



УКРАЇНА

(19) UA

(11) 104017

(13) C2

(51) МПК

C07D 237/16 (2006.01)

A01N 43/58 (2006.01)

ДЕРЖАВНА СЛУЖБА
ІНТЕЛЕКТУАЛЬНОЇ
ВЛАСНОСТІ
УКРАЇНИ

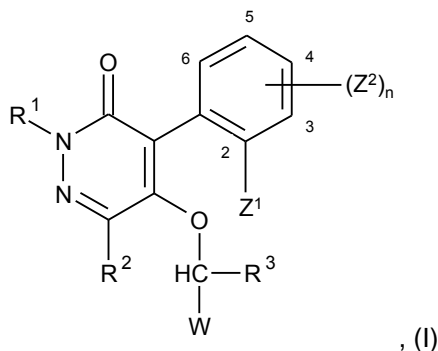
(12) ОПИС ДО ПАТЕНТУ НА ВІНАХІД

(21) Номер заявки:	а 2011 12017	(72) Винахідник(и):	Фусака Такафумі (JP)
(22) Дата подання заявки:	12.03.2010	(73) Власник(и):	СУМІТОМО КЕМІКАЛ КОМПАНІ, ЛІМІТЕД, 27-1, Shinkawa 2-chome, Chuo-ku, Tokyo 1048260, Japan (JP)
(24) Дата, з якої є чинними права на винахід:	25.12.2013	(74) Представник:	Мошинська Ніна Миколаївна, реєстр. №115
(31) Номер попередньої заявки відповідно до Паризької конвенції:	2009-060943	(56) Перелік документів, взятих до уваги експертизою:	WO 2007/119434; 25.10.2007
(32) Дата подання попередньої заявки відповідно до Паризької конвенції:	13.03.2009		
(33) Код держави-учасниці Паризької конвенції, до якої подано попередню заявку:	JP		
(41) Публікація відомостей про заявку:	10.01.2012, Бюл.№ 1		
(46) Публікація відомостей про видачу патенту:	25.12.2013, Бюл.№ 24		
(86) Номер та дата подання міжнародної заявки, поданої відповідно до Договору РСТ	PCT/JP2010/054725, 12.03.2010		

(54) СПОЛУКА ПІРИДАЗИНОНУ І ЇЇ ЗАСТОСУВАННЯ

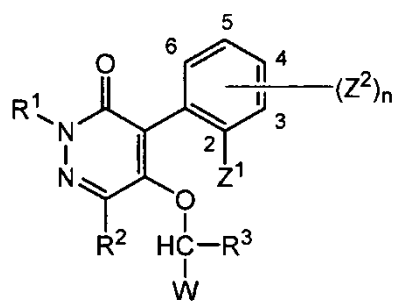
(57) Реферат:

Винахід стосується сполуки піридазину, представленої формулою (I):



в якій R^1 являє собою C_{1-6} алкілну групу або $(C_{1-6}$ алкілокси) C_{1-6} алкілну групу, R^2 і R^3 являють собою водень або C_{1-6} алкілну групу, W являє собою галоген і подібне, Z^1 являє собою C_{1-6} алкілну групу, Z^2 являє собою C_{1-6} алкілну групу, C_{3-8} циклоалкілну групу і подібне, і n являє собою 0, 1, 2, 3 або 4, а також її застосування для контролювання бур'янів та артроподів.

UA 104017 C2



(I)

Даний винахід стосується сполуки піридазину і її застосування.

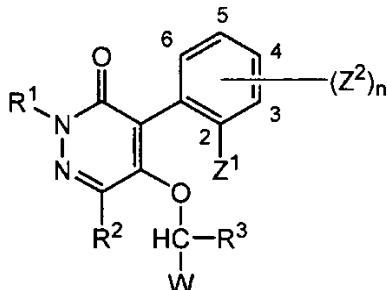
Рівень техніки

Сполука піридазину, що має гербіцидну активність, розкрита у WO 2007/119434.

Задача даного винаходу полягає в одержанні сполуки, що має чудовий контролюючий ефект стосовно бур'янів і артроподів.

Даний винахід забезпечує наступне.

1. Сполука піридазину, представлена формулою (I):

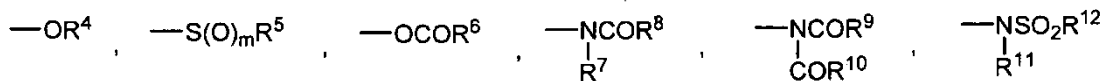


(I)

в якій R^1 являє собою C_{1-6} алкільну групу або $(C_{1-6}$ алкілокси) C_{1-6} алкільну групу,

R^2 і R^3 є однаковими або різними і являють собою водень або C_{1-6} алкільну групу,

W являє собою галоген або будь-яку одну з груп, представлених наведеними нижче формулами:



в яких R^4 , R^5 , R^7 і R^{11} кожний являє собою C_{1-6} алкільну групу, C_{3-8} циклоалкільну групу, C_{3-6} алкенільну групу, C_{3-6} алкінільну групу, C_{6-10} арильну групу або $(C_{6-10}$ арил) C_{1-6} алкільну групу,

R^{12} являє собою C_{1-6} алкільну групу, C_{3-8} циклоалкільну групу, C_{3-6} алкенільну групу, C_{3-6} алкінільну групу, C_{6-10} арильну групу або $(C_{6-10}$ арил) C_{1-6} алкільну групу,

R^6 , R^8 і R^9 кожний являє собою C_{1-6} алкільну групу, C_{3-8} циклоалкільну групу, C_{2-6} алкенільну групу, C_{2-6} алкінільну групу, C_{6-10} арильну групу, $(C_{6-10}$ арил) C_{1-6} алкільну групу, C_{1-6} алкілоксигрупу, C_{3-8} циклоалкілоксигрупу, C_{3-6} алкенілоксигрупу, C_{3-6} алкінілоксигрупу, C_{6-10} арилоксигрупу або $(C_{6-10}$ арил) C_{1-6} алкілоксигрупу,

