготривалість зберігання та/або краща перероблюваність продуктів врожаю. Іншими та особливо переважними прикладами таких властивостей є підвищена стійкість рослин до тваринних шкідників та мікроорганізмів, таким як комахи, кліщі, патогенні для рослин гриби, бактерії та/або віруси, а також підвищена толерантність рослин до визначених гербіцидних активних речовин. Прикладами трансгенних рослин є важливі культурні рослини, такі як зернові (включаючи рис), кукурудза, соя, картопля, бавовна, буряк, рапс, культурні трави, такі як трава для гри в гольф та декоративна трава, фруктові рослини

(із плодами яблук, груш, плодами цитрусових та винограду) та плантаційні культури, такі як маслини та каучукові дерева, причому особливу перевагу надають зерновим (включаючи рис), кукурудзі, сої, картоплі, бавовні, буряку та рапсу. Як властивостям особливу перевагу надають підвищеній стійкості 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"). Як властивостям особливу перевагу надають також підвищеній стійкості рослин до грибків, бактерій та вірусів у зв'язку з систематичною позитивно набутою стійкістю, системіном, фітоалексином, а також стійкими генами та відповідно дослідженими протеїнами та токсинами. Крім того як властивостям особливу перевагу надають підвищеній толерантності рослин по відношенню до визначених гербіцидно активних речовин та класів активних речовин, наприклад, гліфозатів або гліфозинатів/фосфінотрицину (наприклад, "PAT-ген"), ALS-інгібіторів, таких як імідазолінон, сульфонілсечовина та інші, PPO-інгібіторів (які, наприклад, містять гени акурону), 4-HPO-інгібіторів, таких як ізоксазоли (наприклад, ізоксафлютоли), ACCase-інгібіторів, таких як сетоксидим, а також бромоксиніл.

Гени, що забезпечують бажані властивості, можуть зустрічатися в трансгенних рослинах та в їх комбінаціях між собою. Приклади "Бт. рослин" слід назвати сорти кукурудзи, сорти бавовни, сорти сої та сорти 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 слід назвати сорти кукурудзи, сорти бавовни, сорти сої, сорти зернових, включаючи сорти рису, сорти буряку та сорти рапсу, що наявні у продажу під торговельними марками Roundup Ready® (толрантність до гліфозату, наприклад, кукурудза, бавовна, соя, буряк, рапс), Liberty Link® (толрантність до гліфозинату, наприклад, рапс, кукурудза, буряк), IMI® (толрантність до імідазолінонів) та STS® (толрантність до сульфонілсечовин, наприклад, кукурудза). Як стійкі до гербіцидів (традиційно вирощуваних, як толрантні до гербіцидів) рослини слід згадати сорти, що наявні у продажу під назвою Clearfield® (наприклад, кукурудза, рис).

Зрозуміло, що ці висловлювання 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.

В залежності від виду або сорту рослин, їх місцезнаходження та умов росту (ґрунт, клімат, період вегетації, харчування) в результаті обробки згідно з винаходом можуть спостерігатися нададигнівні («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, поліпшення росту рослин, підвищена толерантність по відношенню до високих або низьких температур, підвищена толерантність до нестачі вологи 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, підвищена довготривалість зберігання та/або краща перероблюваність продуктів врожаю, що виходять за межі власне очікуваних ефектів.

Найбільш переважно згідно з винаходом зазначені рослини можуть бути оброблені сполуками загальної формули (I) або сумішами активних речовин згідно з винаходом, причому додатково до високої здатності боротьби з бур'янами вони також проявляють зазначені вище синергічні ефекти по відношенню до описаних вище рослин та сортів рослин. Вищевказані області переважних значень активних речовин або сумішей також використовують для обробки таких рослин. Найбільш переважно обробку рослин проводять спеціально зазначеними в запропонованому тексті сполуками або сумішами.

Згідно з винаходом обробку рослин та частин рослин за допомогою біологічно активних речовин здійснюють безпосередньо або шляхом впливу на середовище їх росту, життєвий простір або закрите сховище відповідно до звичайних методів обробки, наприклад, шляхом занурення, мілкокрапельного обприскування, випару, створення штучного туману, розкидання, намазування, та, 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, дуети 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 як допоміжні засоби, що поліпшують розчинення, можуть, наприклад, використовуватися і органічні розчинники. Як розчинники по суті мають на увазі: ароматичні сполуки, такі як ксилол, толуол, або алкілнафталіни, хлоровані ароматичні сполуки та хлоровані аліфатичні вуглеводні, такі як хлорбензоли, хлоретилени або метилхлорид, аліфатичні вуглеводні, такі як циклогексан або парафіни, наприклад, фракції нафти, мінеральні та рослинні олії, спирти, такі як бутанол або гліколь, а також їх етери та естери, кетони, такі як ацетон, метилетилкетон, метилізобутилкетон або циклогексанон, сильнополярні розчинники, такі як диметилформамід та диметилсульфоксид, а також вода.

Як тверді носії мають на увазі: наприклад, солі амонію або 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, мармур, 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 метилцелюлозу.

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

Можуть застосовуватися барвники, такі як неорганічні пігменти, наприклад, оксид заліза, оксид титану, фероціан синій, та органічні барвники, такі як алізарин-, азо- і 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 95 ваг.% активної речовини, переважно, від 0,5 до 90 ваг.% активної речовини.

Згідно з винаходом активні речовини можуть бути використані у своїй препаративній формі або змішані з відомими гербіцидами та/або речовинами, що застосовують при боротьбі з бур'янами для поліпшення сумісності з культурними рослинами (захисні речовини), причому можливим є 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, амітрол, анілофос, асулам, атразин, азафенідин, азимсульфурон, бефлубетамід, беназолін(-етил), бенфурезат, бенсульфурон(-метил), бентазон, бензфендізон, бензобіциклон, бензофенап, бензоілпроп(-етил), біалафос, біфенокс, біспірибак(-натрій), бромацил, бромобутид, бромофеноксим, бромоксиніл, бутахлор, бутафенацил(-аліл), бутенахлор, бутралін, бутроксидим, бутилат, кафенстрол, карбетамід, карфентразон(-етил), хлометоксифен, хлорамбен, хлоридазон, хлоримурон(-етил), хлорнітрофен, хлорсульфурон, хлортіамід, хлортолу-

рон, цинідон(-етил), цинметилін, ціносульфурон, клефоксидим, клетодим, клодинафоп(-пропаргіл), кломазон, кломеппроп, клопіралід, клопірасульфурон(-метил), кумілулон, ціаназин, цибутрин, циклоат, циклосульфамурон, циклоксидим, цигалофоп(-бутил), 2,4-D, 2,4-DB, десмедифам, диаллат, дикамба, дихлобеніл, дихлорпроп(-P), диклофоп(-метил), диклосулам, діетатил(-етил), дифенопентен(-етил), дифензокват, дифлуфенікан, дифлуфензопір, дикегулак(-натрій), димефурон, димеліперат, диметахлор, диметаметрин, диметенамід(-P), димексифлам, динітрамін, дифенамід, дикват(-дибромід), дітіопір, діурон, димрон, епроподан, ЕРТС, еспрокарб, еталфлураліін, етаметсульфурон(-метил), етіозин, етофумезат, етоксифен, етоксисульфурон, етобензанід, феноксапроп(-P-етил), фентразамід, флампроп(-M-ізопропіл, M-метил), флазасульфурон, флорасулам, флуазифоп(-P-бутил), флуазолат, флукарбазон(-натрій), флухлоралін, флуфенацет, флуметсулам, флуміклопак(-пентил), флуміоксазин, флуміпропін, флуометурон, флуорохлоридон, флуороглікофен(-етил), флупоксам, флупропацил, флупірсульфурон(-метил, -натрій), флуренол(-бутил), флуридон, флуороксіпір(-бутоксіпропіл, -метил), флурпримідол, флуртамон, флутіацет(-метил), фомесафен, форамсульфурон, глүфозинат(-амоній), гліфозат(-амоній, -ізопропіламоній), галосафен, галосульфурон(-метил), галоксифоп(-етоксиетил, -P-метил), гексазинон, імазаметабенз(-метил), імазаметапір, імазамокс, імазапік, імазапір, імазаквін, імазетапір, імазосульфурон, йодосульфурон(-метил, -натрій), іоксиніл, ізопропалін, ізопротурон, ізоурон, ізоксабен, ізоксахлортол, ізоксадіфен(-етил), ізоксафлутол, ізоксапірифоп, кетоспірадокс, лактофен, ленацил, лінурон, МСРА, мекопроп(-P), мефенацет, мезотрион, метамітрон, метазахлор, метабензтіазурон, метилдимрон, метобензулон, метобромурон, (S-)метолахлор, метосулам, метоксурон, метрибузин, метсульфурон(-метил), молінат, монолінулон, напроанлід, напропамід, небурон, нікосульфурон, норфлуразон, орбенкарб, оризалін, оксадіаргіл, оксадіазон, оксасульфурон, оксацикломефон, оксифлуорфен, паракват, пеларгонова кислота, пендиметалін, пендралін, пентоксазон, фенмедифам, піколінафен, піперофос, претилахлор, примісульфурон(-метил), профлуразол, профоксидим, прометрин, пропахлор, пропаніл, пропаквізафоп, пропізохлор, пропоксикарбазон(-натрій), пропізамід, просульфокарб, просульфурон, пірафлуфен(-етил), піразогіл, піразолат, піразосульфурон(-етил), піразоксифен, пірибензоксим, пірибутикарб, піридафол, піридат, піридатол, пірифталід, піримінобак(-метил), піритіобак(-натрій), квінхлорак, квінмерак, квінокламін, квінзалофоп(-P-етил, -P-тефурил), римсульфурон, сетоксидим, симазин, симетрин, сулькотріон, сульфентразон, сульфометурон(-метил), сульфозат, сульфосульфурон, тебутам, тебутіурон, тепралоксидим, тербутилазин, тербутрин, тенілхлор, тіазопір, тидіазимін, тифенсульфурон(-метил), тіобенкарб, тіокарбазил, тралкоксидим, триалат, триасульфурон, трибенулон(-метил), триклопір, тридифан, трифлуксисульфурон, трифлуралін, трифлусульфурон(-метил), тритосульфурон.

Крім того для змішування використовують ві-

домі захисні речовини, наприклад, AD-67, BAS-145138, беноксакор, клоквінтоцет(-мексил), ціометриніл, 2,4-D, DKA-24, дихлормід, димрон, фенклорим, фенхлоразол(-етил), флуразолі, флуксофенім, фурилазолі, ізоксадіфен(-етил), МСРА, мекопроп(-P), мефенпір(-діетил), MG-191, оксабетриніл, PPG-1292, R-29148.

Можлива також суміш з іншими відомими біологічно 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 індивідуально, у вигляді їх препаративних форм або приготованих з них шляхом подальшого розведення форм застосування, таких як готові до використання розчини, суспензії, емульсії, порошки, паста та грануляти. Застосування здійснюють звичайним способом, наприклад, шляхом поливання, обприскування, мілкокрапельного обприскування, розкидання.

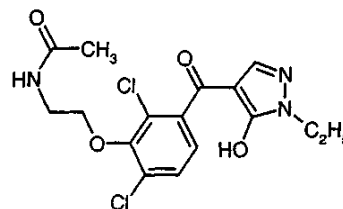
Згідно з винаходом активні речовини можна наносити як до, так і після появи сходів рослин. Їх можна також вносити перед посівом у ґрунт.

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

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

Приклади одержання:

Приклад 1



(Спосіб а))

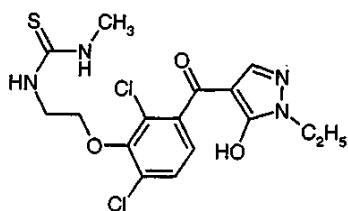
До суспензії 1,0г (2,9ммоль) [3-(2-аміноетокси)-2,4-дихлорфеніл]-(1-етил-5-гідрокси-1H-піразол-4-іл)метанону та 0,8г (5,8ммоль) карбонату калію у 6 мл ацетонітрилу додають 0,28г (3,6ммоль) ацетилхлориду та реакційну суміш перемішують протягом 24 годин при кімнатній температурі (приблизно 20°C). Після цього розчинник видаляють при пониженому тиску, а залишок розчиняють у невеликій кількості води. Водний розчин промивають дихлорметаном, потім підкислюють концентрованою соляною кислотою та екстрагують етиловим естером оцтової кислоти. Органічну фазу промивають насиченим водним розчином хлориду натрію, висушують через сульфат натрію та фільтрують. Розчинник ретельно відганяють з фільтрату при пониженому тиску.

Одержують 0,8г (71,5% від теоретичного) N-(2-{2,6-дихлор-3-[(1-етил-5-гідрокси-1H-піразол-4-іл)карбоніл]фенокси}етил)ацетаміду (приклад 1-2-

1) у вигляді жовтогарячої склоподібної твердої речовини.

Log P = 1,41.

Приклад 2



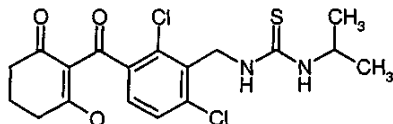
(Спосіб (a))

До суспензії 0,5г (1,45ммоль) [3-(2-аміноетокси)-2,4-дихлорфеніл]-(1-етил-5-гідрокси-1Н-піразол-4-іл)метанону у 10мл метанолу додають 0,24г (3,3ммоль) метил гірчичного масла (метилізоціанат) та реакційну суміш нагрівають до кипіння протягом 24 годин у зворотному потоці. Після додавання води та етилового естеру оцтової кислоти органічну фазу відділяють, промивають насиченим водним розчином хлориду натрію, висушують через сульфат натрію та фільтрують. Розчинник ретельно відганяють з фільтрату при пониженому тиску.

Одержують 0,55г (91% від теоретичного) N-(2-{2,6-дихлор-3-[(1-етил-5-гідрокси-1Н-піразол-4-іл)карбоніл]фенокси}етил)-N'-метилтіокарбаміду (приклад І-2-2) у вигляді жовтогарячого в'язкого масла.

Log P = 1,60.

Приклад 3



(Спосіб (b))

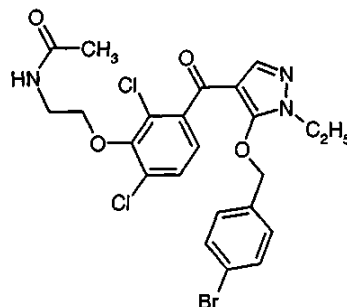
У 50мл ацетонітрилу додають 0,7г (6,25ммоль) 1,3-циклогександіону та 2,0г (6,25ммоль) N-(3-карбокси-2,6-дихлорбензил)-N'-ізопропілтіокарбаміду. У суміш додають 1,5г (7,25ммоль) дициклогексилкарбодіїміду та перемішують протягом 15 годин при кімнатній температурі (приблизно 20°C). Після цього додають 0,7г (7ммоль) триетиламіну та 0,7г (8ммоль) 2-гідрокси-2-метилпропіонітрилу, суміш знову перемішують протягом 15 годин при кімнатній температурі. Потім при перемішуванні один раз додають 50мл водного розчину карбонату калію, відганяють, а фільтрат підкислюють соляною кислотою до рівня pH=4, тричі екстрагують відповідно 30мл дихлор-

метану, об'єднані органічні фази висушують сульфатом магнію та фільтрують. Потім видаляють розчинник при пониженому тиску.

Одержують 1,1г (30% від теоретичного) N-(3-(циклогекс-1-ен-2-ол-6-он-1-ілкарбоніл)-2,4-дихлорбензил)-N'-ізопропілтіокарбамід (приклад І-2-3) у вигляді маслянистого залишку.

LogP = 2,74.

Приклад 4



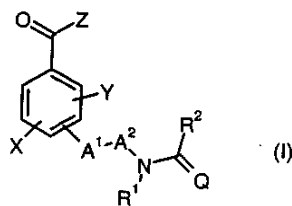
(наступна взаємодія)

До розчину 0,193г (0,5ммоль) N-(2-{2,6-дихлор-3-[(1-етил-5-гідрокси-1Н-піразол-4-іл)карбоніл]фенокси}етил)ацетаміду у 6мл толуолу додають 0,25г (1,0ммоль) 1-бром-4-(бромметил)бензолу та 0,15г 1,8-діазабіцикло[5.4.0]ундец-7-ену (DBU) та реакційну суміш нагрівають до кипіння протягом 9 годин у зворотному потоці. Фазу толуолу, що залишилася, відфільтровують, а маслянистий залишок відділяють шляхом колонкової хроматографії за допомогою дихлорметан/метанол (9:1) як розчинника.

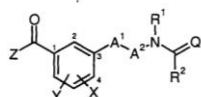
Одержують 0,12г (43% від теоретичного) N-(2-[3-({5-[(4-бромбензил)окси]-1-етил-1Н-піразол-4-іл)карбоніл]-2,6-дихлорфенокси}етил)ацетаміду (приклад І-2-4) у вигляді жовтого в'язкого масла.

Log P = 2,06.

Аналогічно до прикладів 1-4, а також відповідно до загального опису способів одержання згідно з винаходом можуть бути, наприклад, одержані наведені в таблиці 1 сполуки загальної формули (I) - або формули (I-1)-(I-3) або формул (I-2A)-(I-2D).














Таблиця 1: Приклади для сполук формули (I-2)






































(I-2)
















| Прикл. № | A <sup>1</sup> | A <sup>2</sup>                  | Q | R <sup>1</sup>                   | R <sup>2</sup>                   | (Позиція) X | (Позиція) Y | Z | Фізичні показники         |
|----------|----------------|---------------------------------|---|----------------------------------|----------------------------------|-------------|-------------|---|---------------------------|
| I-2-5    | O              | (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> | O | H                                |                                  | (2) Cl      | (4) Cl      |   | logP = 1,64 <sup>4)</sup> |
| I-2-6    | O              | (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> | O | H                                |                                  | (2) Cl      | (4) Cl      |   | logP = 1,78 <sup>4)</sup> |
| I-2-7    | O              | (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> | O | H                                |                                  | (2) Cl      | (4) Cl      |   | logP = 2,63 <sup>4)</sup> |
| I-2-8    | O              | (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> | O |                                  |                                  | (2) Cl      | (4) Cl      |   |                           |
| I-2-9    | -              | CH <sub>2</sub>                 | S | H                                |                                  | (2) Cl      | (4) Cl      |   | logP = 3,05 <sup>4)</sup> |
| I-2-10   | -              | CH <sub>2</sub>                 | O | C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> -i |                                  | (2) Cl      | (4) Cl      |   | logP = 2,86 <sup>4)</sup> |
| I-2-11   | -              | CH <sub>2</sub>                 | O | C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> -i |                                  | (2) Cl      | (4) Cl      |   | logP = 2,02 <sup>4)</sup> |
| I-2-12   | -              | CH <sub>2</sub>                 | O | C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> -i | NH <sub>2</sub>                  | (2) Cl      | (4) Cl      |   | logP = 2,03 <sup>4)</sup> |
| I-2-13   | O              | (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> | O | H                                |                                  | (2) Cl      | (4) Cl      |   | logP = 2,12 <sup>4)</sup> |
| I-2-14   | -              | CH <sub>2</sub>                 | O | C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> -i | NH <sub>2</sub>                  | (2) Cl      | (4) Cl      |   | logP = 1,32 <sup>4)</sup> |
| I-2-15   | -              | CH <sub>2</sub>                 | O | C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> -i |                                  | (2) Cl      | (4) Cl      |   | logP = 2,33 <sup>4)</sup> |
| I-2-16   | -              | CH <sub>2</sub>                 | O | C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> -i |                                  | (2) Cl      | (4) Cl      |   | logP = 1,42 <sup>4)</sup> |
| I-2-17   | -              | CH <sub>2</sub>                 | O | C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> -i | N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> | (2) Cl      | (4) Cl      |   | logP = 2,82 <sup>4)</sup> |
| I-2-18   | -              | CH <sub>2</sub>                 | O | C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> -i | N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> | (2) Cl      | (4) Cl      |   | logP = 2,00 <sup>4)</sup> |
| I-2-19   | -              | CH <sub>2</sub>                 | O | H                                |                                  | (2) Cl      | (4) Cl      |   | logP = 1,95 <sup>4)</sup> |
| I-2-20   | -              | CH <sub>2</sub>                 | O | H                                |                                  | (2) Cl      | (4) Cl      |   |                           |
| I-2-21   | -              | CH <sub>2</sub>                 | O | H                                | N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> | (2) Cl      | (4) Cl      |   | logP = 1,87 <sup>4)</sup> |
| I-2-22   | -              | CH <sub>2</sub>                 | O | H                                |                                  | (2) Cl      | (4) Cl      |   | logP = 1,35 <sup>4)</sup> |