R^{10} являє собою C_{1-6} алкільну групу, C_{3-8} циклоалкільну групу, C_{2-6} алкенільну групу, C_{2-6} алкінільну групу, C_{6-10} арильну групу, $(C_{6-10}$ арил) C_{1-6} алкільну групу, C_{1-6} алкілоксигрупу, C_{3-8} циклоалкілоксигрупу, C_{3-6} алкенілоксигрупу, C_{3-6} алкінілоксигрупу, C_{6-10} арилоксигрупу або $(C_{6-10}$ арил) C_{1-6} алкілоксигрупу,

або R^9 і R^{10} можуть являти собою разом з карбонільними групами, до яких вони приєднані, і атомом азоту, до якого приєднані карбонільні групи, 5- або 6-членну циклічну імідну групу, з якою може бути конденсоване бензольне кільце, в яких будь-яка група, представлена R^4 , R^5 , R^6 , R^7 , R^8 , R^9 , R^{10} , R^{11} або R^{12} , може бути заміщена щонайменше одним членом, вибраним з групи, що складається з галогену і C_{1-6} алкілоксигруп,

C_{3-8} циклоалкільні групи, C_{6-10} арильні групи і арильні частини $(C_{6-10}$ арил) C_{1-6} алкільних груп, які представлені R^4 , R^5 , R^6 , R^7 , R^8 , R^9 , R^{10} , R^{11} і R^{12} , можуть бути заміщені щонайменше однією C_{1-6} алкільною групою,

C_{3-8} циклоалкілоксигрупи, C_{6-10} арилоксигрупи і арильні частини $(C_{6-10}$ арил) C_{1-6} алкілоксигруп, які представлені R^6 , R^8 , R^9 або R^{10} , можуть бути заміщені щонайменше однією C_{1-6} алкільною групою і m являє собою 0, 1 або 2,

Z^1 являє собою C_{1-6} алкільну групу,

Z^2 являє собою C_{1-6} алкільну групу, C_{3-8} циклоалкільну групу, C_{2-6} алкінільну групу, C_{1-6} галогеноалкільну групу, C_{6-10} арильну групу, 5- або 6-членну гетероарильну групу, C_{1-6} алкілоксигрупу, C_{1-6} галогеноалкілоксигрупу, галоген, ціаногрупу або нітрогрупу,

в яких C_{3-8} циклоалкільна група, C_{6-10} арильна група і 5- або 6-членна гетероарильна група, представлена Z^2 , можуть бути заміщені щонайменше одним членом, вибраним з групи, що складається з галогену і C_{1-6} алкільних груп, і n являє собою 0, 1, 2, 3 або 4, і коли n являє собою 2, 3 або 4, кожний Z^2 являє собою те саме або відмінне.

2. Сполука піридазину за п. 1, в якій n являє собою 1, 2 або 3.

3. Сполука піридазину за п. 1, в якій n являє собою 0 і Z^1 являє собою C_{2-6} алкільну групу.

4. Сполука піридазину за п. 1 або 2, в якій n являє собою 1 або 2 і Z^2 приєднаний до 4-ї/або 6-положення бензольного кільця.

5. Сполука піридазину за пп. 1, 2 або 4, в якій Z^1 являє собою C_{1-3} алкільну групу, Z^2 являє собою C_{1-3} алкільну групу, C_{3-6} циклоалкільну групу, C_{2-3} алкінільну групу, C_{1-3} алкілоксигрупу, галоген, ціаногрупу, нітрогрупу або фенільну групу, яка може бути заміщена щонайменше одним членом, вибраним з групи, що складається з галогену і C_{1-3} алкільних груп.

6. Сполука піридазину за пп. 1, 2, 4 або 5, в якій Z^1 являє собою C_{1-3} алкільну групу і Z^2 являє собою C_{1-3} алкільну групу.

7. Сполука піридазину за будь-яким одним з пп. 1-6, в якій R^1 являє собою C_{1-3} алкільну групу або $(C_{1-3}$ алкілокси) C_{1-3} алкільну групу.

8. Сполука піридазину за будь-яким одним з пп. 1-6, в якій R^1 являє собою метильну групу.

9. Сполука піридазину за будь-яким одним з пп. 1-8, в якій R^2 являє собою водень або C_{1-3} алкільну групу.

10. Сполука піридазину за будь-яким одним з пп. 1-8, в якій R^2 являє собою водень або метильну групу.

11. Сполука піридазину за будь-яким одним з пп. 1-10, в якій R^3 являє собою водень.

12. Сполука піридазину за будь-яким одним з пп. 1-11, в якій W являє собою галоген, C_{1-3} алкілоксигрупу, $(C_{6-10}$ арил) C_{1-3} алкілоксигрупу, C_{1-3} алкілтіогрупу, C_{1-3} алкілсульфінільну групу, C_{1-3} алкілсульфонільну групу або $N-(C_{6-10}$ арил)- $N-(C_{1-3}$ алкілоксикарбоніл)аміногрупу.

13. Сполука піридазину за будь-яким одним з пп. 1-11, в якій W являє собою C_{1-3} алкілоксигрупу або C_{1-3} алкілтіогрупу.

14. Гербіцидна композиція, що містить сполуку піридазину за будь-яким одним з пп. 1-13, та інертний носій.

15. Спосіб контролювання бур'янів, який включає застосування ефективної кількості сполуки піридазину за будь-яким одним з пп. 1-13 до бур'янів або ґрунту, в якому бур'яни ростуть.

16. Застосування сполуки піридазину за будь-яким одним з пп. 1-13 для контролювання бур'янів.

17. Спосіб контролювання артроподів, який включає застосування ефективної кількості сполуки піридазину за будь-яким одним з пп. 1-13 до артроподів або середовищ проживання артроподів.

18. Застосування сполуки піридазину за будь-яким одним з пп. 1-13 для контролювання артроподів.

Втілення винаходу

Використовувана у даному описі C_{1-6} алкільна група означає алкільну групу, що містить 1-6 атомів вуглецю. Приклади C_{1-6} алкільної групи включають метильну групу, етильну групу, пропільну групу, ізопропільну групу, бутильну групу, ізобутильну групу, втор-бутильну групу, трет-бутильну групу, пентильну групу, втор-пентильну групу, ізопентильну групу, неопентильну групу, гексильну групу та ізогексильну групу.

Використовувана у даному описі C_{3-8} циклоалкільна група означає циклоалкільну групу, що містить 3-8 атомів вуглецю. Приклади C_{3-8} циклоалкільної групи включають циклопропільну групу, циклопентильну групу і циклогексильну групу.

Використовувана у даному описі C_{2-6} алкенільна група означає алкенільну групу, що містить 2-6 атомів вуглецю. Приклади C_{2-6} алкенільної групи включають вінільну групу, алільну групу, 1-бутен-3-ільну групу і 3-бутен-1-ільну групу.

Використовувана у даному описі C_{3-6} алкенільна група означає алкенільну групу, що містить 3-6 атомів вуглецю. Приклади C_{3-6} алкенільної групи включають алільну групу, 1-бутен-3-ільну групу і 3-бутен-1-ільну групу.

Використовувана у даному описі C_{2-6} алкінільна група означає алкінільну групу, що містить 2-6 атомів вуглецю. Приклади C_{2-6} алкінільної групи включають етинільну групу, пропаргільну групу і 2-бутинільну групу.

Використовувана у даному описі C_{3-6} алкінільна група означає алкінільну групу, що містить 3-6 атомів вуглецю. Приклади C_{3-6} алкінільної групи включають пропаргільну групу і 2-бутинільну групу.

Використовувана у даному описі C_{6-10} арильна група означає арильну групу, що містить 6-10 атомів вуглецю. Приклади C_{6-10} арильної групи включають фенільну групу і нафтильну групу.

Використовувана у даному описі $(C_{6-10}$ арил) C_{1-6} алкільна група означає C_{1-6} алкільну групу, заміщену C_{6-10} арильною групою. Приклади $(C_{6-10}$ арил) C_{1-6} алкільної групи включають бензильну групу і фенетильну групу.

Використовувана у даному описі C_{1-6} алкілоксигрупа означає алкілоксигрупу, що містить 1-6 атомів вуглецю. Приклади C_{1-6} алкілоксигрупи включають метоксигрупу, етоксигрупу, пропоксигрупу та ізопропоксигрупу.

5 Використовувана у даному описі C_{3-8} циклоалкілоксигрупа означає циклоалкілоксигрупу, що містить 3-8 атомів вуглецю. Приклади C_{3-8} циклоалкілоксигрупи включають циклопропілоксигрупу і циклопентилокси-групу.

Використовувана у даному описі C_{3-6} алкенілоксигрупа означає алкенілоксигрупу, що містить 3-6 атомів вуглецю. Приклади C_{3-6} алкенілоксигрупи включають алілоксигрупу.

10 Використовувана у даному описі C_{3-6} алкінілоксигрупа означає алкінілоксигрупу, що містить 3-6 атомів вуглецю. Приклади C_{3-6} алкінілоксигрупи включають пропаргілоксигрупу і 2-бутинілоксигрупу.

Використовувана у даному описі C_{6-10} арилоксигрупа означає арилоксигрупу, що містить 6-10 атомів вуглецю. Приклади C_{6-10} арилоксигрупи включають феноксигрупу і нафтилоксигрупу.

15 Використовувана у даному описі (C_{6-10} арил) C_{1-6} алкілоксигрупа означає C_{1-6} алкілоксигрупу, заміщену C_{6-10} арильною групою. Приклади (C_{6-10} арил) C_{1-6} алкілоксигрупи включають бензилоксигрупу і фенетилоксигрупу.

Використовувана у даному описі (C_{1-6} алкілокси) C_{1-6} алкільна група означає C_{1-6} алкільну групу, заміщену C_{1-6} алкілоксигрупою. Приклади (C_{1-6} алкілокси) C_{1-6} алкільної групи включають метоксіетильну групу і етоксіетильну групу.

20 Приклади галогену включають фтор, хлор, бром і йод.

Приклади C_{1-3} алкілоксигрупи включають метоксигрупу, етоксигрупу, пропоксигрупу та ізопропоксигрупу.

Приклади (C_{6-10} арил) C_{1-3} алкілоксигрупи включають бензилоксигрупу і фенетилоксигрупу.

25 Приклади C_{1-3} алкілтіогрупи включають метилтіогрупу, етилтіогрупу, пропілтіогрупу та ізопропілтіогрупу.

Приклади C_{1-3} алкілсульфінільної групи включають метилсульфінільну групу, етилсульфінільну групу, пропілсульфінільну групу та ізопропілсульфінільну групу.

Приклади C_{1-3} алкілсульфонільної групи включають метилсульфонільну групу, етилсульфонільну групу, пропілсульфонільну групу та ізопропіл-сульфонільну групу.

30 Приклади N-(C_{6-10} арил)-N-(C_{1-3} алкілоксикарбоніл)аміногрупи включають N-етоксикарбоніл-N-феніламіногрупу і N-метоксикарбоніл-N-феніламіногрупу.

35 Приклади 5- або 6-членної циклічної імідної групи, з якою може бути сконденсоване бензольне кільце, яка представлена R^9 і R^{10} разом з карбонільними групами, до яких вони приєднані, і азотом, до якого приєднані карбонільні групи, включають сукцинімідну групу, глутарімідну групу, малеімідну групу і фталімідну групу.