| Прикл. № | A <sup>1</sup> | A <sup>2</sup>  | Q | R <sup>1</sup>                   | R <sup>2</sup>                   | (Позиція) X | (Позиція) Y | Z | Фізичні показники         |
|----------|----------------|-----------------|---|----------------------------------|----------------------------------|-------------|-------------|---|---------------------------|
| I-2-23   | -              | CH <sub>2</sub> | O | H                                | N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> | (2) Cl      | (4) Cl      |   | logP = 1,13 <sup>4)</sup> |
| I-2-24   | -              | CH <sub>2</sub> | O |                                  | N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> | (2) Cl      | (4) Cl      |   | logP = 2,45 <sup>4)</sup> |
| I-2-25   | -              | CH <sub>2</sub> | O |                                  | N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> | (2) Cl      | (4) Cl      |   | logP = 1,69 <sup>4)</sup> |
| I-2-26   | -              | CH <sub>2</sub> | O |                                  |                                  | (2) Cl      | (4) Cl      |   |                           |
| I-2-27   | -              | CH <sub>2</sub> | O |                                  |                                  | (2) Cl      | (4) Cl      |   |                           |
| I-2-28   | -              | CH <sub>2</sub> | O |                                  |                                  | (2) Cl      | (4) Cl      |   |                           |
| I-2-29   | -              | CH <sub>2</sub> | O |                                  |                                  | (2) Cl      | (4) Cl      |   |                           |
| I-2-30   | -              | CH <sub>2</sub> | O | H                                |                                  | (2) Cl      | (4) Cl      |   |                           |
| I-2-31   | -              | CH <sub>2</sub> | O | H                                |                                  | (2) Cl      | (4) Cl      |   |                           |
| I-2-32   | -              | CH <sub>2</sub> | O | H                                |                                  | (2) Cl      | (4) Cl      |   |                           |
| I-2-33   | -              | CH <sub>2</sub> | O | H                                |                                  | (2) Cl      | (4) Cl      |   |                           |
| I-2-34   | -              | CH <sub>2</sub> | O | H                                |                                  | (2) Cl      | (4) Cl      |   |                           |
| I-2-35   | -              | CH <sub>2</sub> | O | H                                |                                  | (2) Cl      | (4) Cl      |   |                           |
| I-2-36   | -              | CH <sub>2</sub> | O | H                                |                                  | (2) Cl      | (4) Cl      |   |                           |
| I-2-37   | -              | CH <sub>2</sub> | O | H                                |                                  | (2) Cl      | (4) Cl      |   |                           |
| I-2-38   | -              | CH <sub>2</sub> | O | CH <sub>3</sub>                  | NH <sub>2</sub>                  | (2) Cl      | (4) Cl      |   |                           |
| I-2-39   | -              | CH <sub>2</sub> | O | CH <sub>3</sub>                  | NH <sub>2</sub>                  | (2) Cl      | (4) Cl      |   |                           |
| I-2-40   | -              | CH <sub>2</sub> | O | H                                | NH <sub>2</sub>                  | (2) Cl      | (4) Cl      |   |                           |
| I-2-41   | -              | CH <sub>2</sub> | O | H                                | NH <sub>2</sub>                  | (2) Cl      | (4) Cl      |   |                           |
| I-2-42   | -              | CH <sub>2</sub> | O | C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> -i |                                  | (2) Cl      | (4) Cl      |   | logP = 4,25 <sup>4)</sup> |
| I-2-43   | -              | CH <sub>2</sub> | O | C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> -i |                                  | (2) Cl      | (4) Cl      |   | logP = 3,19 <sup>4)</sup> |






















| Прикл.<br>№ | A <sup>1</sup> | A <sup>2</sup>  | Q | R <sup>1</sup>                   | R <sup>2</sup>                       | (По-<br>зи-<br>ція)<br>X | (По-<br>зи-<br>ція)<br>Y | Z   | Фізичні<br>показники      |
|-------------|----------------|-----------------|---|----------------------------------|--------------------------------------|--------------------------|--------------------------|---|---------------------------|
| I-2-44      | -              | CH <sub>2</sub> | O | C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> -i | OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>       | (2)<br>Cl                | (4)<br>Cl                |    | logP = 3,69 <sup>43</sup> |
| I-2-45      | -              | CH <sub>2</sub> | O | C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> -i | OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>       | (2)<br>Cl                | (4)<br>Cl                |    | logP = 2,69 <sup>43</sup> |
| I-2-46      | -              | CH <sub>2</sub> | O | H                                | OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>       | (2)<br>Cl                | (4)<br>Cl                |    |                           |
| I-2-47      | -              | CH <sub>2</sub> | O | H                                | OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>       | (2)<br>Cl                | (4)<br>Cl                |    |                           |
| I-2-48      | -              | CH <sub>2</sub> | O | H                                | OC <sub>3</sub> H <sub>7</sub> -i    | (2)<br>Cl                | (4)<br>Cl                |    |                           |
| I-2-49      | -              | CH <sub>2</sub> | O | H                                | OC <sub>3</sub> H <sub>7</sub> -i    | (2)<br>Cl                | (4)<br>Cl                |    |                           |
| I-2-50      | -              | CH <sub>2</sub> | O | CH <sub>3</sub>                  | OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>       | (2)<br>Cl                | (4)<br>Cl                |    |                           |
| I-2-51      | -              | CH <sub>2</sub> | O | CH <sub>3</sub>                  | OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>       | (2)<br>Cl                | (4)<br>Cl                |   |                           |
| I-2-52      | -              | CH <sub>2</sub> | O | H                                | NHOCCH <sub>3</sub>                  | (2)<br>Cl                | (4)<br>Cl                |  |                           |
| I-2-53      | -              | CH <sub>2</sub> | O | H                                | NHOCCH <sub>3</sub>                  | (2)<br>Cl                | (4)<br>Cl                |  |                           |
| I-2-54      | -              | CH <sub>2</sub> | O | H                                | N(CH <sub>3</sub> )O-CH <sub>3</sub> | (2)<br>Cl                | (4)<br>Cl                |  |                           |






















| Прикл.<br>№ | A <sup>1</sup> | A <sup>2</sup>  | Q | R <sup>1</sup>  | R <sup>2</sup>  | (По-<br>зи-<br>ція)<br>X | (По-<br>зи-<br>ція)<br>Y               | Z   | Фізичні<br>показники      |
|-------------|----------------|-----------------|---|---|---|--------------------------|--|---|---------------------------|
| I-2-55      | -              | CH <sub>2</sub> | O | H   | N(CH <sub>3</sub> )O-CH <sub>3</sub>  | (2)<br>Cl                | (4)<br>Cl                              |  |                           |
| I-2-56      | -              | CH <sub>2</sub> | O |  |  | (2)<br>Cl                | (4)<br>Cl                              |  | logP = 2,75 <sup>43</sup> |
| I-2-57      | -              | CH <sub>2</sub> | O |  |  | (2)<br>Cl                | (4)<br>Cl                              |  |                           |
| I-2-58      | -              | CH <sub>2</sub> | S | C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> -i  |  | (2)<br>Cl                | (4)<br>Cl                              |  | logP = 1,91 <sup>43</sup> |
| I-2-59      | -              | CH <sub>2</sub> | O | CH <sub>3</sub>   |  | (2)<br>Cl                | (4)<br>Cl                              |  | logP = 1,81 <sup>43</sup> |
| I-2-60      | -              | CH <sub>2</sub> | O | CH <sub>3</sub>   |  | (2)<br>Cl                | (4)<br>Cl                              |  | logP = 1,11 <sup>43</sup> |
| I-2-61      | -              | CH <sub>2</sub> | O | CH <sub>3</sub>   | N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>  | (2)<br>Cl                | (4)<br>Cl                              |  | logP = 2,26 <sup>43</sup> |
| I-2-62      | -              | CH <sub>2</sub> | O | CH <sub>3</sub>   | N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>  | (2)<br>Cl                | (4)<br>Cl                              |  | logP = 1,48 <sup>43</sup> |
| I-2-63      | -              | CH <sub>2</sub> | S | CH <sub>3</sub>   |  | (2)<br>Cl                | (4)<br>SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> |  | logP = 1,81 <sup>43</sup> |
| I-2-64      | -              | CH <sub>2</sub> | S | CH <sub>3</sub>   |  | (2)<br>Cl                | (4)<br>SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> |  | logP = 1,00 <sup>43</sup> |
| I-2-65      | -              | CH <sub>2</sub> | O | H   | NH <sub>2</sub>   | (2)<br>Cl                | (4)<br>SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> |  | logP = 0,30 <sup>43</sup> |



















| Прикл.<br>№ | A <sup>1</sup> | A <sup>2</sup>                  | Q | R <sup>1</sup> | R <sup>2</sup>  | (По-<br>зи-<br>ція)<br>X | (По-<br>зи-<br>ція)<br>Y               | Z   | Фізичні<br>показники      |
|-------------|----------------|---------------------------------|---|----------------|---|--------------------------|--|---|---------------------------|
| I-2-66      | -              | CH <sub>2</sub>                 | O | H              |    | (2)<br>Cl                | (4)<br>SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> |    | logP = 1,57 <sup>43</sup> |
| I-2-67      | O              | (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> | O | H              | CH <sub>3</sub>   | (2)<br>Cl                | (4)<br>Cl                              |    |                           |
| I-2-68      | O              | (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> | O | H              |    | (2)<br>Cl                | (4)<br>Cl                              |    | logP = 2,28 <sup>43</sup> |
| I-2-69      | O              | (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> | O | H              | OC <sub>3</sub> H <sub>7</sub> -i   | (2)<br>Cl                | (4)<br>Cl                              |    | logP = 2,98 <sup>43</sup> |
| I-2-70      | O              | (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> | O | H              | OC <sub>3</sub> H <sub>7</sub> -i   | (2)<br>Cl                | (4)<br>Cl                              |    | logP = 2,46 <sup>43</sup> |
| I-2-71      | O              | (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> | O | H              | C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>   | (2)<br>Cl                | (4)<br>Cl                              |    |                           |
| I-2-72      | O              | (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> | O | H              | C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>   | (2)<br>Cl                | (4)<br>Cl                              |    | logP = 1,64 <sup>43</sup> |
| I-2-73      | O              | (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> | O | H              |   | (2)<br>Cl                | (4)<br>Cl                              |   | logP = 1,84 <sup>43</sup> |
| I-2-74      | O              | (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> | O | H              |  | (2)<br>Cl                | (4)<br>Cl                              |  | logP = 1,37 <sup>43</sup> |
| I-2-75      | O              | (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> | S | H              |  | (2)<br>Cl                | (4)<br>Cl                              |  | logP = 2,23 <sup>43</sup> |