Приклади 5- або 6-членної гетероарильної групи, представленої Z^2 , включають 3-піридинильну групу, 3-тієнільну групу і 1-піразолільну групу.

40 C_{1-6} галогеноалкільна група, представлена Z^2 , означає C_{1-6} алкільну групу, заміщену галогеном. Приклади C_{1-6} галогеноалкільної групи включають трифторметильну групу і 2,2,2-трихлоретильну групу.

C_{1-6} галогеноалкілоксигрупа, представлена Z^2 , означає C_{1-6} алкілоксигрупу, заміщену галогеном. Приклади C_{1-6} галогеноалкілоксигрупи включають трифторметоксигрупу і 2,2,2-трифторетоксигрупу.

45 Групи, представлені R^4 , R^5 , R^6 , R^7 , R^8 , R^9 , R^{10} , R^{11} або R^{12} , можуть бути заміщені щонайменше одним членом, вибраним з групи, що складається з галогену і C_{1-6} алкілоксигруп.

C_{3-8} циклоалкільні групи, C_{6-10} арильні групи і арильні частини (C_{6-10} арил) C_{1-6} алкільних груп, які представлені R^4 , R^5 , R^6 , R^7 , R^8 , R^9 , R^{10} , R^{11} або R^{12} , можуть бути заміщені щонайменше однією C_{1-6} алкільною групою.

50 C_{3-8} циклоалкілоксигрупи, C_{6-10} арилоксигрупи і арильні частини (C_{6-10} арил) C_{1-6} алкілоксигруп, які представлені R^6 , R^8 , R^9 або R^{10} , можуть бути заміщені щонайменше однією C_{1-6} алкільною групою.

C_{3-8} циклоалкільна група, C_{6-10} арильна група і 5- або 6-членна гетероарильна група, представлена Z^2 , можуть бути заміщені щонайменше одним членом, вибраним з групи, що складається з галогену і C_{1-6} алкільних груп.

55 Приклади сполуки даного винаходу включають наведені нижче сполуки.

Сполука піридазинону формули (I), в якій n являє собою 1, 2 або 3.

Сполука піридазинону формули (I), в якій n являє собою 0 і Z^1 являє собою C_{2-6} алкільну групу.

Сполука піридазинону формули (I), в якій n являє собою 1 або 2, і коли n являє собою 2, кожний Z^2 може бути однаковим або різним і Z^2 приєднаний до 4- і/або 6-положення бензольного кільця.

Сполука піридазинону формули (I), в якій R^3 являє собою водень.

5 Сполука піридазинону формули (I), в якій W являє собою галоген, C_{1-3} алкілоксигрупу, $(C_{6-10}$ арил) C_{1-3} алкілоксигрупу, C_{1-3} алкілтіогрупу, C_{1-3} алкілсульфінільну групу, C_{1-3} алкілсульфонільну групу або $N-(C_{6-10}$ арил)- $N-(C_{1-3}$ алкілоксикарбоніл)аміногрупу.

Сполука піридазинону формули (I), в якій W являє собою C_{1-3} алкілоксигрупу або C_{1-3} алкілтіогрупу.

10 Сполука піридазинону формули (I), в якій R^1 являє собою C_{1-3} алкільну групу або $(C_{1-3}$ алкілокси) C_{1-3} алкільну групу.

Сполука піридазинону формули (I), в якій R^1 являє собою метильну групу.

Сполука піридазинону формули (I), в якій R^2 являє собою водень або C_{1-3} алкільну групу.

Сполука піридазинону формули (I), в якій R^2 являє собою водень або метильну групу.

15 Сполука піридазинону формули (I), в якій Z^1 являє собою C_{1-3} алкільну групу і Z^2 являє собою C_{1-3} алкільну групу.

Сполука піридазинону формули (I), в якій Z^1 являє собою C_{1-3} алкільну групу і Z^2 являє собою C_{1-3} алкільну групу, C_{3-6} циклоалкільну групу, C_{2-3} алкінільну групу, C_{1-3} алкілоксигрупу, C_{1-3} галогеноалкільну групу, C_{1-3} галогеноалкілоксигрупу, галоген, ціаногрупу, нітрогрупу або фенільну групу, яка може бути заміщена щонайменше одним членом, вибраним з групи, що складається з галогену і C_{1-3} алкільних груп.

20 Сполука піридазинону формули (I), в якій R^1 являє собою C_{1-3} алкільну групу або $(C_{1-3}$ алкілокси) C_{1-3} алкільну групу і R^2 являє собою водень або C_{1-3} алкільну групу.

Сполука піридазинону формули (I), в якій R^1 являє собою C_{1-3} алкільну групу або $(C_{1-3}$ алкілокси) C_{1-3} алкільну групу і R^2 являє собою водень або метильну групу.

25 Сполука піридазинону формули (I), в якій R^2 являє собою водень або C_{1-3} алкільну групу, R^3 являє собою водень і W являє собою C_{1-3} алкілоксигрупу або C_{1-3} алкілтіогрупу.

Сполука піридазинону формули (I), в якій R^2 являє собою водень або метильну групу, R^3 являє собою водень і W являє собою C_{1-3} алкілоксигрупу або C_{1-3} алкілтіогрупу.

30 Сполука піридазинону формули (I), в якій R^1 являє собою C_{1-3} алкільну групу або $(C_{1-3}$ алкілокси) C_{1-3} алкільну групу, R^2 являє собою водень або C_{1-3} алкільну групу, R^3 являє собою водень і W являє собою C_{1-3} алкілоксигрупу або C_{1-3} алкілтіогрупу.

Сполука піридазинону формули (I), в якій R^1 являє собою C_{1-3} алкільну групу або $(C_{1-3}$ алкілокси) C_{1-3} алкільну групу, R^2 являє собою водень або метильну групу, R^3 являє собою водень і W являє собою C_{1-3} алкілоксигрупу або C_{1-3} алкілтіогрупу.