| Прикл.<br>№ | A <sup>1</sup> | A <sup>2</sup>                  | Q | R <sup>1</sup>   | R <sup>2</sup>  | (По-<br>зи-<br>ція)<br>X | (По-<br>зи-<br>ція)<br>Y               | Z   | Фізичні<br>показники      |
|-------------|----------------|---------------------------------|---|------------------|---|--------------------------|--|---|---------------------------|
| I-2-76      | O              | (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> | S | H                |  | (2)<br>Cl                | (4)<br>Cl                              |  | logP = 1,73 <sup>43</sup> |
| I-2-77      | O              | (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> | O | H                | CF <sub>3</sub>   | (2)<br>Cl                | (4)<br>Cl                              |  |                           |
| I-2-78      | O              | (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> | O | H                | CF <sub>3</sub>   | (2)<br>Cl                | (4)<br>Cl                              |  |                           |
| I-2-79      | -              | CH <sub>2</sub>                 | O | H                | NH <sub>2</sub>   | (2)<br>Cl                | (4)<br>SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> |  | logP = 1,23 <sup>43</sup> |
| I-2-80      | -              | CH <sub>2</sub>                 | O | H                |  | (2)<br>Cl                | (4)<br>SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> |  | logP = 0,74 <sup>43</sup> |
| I-2-81      | -              | CH <sub>2</sub>                 | O | H                |  | (2)<br>Cl                | (4)<br>SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> |  | logP = 1,58 <sup>43</sup> |
| I-2-82      | -              | CH <sub>2</sub>                 | O | H                | N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>  | (2)<br>Cl                | (4)<br>SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> |  | logP = 1,58 <sup>43</sup> |
| I-2-83      | -              | CH <sub>2</sub>                 | O | H                | N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>  | (2)<br>Cl                | (4)<br>SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> |  | logP = 0,77 <sup>43</sup> |
| I-2-84      | -              | CH <sub>2</sub>                 | O | OCH <sub>3</sub> |  | (2)<br>Cl                | (4)<br>Cl                              |  |                           |
| I-2-85      | -              | CH <sub>2</sub>                 | O | OCH <sub>3</sub> |  | (2)<br>Cl                | (4)<br>Cl                              |  |                           |



| Прикл.<br>№ | A <sup>1</sup> | A <sup>2</sup>  | Q | R <sup>1</sup>  | R <sup>2</sup>  | (Пози-<br>ція)<br>X | (Пози-<br>ція)<br>Y                    | Z   | Фізичні<br>показники |
|-------------|----------------|-----------------|---|---|---|---------------------|--|---|----------------------|
| I-2-86      | -              | CH <sub>2</sub> | O | OCH <sub>3</sub>  |    | (2)<br>Cl           | (4)<br>SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> |    |                      |
| I-2-87      | -              | CH <sub>2</sub> | O | OCH <sub>3</sub>  |    | (2)<br>Cl           | (4)<br>SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> |    |                      |
| I-2-88      | -              | CH <sub>2</sub> | O | OCH <sub>3</sub>  |    | (2)<br>Cl           | (4)<br>Cl                              |    |                      |
| I-2-89      | -              | CH <sub>2</sub> | O | OCH <sub>3</sub>  |    | (2)<br>Cl           | (4)<br>Cl                              |    |                      |
| I-2-90      | -              | CH <sub>2</sub> | O | OCH <sub>3</sub>  |    | (2)<br>Cl           | (4)<br>SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> |    |                      |
| I-2-91      | -              | CH <sub>2</sub> | O | OCH <sub>3</sub>  |    | (2)<br>Cl           | (4)<br>SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> |    |                      |
| I-2-92      | -              | CH <sub>2</sub> | O | H   | N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>  | (2)<br>Cl           | (4)<br>SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> |    |                      |
| I-2-93      | -              | CH <sub>2</sub> | O | H   | N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>  | (2)<br>Cl           | (4)<br>SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> |    |                      |
| I-2-94      | -              | CH <sub>2</sub> | O | H   |  | (2)<br>Cl           | (4)<br>SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> |  |                      |
| I-2-95      | -              | CH <sub>2</sub> | O | H   |  | (2)<br>Cl           | (4)<br>SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> |  |                      |
| I-2-96      | -              | CH <sub>2</sub> | O |  |  | (2)<br>Cl           | (4)<br>SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> |  |                      |

| Прикл.<br>№ | A <sup>1</sup> | A <sup>2</sup>  | Q | R <sup>1</sup>  | R <sup>2</sup>  | (Пози-<br>ція)<br>X | (Пози-<br>ція)<br>Y                    | Z   | Фізичні<br>показники |
|-------------|----------------|-----------------|---|---|---|---------------------|--|---|----------------------|
| I-2-97      | -              | CH <sub>2</sub> | O |  |  | (2)<br>Cl           | (4)<br>SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> |  |                      |
| I-2-98      | -              | CH <sub>2</sub> | O |  | NHCH <sub>3</sub>   | (2)<br>Cl           | (4)<br>SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> |  |                      |
| I-2-99      | -              | CH <sub>2</sub> | O |  | NHCH <sub>3</sub>   | (2)<br>Cl           | (4)<br>SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> |  |                      |
| I-2-100     | -              | CH <sub>2</sub> | O |  | NH <sub>2</sub>   | (2)<br>Cl           | (4)<br>SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> |  |                      |
| I-2-101     | -              | CH <sub>2</sub> | O |  | NH <sub>2</sub>   | (2)<br>Cl           | (4)<br>SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> |  |                      |
| I-2-102     | -              | CH <sub>2</sub> | O |  | N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>  | (2)<br>Cl           | (4)<br>SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> |  |                      |
| I-2-103     | -              | CH <sub>2</sub> | O |  | N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>  | (2)<br>Cl           | (4)<br>SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> |  |                      |
| I-2-104     | -              | CH <sub>2</sub> | O | CH <sub>3</sub>   | NHC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>   | (2)<br>Cl           | (4)<br>SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> |  |                      |
| I-2-105     | -              | CH <sub>2</sub> | O | CH <sub>3</sub>   | NHCH <sub>3</sub>   | (2)<br>Cl           | (4)<br>SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> |  |                      |
| I-2-106     | -              | CH <sub>2</sub> | O | H   |  | (2)<br>Cl           | (4)<br>SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> |  |                      |
| I-2-107     | -              | CH <sub>2</sub> | O | H   |  | (2)<br>Cl           | (4)<br>SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> |  |                      |

| Прикл.<br>№ | A <sup>1</sup> | A <sup>2</sup>  | Q | R <sup>1</sup>   | R <sup>2</sup>  | (Пози-<br>ція)<br>X | (Пози-<br>ція)<br>Y                    | Z   | Фізичні<br>показники |
|-------------|----------------|-----------------|---|--|---|---------------------|--|---|----------------------|
| I-2-108     | -              | CH <sub>2</sub> | O | H  |  | (2)<br>Cl           | (4)<br>SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> |    |                      |
| I-2-109     | -              | CH <sub>2</sub> | O | H  |  | (2)<br>Cl           | (4)<br>SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> |    |                      |
| I-2-110     | -              | CH <sub>2</sub> | O | H  |  | (2)<br>Cl           | (4)<br>SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> |    |                      |
| I-2-111     | -              | CH <sub>2</sub> | O | H  |  | (2)<br>Cl           | (4)<br>SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> |    |                      |
| I-2-112     | -              | CH <sub>2</sub> | O |  | NHCH <sub>3</sub>   | (2)<br>Cl           | (4)<br>SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> |    |                      |
| I-2-113     | -              | CH <sub>2</sub> | O |  | NHCH <sub>3</sub>   | (2)<br>Cl           | (4)<br>SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> |    |                      |
| I-2-114     | -              | CH <sub>2</sub> | O |  | N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>  | (2)<br>Cl           | (4)<br>SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> |    |                      |
| I-2-115     | -              | CH <sub>2</sub> | O |  | N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>  | (2)<br>Cl           | (4)<br>SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> |    |                      |
| I-2-116     | -              | CH <sub>2</sub> | O | H  | NH <sub>2</sub>   | (2)<br>Cl           | (4)<br>SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> |  |                      |
| I-2-117     | -              | CH <sub>2</sub> | O | H  | NH <sub>2</sub>   | (2)<br>Cl           | (4)<br>SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> |  |                      |

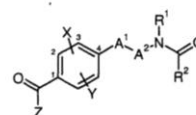
| Прикл.<br>№ | A <sup>1</sup> | A <sup>2</sup>                  | Q | R <sup>1</sup>   | R <sup>2</sup>    | (Пози-<br>ція)<br>X | (Пози-<br>ція)<br>Y                    | Z   | Фізичні<br>показники      |
|-------------|----------------|---------------------------------|---|------------------|-------------------|---------------------|--|---|---------------------------|
| I-2-118     | O              | (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> | O | H                | NH <sub>2</sub>   | (2)<br>Cl           | (4)<br>Cl                              |  | logP = 1,66 <sup>4)</sup> |
| I-2-119     | O              | (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> | O | H                | NH <sub>2</sub>   | (2)<br>Cl           | (4)<br>Cl                              |  | logP = 1,22 <sup>4)</sup> |
| I-2-120     | -              | CH <sub>2</sub>                 | O | OCH <sub>3</sub> | NH <sub>2</sub>   | (2)<br>Cl           | (4)<br>Cl                              |  |                           |
| I-2-121     | -              | CH <sub>2</sub>                 | O | OCH <sub>3</sub> | NH <sub>2</sub>   | (2)<br>Cl           | (4)<br>Cl                              |  |                           |
| I-2-122     | -              | CH <sub>2</sub>                 | O | OCH <sub>3</sub> | NH <sub>2</sub>   | (2)<br>Cl           | (4)<br>SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> |  |                           |
| I-2-123     | -              | CH <sub>2</sub>                 | O | OCH <sub>3</sub> | NH <sub>2</sub>   | (2)<br>Cl           | (4)<br>SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> |  |                           |
| I-2-124     | -              | CH <sub>2</sub>                 | O | OCH <sub>3</sub> | NHCH <sub>3</sub> | (2)<br>Cl           | (4)<br>Cl                              |  |                           |
| I-2-125     | -              | CH <sub>2</sub>                 | O | OCH <sub>3</sub> | NHCH <sub>3</sub> | (2)<br>Cl           | (4)<br>Cl                              |  |                           |
| I-2-126     | -              | CH <sub>2</sub>                 | O | OCH <sub>3</sub> | NHCH <sub>3</sub> | (2)<br>Cl           | (4)<br>SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> |  |                           |
| I-2-127     | -              | CH <sub>2</sub>                 | O | OCH <sub>3</sub> | NHCH <sub>3</sub> | (2)<br>Cl           | (4)<br>SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> |  |                           |