35 Сполука піридазинону формули (I), в якій R^1 являє собою C_{1-3} алкільну групу або $(C_{1-3}$ алкілокси) C_{1-3} алкільну групу, R^2 являє собою водень або C_{1-3} алкільну групу,

n являє собою 1 або 2, і коли n являє собою 2, кожний Z^2 може бути однаковим або різним і Z^2 приєднаний до 4- і/або 6-положення бензольного кільця,

40 Z^1 являє собою C_{1-6} алкільну групу (наприклад, C_{1-3} алкільну групу) і

Z^2 являє собою C_{1-6} алкільну групу (наприклад, C_{1-3} алкільну групу).

Сполука піридазинону формули (I), в якій R^1 являє собою C_{1-3} алкільну групу або $(C_{1-3}$ алкілокси) C_{1-3} алкільну групу, R^2 являє собою водень або C_{1-3} алкільну групу,

n являє собою 1 або 2, і коли n являє собою 2, кожний Z^2 може бути однаковим або різним і Z^2 приєднаний до 4- і/або 6-положення бензольного кільця,

45 Z^1 являє собою C_{1-6} алкільну групу (наприклад, C_{1-3} алкільну групу) і

Z^2 являє собою C_{1-6} алкільну групу (наприклад, C_{1-3} алкільну групу), C_{3-6} циклоалкільну групу (наприклад, C_{3-6} циклоалкільну групу), C_{2-6} алкінільну групу (наприклад, C_{2-3} алкінільну групу), C_{1-6} алкілоксигрупу (наприклад, C_{1-3} алкілоксигрупу), C_{1-6} галогеноалкільну групу (наприклад, C_{1-3} галогеноалкільну групу), C_{1-6} галогеноалкілоксигрупу (наприклад, C_{1-3} галогеноалкілоксигрупу), галоген, ціаногрупу, нітрогрупу або C_{6-10} арильну групу (наприклад, фенільну групу), яка може бути заміщена щонайменше одним членом, вибраним з групи, що складається з галогену і C_{1-6} алкільних груп (наприклад, C_{1-3} алкільної групи).

55 Сполука піридазинону формули (I), в якій R^1 являє собою C_{1-3} алкільну групу або $(C_{1-3}$ алкілокси) C_{1-3} алкільну групу, R^2 являє собою водень або C_{1-3} алкільну групу, R^3 являє собою водень, W являє собою C_{1-3} алкілоксигрупу або C_{1-3} алкілтіогрупу,

n являє собою 1 або 2, і коли n являє собою 2, кожний Z^2 може бути однаковим або різним і Z^2 приєднаний до 4- і/або 6-положення бензольного кільця,

Z^1 являє собою C_{1-6} алкільну групу (наприклад, C_{1-3} алкільну групу) і

60 Z^2 являє собою C_{1-6} алкільну групу (наприклад, C_{1-3} алкільну групу).

Сполука піридазинону формули (I), в якій R¹ являє собою C₁₋₃алкільну групу або (C₁₋₃алкілокси)C₁₋₃алкільну групу, R² являє собою водень або C₁₋₃алкільну групу, R³ являє собою водень, W являє собою C₁₋₃алкілоксигрупу або C₁₋₃алкілтіогрупу,

5 Z^2 приєднаний до 4- і/або 6-положення бензольного кільця,

Z^1 являє собою C_{1-6} алкільну групу (наприклад, C_{1-3} алкільну групу) і

Z^2 являє собою C_{1-6} алкільну групу (наприклад, C_{1-3} алкільну групу), C_{3-8} циклоалкільну групу (наприклад, C_{3-6} циклоалкільну групу), C_{2-6} алкінільну групу (наприклад, C_{2-3} алкінільну групу), C_{1-6} алкілоксигрупу (наприклад, C_{1-3} алкілоксигрупу), C_{1-6} галогеноалкільну групу (наприклад, C_{1-3} галогеноалкільну групу), C_{1-6} галогеноалкілоксигрупу (наприклад, C_{1-3} галогеноалкілоксигрупу), галоген, ціаногрупу, нітрогрупу або C_{6-10} арильну групу (наприклад, фенільну групу), яка може бути заміщена щонайменше одним членом, вибраним з групи, що складається з галогену і C_{1-6} алкільних груп (наприклад, C_{1-3} алкільної групи).

15 Сполука піридазину формули (I), в якій R¹ являє собою C₁₋₃алкільную групу або (C₁₋₃алкілокси)C₁₋₃алкільную групу, R² являє собою водень або метильну групу,

п являє собою 1 або 2, і коли п являє собою 2, кожний Z^2 може бути однаковим або різним і Z^2 приєднаний до 4- і/або 6-положення бензольного кільця,

Z^1 являє собою C_{1-6} -алкільну групу (наприклад, C_{1-3} -алкільну групу) і

Z^2 являє собою C_{1-6} алкільну групу (наприклад, C_{1-3} алкільну групу).

20 Сполука піридазину формули (I), в якій R¹ являє собою C₁₋₃-залкілну групу або (C₁₋₃-залкілокси)C₁₋₃-залкілну групу, R² являє собою водень або метильну групу,

п являє собою 1 або 2, і коли п являє собою 2, кожний Z^2 може бути однаковим або різним, і Z^2 приєднаний до 4- і/або 6-положення бензольного кільця,

Z¹ являє собою C₁₋₆алкільну групу (наприклад, C₁₋₃алкільну групу) і

25 Z^2 являє собою C_{1-6} алкільну групу (наприклад, C_{1-3} алкільну групу), C_{3-8} циклоалкільну групу
(наприклад, C_{3-6} циклоалкільну групу), C_{2-6} алкінільну групу (наприклад, C_{2-3} алкінільну групу), C_{1-6}
алкілоксигрупу (наприклад, C_{1-3} алкілоксигрупу), C_{1-6} галогеноалкільну групу (наприклад, C_{1-3}
галогеноалкільну групу), C_{1-6} галогеноалкілоксигрупу (наприклад, C_{1-3} галогеноалкілоксигрупу),
галоген, ціаногрупу, нітрогрупу або C_{6-10} арильну групу (наприклад, фенільну групу), яка може
30 бути заміщена щонайменше одним членом, вибраним з групи, що складається з галогену і C_{1-6}
алкільних груп (наприклад, C_{1-3} алкільної групи).