| Прикл.<br>№ | A <sup>1</sup> | A <sup>2</sup>  | Q | R <sup>1</sup>   | R <sup>2</sup>                   | (Пози-<br>ція)<br>X | (Пози-<br>ція)<br>Y                    | Z | Фізичні<br>показники |
|-------------|----------------|-----------------|---|------------------|----------------------------------|---------------------|--|---|----------------------|
| I-2-128     | -              | CH <sub>2</sub> | O | OCH <sub>3</sub> | N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> | (2)<br>Cl           | (4)<br>Cl                              |   |                      |
| I-2-129     | -              | CH <sub>2</sub> | O | OCH <sub>3</sub> | N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> | (2)<br>Cl           | (4)<br>Cl                              |   |                      |
| I-2-130     | -              | CH <sub>2</sub> | O | OCH <sub>3</sub> | N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> | (2)<br>Cl           | (4)<br>SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> |   |                      |
| I-2-131     | -              | CH <sub>2</sub> | O | OCH <sub>3</sub> | N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> | (2)<br>Cl           | (4)<br>SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> |   |                      |
| I-2-132     | -              | CH <sub>2</sub> | O | OCH <sub>3</sub> |                                  | (2)<br>Cl           | (4)<br>Cl                              |   |                      |
| I-2-133     | -              | CH <sub>2</sub> | O | OCH <sub>3</sub> |                                  | (2)<br>Cl           | (4)<br>Cl                              |   |                      |
| I-2-134     | -              | CH <sub>2</sub> | O | OCH <sub>3</sub> |                                  | (2)<br>Cl           | (4)<br>SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> |   |                      |
| I-2-135     | -              | CH <sub>2</sub> | O | OCH <sub>3</sub> |                                  | (2)<br>Cl           | (4)<br>SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> |   |                      |
| I-2-136     | -              | CH <sub>2</sub> | O | OCH <sub>3</sub> |                                  | (2)<br>Cl           | (4)<br>Cl                              |   |                      |
| I-2-137     | -              | CH <sub>2</sub> | O | OCH <sub>3</sub> |                                  | (2)<br>Cl           | (4)<br>Cl                              |   |                      |

| Прикл.<br>№ | A <sup>1</sup> | A <sup>2</sup>                  | Q | R <sup>1</sup>   | R <sup>2</sup>                | (Пози-<br>ція)<br>X | (Пози-<br>ція)<br>Y                    | Z | Фізичні<br>показники      |
|-------------|----------------|---------------------------------|---|------------------|-------------------------------|---------------------|--|---|---------------------------|
| I-2-138     | -              | CH <sub>2</sub>                 | O | OCH <sub>3</sub> |                               | (2)<br>Cl           | (4)<br>SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> |   |                           |
| I-2-139     | -              | CH <sub>2</sub>                 | O | OCH <sub>3</sub> |                               | (2)<br>Cl           | (4)<br>SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> |   |                           |
| I-2-140     | -              | CH <sub>2</sub>                 | O | H                |                               | (2)<br>Cl           | (4)<br>SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> |   | logP = 2,35 <sup>4)</sup> |
| I-2-141     | O              | (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> | O | H                | CH <sub>3</sub>               | (2)<br>Cl           | (4)<br>SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> |   |                           |
| I-2-142     | O              | (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> | O | H                | CH <sub>3</sub>               | (2)<br>Cl           | (4)<br>SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> |   |                           |
| I-2-143     | O              | (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> | O | H                | C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | (2)<br>Cl           | (4)<br>SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> |   |                           |
| I-2-144     | O              | (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> | O | H                | C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | (2)<br>Cl           | (4)<br>SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> |   |                           |
| I-2-145     | O              |                                 | O | H                | CH <sub>3</sub>               | (2)<br>Cl           | (4)<br>Cl                              |   |                           |
| I-2-146     | O              |                                 | O | H                | CH <sub>3</sub>               | (2)<br>Cl           | (4)<br>Cl                              |   |                           |
| I-2-147     | O              |                                 | O | H                | C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | (2)<br>Cl           | (4)<br>Cl                              |   |                           |

| Прикл.<br>№ | A <sup>1</sup> | A <sup>2</sup> | Q | R <sup>1</sup> | R <sup>2</sup>                | (Пози-<br>ція)<br>X | (Пози-<br>ція)<br>Y                    | Z | Фізичні<br>показники |
|-------------|----------------|----------------|---|----------------|-------------------------------|---------------------|--|---|----------------------|
| I-2-148     | O              |                | O | H              | C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | (2)<br>Cl           | (4)<br>Cl                              |   |                      |
| I-2-149     | O              |                | O | H              | CH <sub>3</sub>               | (2)<br>Cl           | (4)<br>SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> |   |                      |
| I-2-150     | O              |                | O | H              | CH <sub>3</sub>               | (2)<br>Cl           | (4)<br>SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> |   |                      |
| I-2-151     | O              |                | O | H              | C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | (2)<br>Cl           | (4)<br>SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> |   |                      |
| I-2-152     | O              |                | O | H              | C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | (2)<br>Cl           | (4)<br>SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> |   |                      |

Таблиця 2: Приклади для сполук формули (I-3)



| Прикл.<br>№ | A <sup>1</sup> | A <sup>2</sup>                  | Q | R <sup>1</sup>                   | R <sup>2</sup>                   | (Пози-<br>ція)<br>X    | (Пози-<br>ція)<br>Y | Z | Фізичні<br>показники      |
|-------------|----------------|---------------------------------|---|----------------------------------|----------------------------------|------------------------|---------------------|---|---------------------------|
| I-3-1       | -              | CH <sub>2</sub>                 | O | H                                | NH-NO <sub>2</sub>               | (2)<br>NO <sub>2</sub> | -                   |   | Тпл.: 191°C               |
| I-3-2       | -              | CH <sub>2</sub>                 | O | CH <sub>3</sub>                  | NHCH <sub>3</sub>                | (2)<br>NO <sub>2</sub> | -                   |   |                           |
| I-3-3       | -              | CH <sub>2</sub>                 | O | C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>    | NHC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>  | (2)<br>NO <sub>2</sub> | -                   |   |                           |
| I-3-4       | -              | (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> | O | H                                | CH <sub>3</sub>                  | (2)<br>NO <sub>2</sub> | -                   |   |                           |
| I-3-5       | -              | CH <sub>2</sub>                 | O | C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> -i |                                  | (2)<br>NO <sub>2</sub> | -                   |   | logP = 2,53 <sup>4)</sup> |
| I-3-6       | -              | CH <sub>2</sub>                 | O | C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> -i |                                  | (2)<br>NO <sub>2</sub> | -                   |   | logP = 1,64 <sup>4)</sup> |
| I-3-7       | -              | CH <sub>2</sub>                 | O | C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> -i | N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> | (2)<br>NO <sub>2</sub> | -                   |   | logP = 1,63 <sup>4)</sup> |
| I-3-8       | -              | CH <sub>2</sub>                 | O |                                  | NHC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>  | (2)<br>NO <sub>2</sub> | -                   |   | logP = 2,60 <sup>4)</sup> |
| I-3-9       | -              | CH <sub>2</sub>                 | O |                                  | NHC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>  | (2)<br>NO <sub>2</sub> | -                   |   | logP = 1,75 <sup>4)</sup> |

| Прим.<br>№ | A <sup>1</sup> | A <sup>2</sup>  | Q | R <sup>1</sup> | R <sup>2</sup>                       | (Пози-<br>ция)<br>X    | (Пози-<br>ция)<br>Y | Z | Фізичні<br>показники      |
|------------|----------------|-----------------|---|----------------|--------------------------------------|------------------------|---------------------|---|---------------------------|
| I-3-10     | -              | CH <sub>2</sub> | O |                | <br>C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -I | (2)<br>NO <sub>2</sub> | -                   |   | logP = 2,94 <sup>2)</sup> |
| I-3-11     | -              | CH <sub>2</sub> | O |                | <br>C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -I | (2)<br>NO <sub>2</sub> | -                   |   | logP = 2,05 <sup>2)</sup> |
| I-3-12     | -              | CH <sub>2</sub> | O | H              | N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>     | (2)<br>NO <sub>2</sub> | -                   |   |                           |
| I-3-13     | -              | CH <sub>2</sub> | O | H              | N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>     | (2)<br>NO <sub>2</sub> | -                   |   |                           |
| I-3-14     | -              | CH <sub>2</sub> | O | H              | <br>C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -I | (2)<br>NO <sub>2</sub> | -                   |   |                           |
| I-3-15     | -              | CH <sub>2</sub> | O | H              | <br>C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -I | (2)<br>NO <sub>2</sub> | -                   |   |                           |
| I-3-16     | -              | CH <sub>2</sub> | O |                | <br>C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -I | (2)<br>NO <sub>2</sub> | -                   |   |                           |
| I-3-17     | -              | CH <sub>2</sub> | O |                | <br>C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -I | (2)<br>NO <sub>2</sub> | -                   |   |                           |
| I-3-18     | -              | CH <sub>2</sub> | O |                | NHCH <sub>3</sub>                    | (2)<br>NO <sub>2</sub> | -                   |   |                           |
| I-3-19     | -              | CH <sub>2</sub> | O |                | NHCH <sub>3</sub>                    | (2)<br>NO <sub>2</sub> | -                   |   |                           |
| I-3-20     | -              | CH <sub>2</sub> | O |                | NH <sub>2</sub>                      | (2)<br>NO <sub>2</sub> | -                   |   |                           |