Сполука піридазину формули (I), в якій R¹ являє собою C₁₋₃алкілну групу або (C₁-алкілокси)C₁₋₃алкілну групу, R² являє собою водень або метильну групу, R³ являє собою водень, W являє собою C₁₋₃алкілоксигрупу або C₁₋₃алкілтіогрупу,

35 п являє собою 1 або 2, і коли п являє собою 2, кожний Z^2 може бути однаковим або різним, і Z^2 приєднаний до 4- і/або 6-положення бензольного кільця.

Z_1^1 являє собою C_{1-6} алкільну групу (наприклад, C_{1-3} алкільну групу) і

Z^2 являє собою C_{1-6} алкільну групу (наприклад, C_{1-3} алкільну групу).

40 Сполука піридазину формули (I), в якій R¹ являє собою C₁₋₃алкілну групу або (C₁₋₃алкілокси)C₁₋₃алкілну групу, R² являє собою водень або метильну групу, R³ являє собою водень, W являє собою C₁₋₃алкілоксигрупу або C₁₋₃алкілтіогрупу,

п являє собою 1 або 2, і коли п являє собою 2, кожний Z^2 може бути однаковим або різним, і Z^2 приєднаний до 4- і/або 6-положення бензольного кільця,

Z^1 являє собою C_{1-6} алкільну групу (наприклад, C_{1-3} алкільну групу) і

45 Z^2 являє собою C_{1-6} алкільну групу (наприклад, C_{1-3} алкільну групу), C_{3-8} циклоалкільну групу
(наприклад, C_{3-6} циклоалкільну групу), C_{2-6} алкілінову групу (наприклад, C_{2-3} алкілінову групу), C_{1-6}
алкілоксигрупу (наприклад, C_{1-3} алкілоксигрупу), C_{1-6} галогеноалкільну групу (наприклад, C_{1-3}
галогеноалкільну групу), C_{1-6} галогеноалкілоксигрупу (наприклад, C_{1-3} галогеноалкілоксигрупу),
галоген, ціаногрупу, нітрогрупу або C_{6-10} арильну групу (наприклад, фенільну групу), яка може
50 бути заміщена щонайменше одним членом, вибраним з групи, що складається з галогену і C_{1-6}
алкільних груп (наприклад, C_{1-3} алкільної групи).

Сполука піридазину формули (I), в якій п являє собою 1 і Z^2 приєднаний до 5-положення бензольного кільця.

Сполука піридазину формули (I), в якій R¹ являє собою C₁-залкільну групу або (C₁-залкілокси)C₁-залкільну групу, R² являє собою водень або C₁-залкільну групу.

Z^1 являє собою G_1 -закріплену групу (наприклад G_1 -закріплену групу) і

Z^2 являє собою C_{6-10} арильну групу (наприклад, фенільну групу), яка може бути заміщена щонайменше одним членом, вибраним з групи, що складається з галогену і C_{1-6} алкільних груп (наприклад, C_{1-3} алкільної групи).

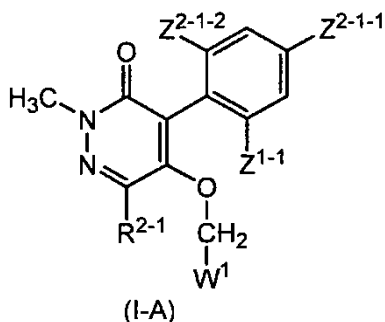
Сполука піридазину формули (I), в якій R^1 являє собою C_{1-3} алкільну групу або (C_{1-3} алкілокси) C_{1-3} алкільну групу, R^2 являє собою водень або C_{1-3} алкільну групу, R^3 являє собою водень, W являє собою C_{1-3} алкілоксигрупу або C_{1-3} алкілтіогрупу,

п являє собою 1, Z^2 приєднаний до 5-положення бензольного кільця,
 5 Z^1 являє собою C_{1-6} алкільну групу (наприклад, C_{1-3} алкільну групу) і
 Z^2 являє собою C_{6-10} арильну групу (наприклад, фенільну групу), яка може бути заміщена щонайменше одним членом, вибраним з групи, що складається з галогенів і C_{1-6} алкільних груп (наприклад, C_{1-3} алкільної групи).

Сполука піридазину формули (I), в якій R^1 являє собою C_{1-3} алкільну групу або (C_{1-3} алкілокси) C_{1-3} алкільну групу, R^2 являє собою водень або метильну групу,
 10 п являє собою 1, Z^2 приєднаний до 5-положення бензольного кільця,
 Z^1 являє собою C_{1-6} алкільну групу (наприклад, C_{1-3} алкільну групу) і
 Z^2 являє собою C_{6-10} арильну групу (наприклад, фенільну групу), яка може бути заміщена щонайменше одним членом, вибраним з групи, що складається з галогену і C_{1-6} алкільних груп
 15 (наприклад, C_{1-3} алкільної групи).