| Прим.<br>№ | A <sup>1</sup> | A <sup>2</sup>  | Q | R <sup>1</sup>  | R <sup>2</sup>                   | (Пози-<br>ция)<br>X    | (Пози-<br>ция)<br>Y | Z | Фізичні<br>показники      |
|------------|----------------|-----------------|---|-----------------|----------------------------------|------------------------|---------------------|---|---------------------------|
| I-3-21     | -              | CH <sub>2</sub> | O |                 | NH <sub>2</sub>                  | (2)<br>NO <sub>2</sub> | -                   |   |                           |
| I-3-22     | -              | CH <sub>2</sub> | O |                 | N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> | (2)<br>NO <sub>2</sub> | -                   |   |                           |
| I-3-23     | -              | CH <sub>2</sub> | O |                 | N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> | (2)<br>NO <sub>2</sub> | -                   |   |                           |
| I-3-24     | -              | CH <sub>2</sub> | O | CH <sub>3</sub> | NHC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>  | (2)<br>NO <sub>2</sub> | -                   |   |                           |
| I-3-25     | -              | CH <sub>2</sub> | O | CH <sub>3</sub> | NHCH <sub>3</sub>                | (2)<br>NO <sub>2</sub> | -                   |   | logP = 0,68 <sup>2)</sup> |
| I-3-26     | -              | CH <sub>2</sub> | O | H               |                                  | (2)<br>NO <sub>2</sub> | -                   |   |                           |
| I-3-27     | -              | CH <sub>2</sub> | O | H               |                                  | (2)<br>NO <sub>2</sub> | -                   |   |                           |
| I-3-28     | -              | CH <sub>2</sub> | O | H               |                                  | (2)<br>NO <sub>2</sub> | -                   |   |                           |
| I-3-29     | -              | CH <sub>2</sub> | O | H               |                                  | (2)<br>NO <sub>2</sub> | -                   |   |                           |
| I-3-30     | -              | CH <sub>2</sub> | O | H               |                                  | (2)<br>NO <sub>2</sub> | -                   |   |                           |
| I-3-31     | -              | CH <sub>2</sub> | O | H               |                                  | (2)<br>NO <sub>2</sub> | -                   |   |                           |
| I-3-32     | -              | CH <sub>2</sub> | O |                 | NHCH <sub>3</sub>                | (2)<br>NO <sub>2</sub> | -                   |   |                           |

| Прим.<br>№ | A <sup>1</sup> | A <sup>2</sup>  | Q | R <sup>1</sup>                   | R <sup>2</sup>                   | (Пози-<br>ция)<br>X    | (Пози-<br>ция)<br>Y | Z | Фізичні<br>показники      |
|------------|----------------|-----------------|---|----------------------------------|----------------------------------|------------------------|---------------------|---|---------------------------|
| I-3-33     | -              | CH <sub>2</sub> | O |                                  | NHCH <sub>3</sub>                | (2)<br>NO <sub>2</sub> | -                   |   |                           |
| I-3-34     | -              | CH <sub>2</sub> | O |                                  | N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> | (2)<br>NO <sub>2</sub> | -                   |   |                           |
| I-3-35     | -              | CH <sub>2</sub> | O |                                  | N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> | (2)<br>NO <sub>2</sub> | -                   |   |                           |
| I-3-36     | -              | CH <sub>2</sub> | O | H                                | NH <sub>2</sub>                  | (2)<br>NO <sub>2</sub> | -                   |   |                           |
| I-3-37     | -              | CH <sub>2</sub> | O | H                                | NH <sub>2</sub>                  | (2)<br>NO <sub>2</sub> | -                   |   |                           |
| I-3-38     | -              | CH <sub>2</sub> | O | CH <sub>3</sub>                  | NHC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>  | (2)<br>NO <sub>2</sub> | -                   |   |                           |
| I-3-39     | -              | CH <sub>2</sub> | O | C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -I |                                  | (2)<br>NO <sub>2</sub> | -                   |   | logP = 3,53 <sup>2)</sup> |
| I-3-40     | -              | CH <sub>2</sub> | O | C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -I |                                  | (2)<br>NO <sub>2</sub> | -                   |   | logP = 2,59 <sup>2)</sup> |
| I-3-41     | -              | CH <sub>2</sub> | O | C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -I | OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>   | (2)<br>NO <sub>2</sub> | -                   |   | logP = 3,04 <sup>2)</sup> |
| I-3-42     | -              | CH <sub>2</sub> | O | C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -I | OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>   | (2)<br>NO <sub>2</sub> | -                   |   | logP = 2,06 <sup>2)</sup> |

| Прим.<br>№ | A <sup>1</sup> | A <sup>2</sup>  | Q | R <sup>1</sup>                   | R <sup>2</sup>                          | (Пози-<br>ция)<br>X    | (Пози-<br>ция)<br>Y | Z | Фізичні<br>показники |
|------------|----------------|-----------------|---|----------------------------------|---|------------------------|---------------------|---|----------------------|
| I-3-43     | -              | CH <sub>2</sub> | O | H                                | OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>          | (2)<br>NO <sub>2</sub> | -                   |   |                      |
| I-3-44     | -              | CH <sub>2</sub> | O | H                                | OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>          | (2)<br>NO <sub>2</sub> | -                   |   |                      |
| I-3-45     | -              | CH <sub>2</sub> | O | H                                | OC <sub>3</sub> H <sub>7</sub> -I       | (2)<br>NO <sub>2</sub> | -                   |   |                      |
| I-3-46     | -              | CH <sub>2</sub> | O | H                                | OC <sub>3</sub> H <sub>7</sub> -I       | (2)<br>NO <sub>2</sub> | -                   |   |                      |
| I-3-47     | -              | CH <sub>2</sub> | O | CH <sub>3</sub>                  | OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>          | (2)<br>NO <sub>2</sub> | -                   |   |                      |
| I-3-48     | -              | CH <sub>2</sub> | O | CH <sub>3</sub>                  | OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>          | (2)<br>NO <sub>2</sub> | -                   |   |                      |
| I-3-49     | -              | CH <sub>2</sub> | O | H                                | NHOCH <sub>3</sub>                      | (2)<br>NO <sub>2</sub> | -                   |   |                      |
| I-3-50     | -              | CH <sub>2</sub> | O | H                                | NHOCH <sub>3</sub>                      | (2)<br>NO <sub>2</sub> | -                   |   |                      |
| I-3-51     | -              | CH <sub>2</sub> | O | H                                | N(CH <sub>3</sub> )O<br>CH <sub>3</sub> | (2)<br>NO <sub>2</sub> | -                   |   |                      |
| I-3-52     | -              | CH <sub>2</sub> | O | H                                | N(CH <sub>3</sub> )O<br>CH <sub>3</sub> | (2)<br>NO <sub>2</sub> | -                   |   |                      |
| I-3-53     | -              | CH <sub>2</sub> | O | C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -I | <br>C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -I    | (2)<br>CF <sub>3</sub> | -                   |   |                      |
| I-3-54     | -              | CH <sub>2</sub> | O | C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -I | <br>C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -I    | (2)<br>CF <sub>3</sub> | -                   |   |                      |

| Прим.<br>№ | A <sup>1</sup> | A <sup>2</sup>  | Q | R <sup>1</sup>                   | R <sup>2</sup>                   | (Пози-<br>ція)<br>X    | (Пози-<br>ція)<br>Y | Z | Фізичні<br>показники |
|------------|----------------|-----------------|---|----------------------------------|----------------------------------|------------------------|---------------------|---|----------------------|
| I-3-55     | -              | CH <sub>2</sub> | O | C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> -i |                                  | (2)<br>CF <sub>3</sub> | -                   |   |                      |
| I-3-56     | -              | CH <sub>2</sub> | O | C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> -i |                                  | (2)<br>CF <sub>3</sub> | -                   |   |                      |
| I-3-57     | -              | CH <sub>2</sub> | O | H                                | N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> | (2)<br>CF <sub>3</sub> | -                   |   |                      |
| I-3-58     | -              | CH <sub>2</sub> | O | H                                | N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> | (2)<br>CF <sub>3</sub> | -                   |   |                      |
| I-3-59     | -              | CH <sub>2</sub> | O | H                                |                                  | (2)<br>CF <sub>3</sub> | -                   |   |                      |
| I-3-60     | -              | CH <sub>2</sub> | O | H                                |                                  | (2)<br>CF <sub>3</sub> | -                   |   |                      |
| I-3-61     | -              | CH <sub>2</sub> | O | H                                |                                  | (2)<br>CF <sub>3</sub> | -                   |   |                      |
| I-3-62     | -              | CH <sub>2</sub> | O | H                                |                                  | (2)<br>CF <sub>3</sub> | -                   |   |                      |
| I-3-63     | -              | CH <sub>2</sub> | O | H                                |                                  | (2)<br>CF <sub>3</sub> | -                   |   |                      |
| I-3-64     | -              | CH <sub>2</sub> | O | H                                |                                  | (2)<br>CF <sub>3</sub> | -                   |   |                      |

| Прим.<br>№ | A <sup>1</sup> | A <sup>2</sup>  | Q | R <sup>1</sup>                   | R <sup>2</sup>                 | (Пози-<br>ція)<br>X    | (Пози-<br>ція)<br>Y | Z | Фізичні<br>показники |
|------------|----------------|-----------------|---|----------------------------------|--------------------------------|------------------------|---------------------|---|----------------------|
| I-3-65     | -              | CH <sub>2</sub> | O | H                                |                                | (2)<br>CF <sub>3</sub> | -                   |   |                      |
| I-3-66     | -              | CH <sub>2</sub> | O | H                                |                                | (2)<br>CF <sub>3</sub> | -                   |   |                      |
| I-3-67     | -              | CH <sub>2</sub> | O | H                                |                                | (2)<br>CF <sub>3</sub> | -                   |   |                      |
| I-3-68     | -              | CH <sub>2</sub> | O | H                                |                                | (2)<br>CF <sub>3</sub> | -                   |   |                      |
| I-3-69     | -              | CH <sub>2</sub> | O | H                                |                                | (2)<br>CF <sub>3</sub> | -                   |   |                      |
| I-3-70     | -              | CH <sub>2</sub> | O | H                                |                                | (2)<br>CF <sub>3</sub> | -                   |   |                      |
| I-3-71     | -              | CH <sub>2</sub> | O | H                                | OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | (2)<br>CF <sub>3</sub> | -                   |   |                      |
| I-3-72     | -              | CH <sub>2</sub> | O | H                                | OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | (2)<br>CF <sub>3</sub> | -                   |   |                      |
| I-3-73     | -              | CH <sub>2</sub> | O | C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> -i |                                | (2)<br>CF <sub>3</sub> | -                   |   |                      |
| I-3-74     | -              | CH <sub>2</sub> | O | C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> -i |                                | (2)<br>CF <sub>3</sub> | -                   |   |                      |