Сполука піридазину формули (I), в якій R^1 являє собою C_{1-3} алкільну групу або (C_{1-3} алкілокси) C_{1-3} алкільну групу, R^2 являє собою водень або метильну групу, R^3 являє собою водень, W являє собою C_{1-3} алкілоксигрупу або C_{1-3} алкілтіогрупу,
 20 п являє собою 1, Z^2 приєднаний до 5-положення бензольного кільця,
 Z^1 являє собою C_{1-6} алкільну групу (наприклад, C_{1-3} алкільну групу) і
 Z^2 являє собою C_{6-10} арильну групу (наприклад, фенільну групу), яка може бути заміщена щонайменше одним членом, вибраним з групи, що складається з галогену і C_{1-6} алкільних груп (наприклад, C_{1-3} алкільної групи).

Сполука піридазину формули (I-A):



25 в якій:
 R^{2-1} являє собою водень або C_{1-3} алкільну групу,
 W^1 являє собою галоген, C_{1-3} алкілоксигрупу, (C_{6-10} арил) C_{1-3} алкілоксигрупу, C_{1-3} алкілтіогрупу,
 30 C_{1-3} алкілсульфінільну групу, C_{1-3} алкілсульфонільну групу або N-(C_{6-10} арил)-N-(C_{1-3} алкілоксикарбоніл)аміногрупу,
 Z^{1-1} являє собою C_{1-3} алкільну групу,
 Z^{2-1-1} являє собою C_{1-3} алкільну групу і
 Z^{2-1-2} являє собою водень або C_{1-3} алкільну групу.

Сполука піридазину формули (I-A), в якій R^{2-1} являє собою водень, метильну групу або етильну групу, W^1 являє собою хлор, метоксигрупу, етоксигрупу, бензилоксигрупу, метилтіогрупу, метилсульфінільну групу, метилсульфонільну групу або N-феніл-N-етоксикарбоніламіногрупу,

35 Z^{1-1} являє собою метильну групу або етильну групу,
 Z^{2-1-1} являє собою метильну групу або етильну групу і
 40 Z^{2-1-2} являє собою водень, метильну групу або етильну групу.

Сполука піридазину формули (I-A), в якій R^{2-1} являє собою водень або C_{1-3} алкільну групу, W^1 являє собою галоген, C_{1-3} алкілоксигрупу, (C_{6-10} арил) C_{1-3} алкілоксигрупу, C_{1-3} алкілтіогрупу, C_{1-3} алкілсульфінільну групу, C_{1-3} алкілсульфонільну групу або N-(C_{6-10} арил)-N-(C_{1-3} алкілоксикарбоніл)аміногрупу,

45 Z^{1-1} являє собою C_{1-3} алкільну групу,
 Z^{2-1-1} являє собою C_{3-6} циклоалкільну групу, C_{2-3} алкінільну групу, C_{1-3} алкілоксигрупу, C_{1-3} галогеноалкільну групу, C_{1-3} галогеноалкілоксигрупу, галоген, ціаногрупу, нітрогрупу або фенільну групу, яка може бути заміщена щонайменше одним членом, вибраним з групи, що складається з галогену і C_{1-3} алкільних груп, і

Z^{2-1-2} являє собою водень, C_{1-3} алкільну групу, C_{3-6} циклоалкільну групу, C_{2-3} алкінільну групу, C_{1-3} алкілоксигрупу або галоген.

Сполука піридазину формули (I-A), в якій R^{2-1} являє собою водень, метильну групу або етильну групу, W^1 являє собою хлор, метоксигрупу, етоксигрупу, бензилоксигрупу, метилтіогрупу, метилсульфінільну групу, метилсульфонільну групу або N-феніл-N-етоксикарбоніламіногрупу,

Z^{1-1} являє собою метильну групу або етильну групу,

Z^{2-1-1} являє собою циклопропілну групу, етинільну групу, метоксигрупу, трифторметильну групу, трифторметоксигрупу, хлор, бром, фенільну групу, 4-метилфенільну групу, ціаногрупу або нітрогрупу і

Z^{2-1-2} являє собою водень, метильну групу, етильну групу, циклопропілну групу, етинільну групу, метоксигрупу, хлор або бром.

Сполука піридазину формули (I-A), в якій R^{2-1} являє собою водень або C_{1-3} алкільну групу, W^1 являє собою галоген, C_{1-3} алкілоксигрупу, $(C_{6-10}$ арил) C_{1-3} алкілоксигрупу, C_{1-3} алкілтіогрупу, C_{1-3} алкілсульфінільну групу, C_{1-3} алкілсульфонільну групу або N-(C_{6-10} арил)-N-(C_{1-3} алкілоксикарбоніл)аміногрупу,

Z^{1-1} являє собою C_{1-3} алкільну групу,

Z^{2-1-1} являє собою водень, C_{1-3} алкільну групу, C_{3-6} циклоалкільну групу, C_{2-3} алкінільну групу, C_{1-3} алкілоксигрупу або галоген і

Z^{2-1-2} являє собою C_{3-6} циклоалкільну групу, C_{2-3} алкінільну групу, C_{1-3} алкілоксигрупу, галоген, ціаногрупу або нітрогрупу.

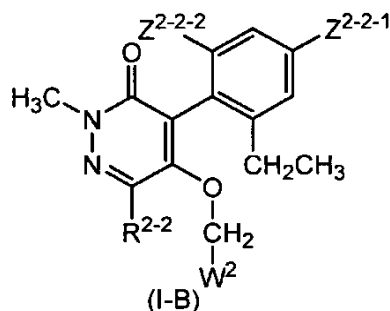
Сполука піридазину формули (I-A), в якій R^{2-1} являє собою водень, метильну групу або етильну групу, W^1 являє собою хлор, метоксигрупу, етоксигрупу, бензилоксигрупу, метилтіогрупу, метилсульфінільну групу, метилсульфонільну групу або N-феніл-N-етоксикарбоніламіногрупу,

Z^{1-1} являє собою метильну групу або етильну групу,

Z^{2-1-1} являє собою водень, метильну групу, етильну групу, циклопропілну групу, етинільну групу, метоксигрупу, хлор або бром і

Z^{2-1-2} являє собою циклопропілну групу, етинільну групу, метоксигрупу, хлор, бром, ціаногрупу або нітрогрупу.