| Прим.<br>№ | A <sup>1</sup> | A <sup>2</sup>  | Q | R <sup>1</sup>                   | R <sup>2</sup>                          | (Пози-<br>ція)<br>X    | (Пози-<br>ція)<br>Y | Z | Фізичні<br>показники |
|------------|----------------|-----------------|---|----------------------------------|---|------------------------|---------------------|---|----------------------|
| I-3-75     | -              | CH <sub>2</sub> | O | C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> -i | OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>          | (2)<br>CF <sub>3</sub> | -                   |   |                      |
| I-3-76     | -              | CH <sub>2</sub> | O | C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> -i | OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>          | (2)<br>CF <sub>3</sub> | -                   |   |                      |
| I-3-77     | -              | CH <sub>2</sub> | O | H                                | OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>          | (2)<br>CF <sub>3</sub> | -                   |   |                      |
| I-3-78     | -              | CH <sub>2</sub> | O | H                                | OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>          | (2)<br>CF <sub>3</sub> | -                   |   |                      |
| I-3-79     | -              | CH <sub>2</sub> | O | H                                | OC <sub>3</sub> H <sub>7</sub> -i       | (2)<br>CF <sub>3</sub> | -                   |   |                      |
| I-3-80     | -              | CH <sub>2</sub> | O | H                                | OC <sub>3</sub> H <sub>7</sub> -i       | (2)<br>CF <sub>3</sub> | -                   |   |                      |
| I-3-81     | -              | CH <sub>2</sub> | O | CH <sub>3</sub>                  | OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>          | (2)<br>CF <sub>3</sub> | -                   |   |                      |
| I-3-82     | -              | CH <sub>2</sub> | O | CH <sub>3</sub>                  | OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>          | (2)<br>CF <sub>3</sub> | -                   |   |                      |
| I-3-83     | -              | CH <sub>2</sub> | O | H                                | NHOCCH <sub>3</sub>                     | (2)<br>CF <sub>3</sub> | -                   |   |                      |
| I-3-84     | -              | CH <sub>2</sub> | O | H                                | NHOCCH <sub>3</sub>                     | (2)<br>CF <sub>3</sub> | -                   |   |                      |
| I-3-85     | -              | CH <sub>2</sub> | O | H                                | N(CH <sub>3</sub> )O<br>CH <sub>3</sub> | (2)<br>CF <sub>3</sub> | -                   |   |                      |
| I-3-86     | -              | CH <sub>2</sub> | O | H                                | N(CH <sub>3</sub> )O<br>CH <sub>3</sub> | (2)<br>CF <sub>3</sub> | -                   |   |                      |

| Прим.<br>№ | A <sup>1</sup> | A <sup>2</sup>  | Q | R <sup>1</sup>  | R <sup>2</sup>                   | (Пози-<br>ція)<br>X    | (Пози-<br>ція)<br>Y | Z | Фізичні<br>показники |
|------------|----------------|-----------------|---|-----------------|----------------------------------|------------------------|---------------------|---|----------------------|
| I-3-87     | -              | CH <sub>2</sub> | O |                 | NHCH <sub>3</sub>                | (2)<br>CF <sub>3</sub> | -                   |   |                      |
| I-3-88     | -              | CH <sub>2</sub> | O |                 | NHCH <sub>3</sub>                | (2)<br>CF <sub>3</sub> | -                   |   |                      |
| I-3-89     | -              | CH <sub>2</sub> | O |                 | N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> | (2)<br>CF <sub>3</sub> | -                   |   |                      |
| I-3-90     | -              | CH <sub>2</sub> | O |                 | N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> | (2)<br>CF <sub>3</sub> | -                   |   |                      |
| I-3-91     | -              | CH <sub>2</sub> | O |                 | OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>   | (2)<br>CF <sub>3</sub> | -                   |   |                      |
| I-3-92     | -              | CH <sub>2</sub> | O |                 | OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>   | (2)<br>CF <sub>3</sub> | -                   |   |                      |
| I-3-93     | -              | CH <sub>2</sub> | O | CH <sub>3</sub> | NHCH <sub>3</sub>                | (2)<br>CF <sub>3</sub> | -                   |   |                      |
| I-3-94     | -              | CH <sub>2</sub> | O | CH <sub>3</sub> | NHCH <sub>3</sub>                | (2)<br>CF <sub>3</sub> | -                   |   |                      |
| I-3-95     | -              | CH <sub>2</sub> | O | CH <sub>3</sub> | N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> | (2)<br>CF <sub>3</sub> | -                   |   |                      |
| I-3-96     | -              | CH <sub>2</sub> | O | CH <sub>3</sub> | N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> | (2)<br>CF <sub>3</sub> | -                   |   |                      |

Визначення вказаних в таблицях значень  $\log P$  відбувається згідно з EEC-Directive 79/831 Annex V.A8 за допомогою HPLC (High Performance Liquid Chromatography) на колоні інверсії фаз (C 18). Температура: 43°C.

(а) Елюент для визначення у кислому середовищі: 0,1% водний розчин фосфорної кислоти, ацетонітрил; лінійний градієнт від 10% ацетонітрилу до 90% ацетонітрилу - відповідні результати вимірювання вказані в таблицях 1 та 2 позначкою <sup>a)</sup>.

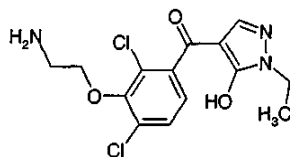
(b) елюент для визначення у нейтральному середовищі: 0,01-молярний водний розчин фосфатного буферу, ацетонітрил; лінійний градієнт від 10% ацетонітрилу до 90% ацетонітрилу - відповідні результати вимірювання вказані в таблицях 1 та 2 позначкою <sup>b)</sup>.

Калібрування відбувається за допомогою нерозгалужених алкан-2-онів (що містить 3-16 атомів вуглецю),  $\log P$ -значення якого відомі (визначення  $\log P$ -значень на основі часу утримування шляхом лінійної інтерполяції між двома розташованими один за одним алканонами).

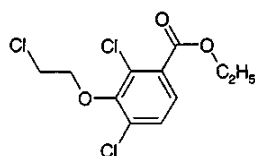
$\lambda$ -макс-значення визначають на основі УФ-спектрів від 200нм до 400нм максимальних сигналів хроматографу.

Вихідні речовини Формули (II):

Приклад (11-1)



Стадія 1

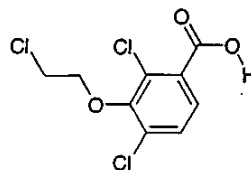


До розчину 10,0г (42,5ммоль) етилового естеру 2,4-дихлор-3-гідроксибензойної кислоти у 100мл ацетонітрилу додають 11,7г (85,1ммоль) карбонату калію та через 15 хвилин додають 11,0г (46,9ммоль) 2-хлоретанолтозилату. Реакційну суміш перемішують протягом 19 годин при температурі 70°C, після охолодження концентрують у вакуумі, у залишок додають 50мл води та 50мл дихлорметану. Органічну фазу відділяють, промивають водою та насиченим розчином хлориду натрію, висушують через сульфат натрію та фільтрують. Розчинник ретельно відганяють з фільтрату при пониженому тиску.

Одержують 12,1г (95% від теоретичного) етилового естеру 2,4-дихлор-3-(2-хлоретокси)бензойної кислоти у вигляді масла.

$\log P = 3,76$

Стадія 2

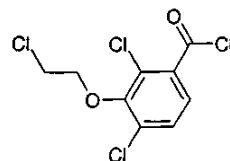


До розчину 10,0г (33,6ммоль) етилового естеру 2,4-дихлор-3-(2-хлоретокси)бензойної кислоти у 70мл етанолу додають розчин 2,2г (55,0ммоль) гідроксиду натрію у 40мл води. Реакційну суміш перемішують протягом 90 хвилин при кімнатній температурі (приблизно 20°C), а етанол повністю відділяють шляхом випаровування у вакуумі. У залишку за допомогою концентрованої соляної кислоти встановлюють рівень pH=1 та екстрагують етиловим естером оцтової кислоти. Органічну фазу відділяють, промивають насиченим водним розчином хлориду натрію, висушують через сульфат натрію та фільтрують. Розчинник ретельно відганяють з фільтрату при пониженому тиску.

Одержують 9,0г (99% від теоретичного) 2,4-дихлор-3-(2-хлоретокси)бензойної кислоти у вигляді білої твердої речовини.

$\log P = 2,31$

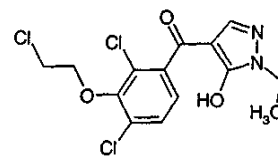
Стадія 3



Розчин 8,5г (31,5ммоль) 2,4-дихлор-3-(2-хлоретокси)бензойної кислоти у 12мл тіонілхлориду нагрівають протягом години до температури 60°C. Після закінчення виділення газу надлишкову кількість тіонілхлориду виводять при пониженому тиску.

Одержують 9,0г (99% від теоретичного) хлориду 2,4-дихлор-3-(2-хлоретокси)бензойної кислоти у вигляді маслянистого залишку.

Стадія 4



До розчину 3,5г (31,3ммоль) 1-етил-5-гідрокси-1Н-піразолу в 200мл дихлорметану додають один за одним 9,5г (94ммоль) триетиламіну, 9г (31,3ммоль) хлориду 2,4-дихлор-3-(2-хлоретокси)бензойної кислоти та 5 крапель N,N-диметилформаміду. Реакційну суміш перемішують протягом 21 години при кімнатній температурі (приблизно 20°C), потім двічі промивають розчином соляної кислоти та насиченим водним розчином хлориду натрію, висушують через сульфат натрію та фільтрують. Розчинник ретельно відганяють з фільтрату при пониженому тиску.

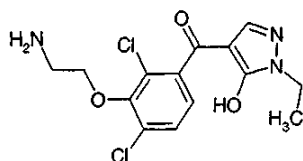
Масляний залишок розчиняють у 200мл ацетонітрилу, додають 17г (168ммоль) триетиламіну

та 3,26г (38ммоль) 2-гідрокси-2-метилпропіонітрилу та наступні 20 годин перемішують при кімнатній температурі. Потім розчинник повністю видаляють при пониженому тиску, а маслянистий залишок розчиняють у 100мл дихлорметану. Органічну фазу двічі промивають розчином соляної кислоти та насиченим водним розчином хлориду натрію, висушують через сульфат натрію та фільтрують. Розчинник ретельно видаляють з фільтрату при пониженому тиску.

Одержують 11,1г (98% від теоретичного) [2,4-дихлор-3-(2-хлоретокси)феніл]-(1-етил-5-гідрокси-1Н-піразол-4-іл)метанону у вигляді жовтогарячої кристалічної твердої речовини.

Log P = 2,73.

Стадія 5

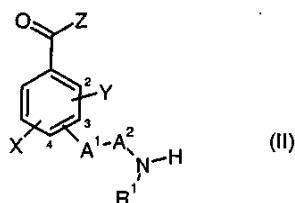


Розчин 8,0г (22ммоль) [2,4-дихлор-3-(2-хлоретокси)феніл]-(1-етил-5-гідрокси-1Н-піразол-4-іл)метанону в 150мл тетрагідрофурану та 200мл амонію нагрівають в автоклаві протягом 6,5 годин до температури 90°C. Залишкову кількість аміаку повністю випаровують, продукт, що випадає в осад, відділяють шляхом фільтрування та висушують при пониженому тиску.

Одержують 4,3г (57% від теоретичного) [3-(2-аміноетокси)-2,4-дихлорфеніл]-(1-етил-5-гідрокси-1Н-піразол-4-іл)метанону у вигляді світложовтої кристалічної твердої речовини.

Log P = 0,72.

Аналогічно до прикладу (II-1) можна одержувати, наприклад, також сполуки загальної формули (II), наведені нижче у таблиці 3.



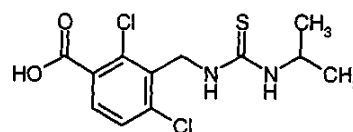
Таблиця 3: Приклади для сполук формули (II)

| Прик.<br>№ | (Позиція)<br>-A¹-A²-NHR¹ | (Позиція)<br>X | (Позиція)<br>Y | Z |
|------------|--------------------------|----------------|----------------|---|
| II-2       | (3)<br>                  | (2)<br>Cl      | (4)<br>Cl      |   |
| II-3       | (3)<br>                  | (2)<br>Cl      | (4)<br>SO₂CH₃  |   |
| II-4       | (3)<br>                  | (2)<br>Cl      | (4)<br>Cl      |   |

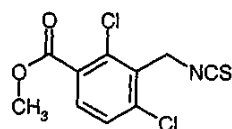
|      |         |           |               |  |
|------|---------|-----------|---------------|--|
| II-5 | (3)<br> | (2)<br>Cl | (4)<br>SO₂CH₃ |  |
| II-6 | (3)<br> | (2)<br>Cl | (4)<br>Cl     |  |
| II-7 | (3)<br> | (2)<br>Cl | (4)<br>SO₂CH₃ |  |
| II-8 | (3)<br> | (2)<br>Cl | (4)<br>Cl     |  |

Вихідні речовини Формули (IV):

Приклад (IV-1)



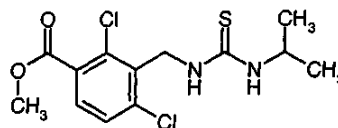
Стадія 1



У 60мл ацетонітрилу при кімнатній температурі (приблизно 20°C) додають 15г (59ммоль) метилового естеру 2,4-дихлор-3-бромметилбензойної кислоти, а потім 7,5г (77ммоль) тіоціанату калію. Після поступового нагрівання реакційну суміш у зворотному потоці перемішують протягом 20 годин при тій самій температурі. Після охолодження до кімнатної температури розчинник видаляють у вакуумі, а залишок перемішують з 70мл діетилового етеру. Залишок, що не розчинився, відсмоктують, а розчинник видаляють у вакуумі та дистилують при пониженому тиску.

Одержують 2,7г (17% від теоретичного) метилового естеру 2,4-дихлор-3-ізоціанатметилбензойної кислоти у вигляді масла та без подальшого очищення піддають взаємодії.

Стадія 2

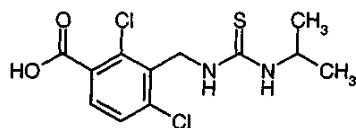


5,6г сирого метилового естеру 2,4-дихлор-3-ізоціанатметилбензойної кислоти розчиняють у 20мл етанолу та додають 1,2г (20ммоль) 2-пропанаміну. Суміш нагрівають протягом години до кипіння, кількість розчинник зменшують до на третину та відсмоктують.

Одержують 1,7г (9% від вмісту метилового естеру 2,4-дихлор-3-метилбензойної кислоти) метилового естеру 2,4-дихлор-3-[[[(ізопропіламіно)тіоксометил]аміно]метил]бензойної кислоти у вигляді твердої речовини (MS:



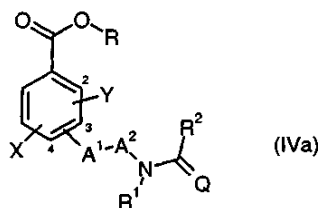
$M^+ = 355$ , 2 Cl за зразком ізоотопів).  
Стадія 3



5г (15ммоль) N-(3-метоксикарбоніл-2,6-дихлорбензил)-N'-ізопропілтіокарбаміду розчиняють у 30мл метанолу та додають 10мл (50ммоль) 30%-ного розчину метанолату натрію у метанолі. Через 30 хвилин по краплях додають 50мл води, після чого суміш протягом 2 годин тримають при температурі 60°C. Після двократної нейтралізації розчином соляної кислоти відсмоктують та висушують.

Одержують 4,4г (91% від теоретичного) 2,4-дихлор-3-[[[(ізопропіламіно)тіоксометил]аміно]метил]бензойної кислоти у вигляді твердої речовини з температурою плавлення  $>220^\circ\text{C}$ .

Аналогічно до прикладу (IV-1) можна, наприклад, одержувати також сполуки загальної формули (IVa) наведені нижче у таблиці 4.



Таблиця 4: Приклади для сполук формули (IVa)

| Прик. № | (Позиція) | (Позиція) | (Позиція) | R               | Фізичні показники         |
|---------|-----------|-----------|-----------|-----------------|---------------------------|
|         |           | X         | Y         |                 |                           |
| IV-2    | (3)<br>   | (2)<br>Cl | (4)<br>Cl | CH <sub>3</sub> | logP = 0,89 <sup>3)</sup> |
| IV-3    | (3)<br>   | (2)<br>Cl | (4)<br>Cl | CH <sub>3</sub> | Тпл.: 195°C               |
| IV-4    | (3)<br>   | (2)<br>Cl | (4)<br>Cl | CH <sub>3</sub> | Тпл.: 140°C               |
| IV-5    | (3)<br>   | (2)<br>Cl | (4)<br>Cl | H               | Тпл.: 175°C               |

|      |         |           |           |                 |            |
|------|---------|-----------|-----------|-----------------|------------|
| IV-6 | (3)<br> | (2)<br>Cl | (4)<br>Cl | CH <sub>3</sub> | Тпл.: 81°C |
|------|---------|-----------|-----------|-----------------|------------|

| Прик. № | (Позиція) | (Позиція)              | (Позиція) | R               | Фізичні показники            |
|---------|-----------|------------------------|-----------|-----------------|------------------------------|
|         |           | X                      | Y         |                 |                              |
| IV-7    | (4)<br>   | (2)<br>NO <sub>2</sub> | -         | CH <sub>3</sub> | $n_{\text{D}}^{20} = 1,5361$ |
| IV-8    | (3)<br>   | (2)<br>Cl              | (4)<br>Cl | H               | Тпл.: $>260^\circ\text{C}$   |
| IV-9    | (3)<br>   | (2)<br>Cl              | (4)<br>Cl | CH <sub>3</sub> | Тпл.: 76°C                   |
| IV-10   | (3)<br>   | (2)<br>NO <sub>2</sub> | -         | H               | Тпл.: $>220^\circ\text{C}$   |
| IV-11   | (4)<br>   | (2)<br>NO <sub>2</sub> | -         | H               | Тпл.: 210°C                  |
| IV-12   | (3)<br>   | (2)<br>Cl              | (4)<br>Cl | CH <sub>3</sub> | Тпл.: 147°C                  |

| Прик. № | (Позиція) | (Позиція) | (Позиція) | R | Фізичні показники |
|---------|-----------|-----------|-----------|---|-------------------|
|         |           | X         | Y         |   |                   |
| IV-13   | (3)<br>   | (2)<br>Cl | (4)<br>Cl | H | Тпл.: 173°C       |

#### Приклади застосування

##### Приклад А

Дослідження до появи рослин

Розчинник: 5 вагових частин ацетону

Емульгатор: 1 вагова частина полігліколевого етеру алкіларилу

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

Насіння досліджуваних рослин висівають у фунт за нормальних умов. Через 24 години ґрунт розбризкуванням обробляють активною речовиною, так що на одиницю поверхні наносять необхідну кількість активної речовини. Концентрацію активної речовини в аерозолі обирають таким чином, що 1000 літрів води на гектар містять необхідну кількість активної речовини.

Через 3 тижні визначають ступінь пошкодження рослин в % у порівнянні з необробленими контрольними зразками. А саме:

0 % = ніякого ефекту (як в контрольних зразках)

100% = повне знищення

У цьому дослідженні сполуки, одержані, наприклад, згідно з прикладами одержання (I-2-1), (I-2-3), (I-2-5) та (I-2-6) поряд з високою сумісністю з культурними рослинами, такими як кукурудза, соя та пшениця, проявляють також високу активність у боротьбі з бур'янами.

Приклад В

Дослідження після появи рослин

Розчинник: 5 вагових частин ацетону

Емульгатор: 1 вагова частина полігліколевого етеру алкіларилу

Для одержання необхідної композиції активних речовин 1 вагову частину активної речовини перемішують із вказаною кількістю розчинника, додають вказану кількість емульгатора та концентрат

розріджують водою до досягнення необхідної концентрації.

Активною речовиною обприскують досліджувані рослини, висотою 5-15см, так що на одиницю поверхні потрапляє необхідна кількість активної речовини. Концентрацію активної речовини в аерозолі обирають таким чином, що 1000 літрів води на гектар містять необхідну кількість активної речовини.

Через 3 тижні визначають ступінь пошкодження рослин в % у порівнянні з необробленими контрольними зразками. А саме:

0 % = ніякого ефекту (як в контрольних зразках)

100% = повне знищення

У цьому дослідженні сполуки, одержані, наприклад, згідно з прикладами одержання (I-2-1), (I-2-3), (I-2-4), (I-2-5), (I-2-6), (I-2-7) та (I-2-8) поряд з високою сумісністю з культурними рослинами, такими як кукурудза, рапс та пшениця, проявляють також високу активність у боротьбі з бур'янами.