Сполука піридазину формули (I-B):



в якій:

R^{2-2} являє собою водень або C_{1-3} алкільну групу,

W^2 являє собою галоген, C_{1-3} алкілоксигрупу, $(C_{6-10}$ арил) C_{1-3} алкілоксигрупу, C_{1-3} алкілтіогрупу, C_{1-3} алкілсульфінільну групу, C_{1-3} алкілсульфонільну групу або N-(C_{6-10} арил)-N-(C_{1-3} алкілоксикарбоніл)аміногрупу,

Z^{2-2-1} являє собою водень або C_{1-3} алкільну групу і

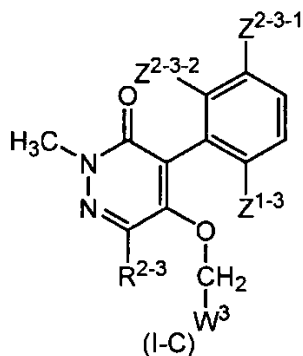
Z^{2-2-2} являє собою водень або C_{1-3} алкільну групу.

Сполука піридазину формули (I-B), в якій R^{2-2} являє собою водень, метильну групу або етильну групу, W^2 являє собою хлор, метоксигрупу, етоксигрупу, бензилоксигрупу, метилтіогрупу, метилсульфінільну групу, метилсульфонільну групу або N-феніл-N-етоксикарбоніламіногрупу,

Z^{2-2-1} являє собою водень, метильну групу або етильну групу і

Z^{2-2-2} являє собою водень, метильну групу або етильну групу.

Сполука піридазину формули (I-C):



в якій:

R^{2-3} являє собою водень або C_{1-3} алкільну групу,

5 W^3 являє собою галоген, C_{1-3} алкілоксигрупу, $(C_{6-10}$ арил) C_{1-3} алкілоксигрупу, C_{1-3} алкілтіогрупу, C_{1-3} алкілсульфінільну групу, C_{1-3} алкілсульфонільну групу або $N-(C_{6-10}$ арил)- $N-(C_{1-3}$ алкілоксикарбоніл)аміногрупу,

Z^{1-3} являє собою C_{1-3} алкільну групу,

Z^{2-3-1} являє собою фенільну групу, яка може бути заміщена щонайменше одним членом, вибраним з групи, що складається з галогену і C_{1-3} алкільних груп, і

10 Z^{2-3-2} являє собою водень, C_{1-3} алкільну групу або галоген.

Сполука піридазину формули (I-C), в якій R^{2-3} являє собою водень, метильну групу або етильну групу, W^3 являє собою хлор, метоксигрупу, етоксигрупу, бензилоксигрупу, метилтіогрупу, метилсульфінільну групу, метилсульфонільну групу або N -феніл- N -етоксикарбоніламіногрупу,

15 Z^{1-3} являє собою метильну групу або етильну групу,

Z^{2-3-1} являє собою фенільну групу, 4-фторфенільну групу або 4-хлорфенільну групу і

Z^{2-3-2} являє собою водень, метильну групу або хлор.

Гербіцидна композиція даного винаходу і композиція, що контролює артроподів, містить сполуку даного винаходу та інертний носій. Інертний носій включає твердий носій, рідкий носій і газований носій. Гербіцидна композиція даного винаходу і композиція, що контролює артроподів, звичайно додатково містить допоміжний агент для складу, такий як поверхнево-активна речовина, зв'язувальна речовина, диспергуюча речовина або стабілізуюча речовина, і одержана у формі змочуваного порошку, гранули, що диспергується у воді, концентрату суспензії, гранули, сухого рідкотекучого складу, концентрату емульсії, рідкого складу, 25 маслянистого розчину, димоутворювальної речовини, аерозолі або мікрокапсули. Гербіцидна композиція даного винаходу і композиція, що контролює артроподів, звичайно містить від 0,1 до 80 ваг. % сполуки даного винаходу.

Приклади твердого носія включають дрібнодисперсний порошок і гранули з глини [наприклад, каолінова глина, діатомова земля, синтетичний гідратований діоксид кремнію, 30 агальматоліт (глина Фубасамі), бентоніт або кисла глина], тальки та інші неорганічні мінерали (наприклад, серицит, кварц, порошок сірки, активоване вугілля, карбонат кальцію або гідратований діоксид кремнію).

Приклади рідкого носія включають воду, спирти (наприклад, метанол, етанол), кетон (наприклад, ацетон, метилетилкетон), ароматичні вуглеводні (наприклад, бензол, толуол, 35 ксилол, етилбензол, метилнафталін), аліфатичні вуглеводні (наприклад, n -гексан, циклогексан, гас), складні ефіри (наприклад, етилацетат, бутилацетат), нітрили (наприклад, ацетонітрил, ізобутиронітрил і подібні), прості ефіри (наприклад, діоксан, діізопропіловий ефір), аміді кислот (наприклад, N , N -диметилформамід, диметилацетамід) і галогеновані вуглеводні (наприклад, дихлоретан, трихлоретилен, тетрахлорид вуглецю).

40 Приклади газового носія включають фторвуглець, бутан, зріджений нафтовий газ (ЗНГ), диметилловий ефір і діоксид вуглецю.

Приклади поверхнево-активної речовини включають складні ефіри алкілсульфати, солі алкілсульфонати, солі алкіларилсульфонати, алкіларилові ефіри і їх поліоксіетилен-похідні, поліоксіетиленгліколеві ефіри, складні ефіри багатоатомного спирту і похідні цукрового спирту.

45 Приклади допоміжної речовини для складу включають зв'язувальну речовину і диспергуючу речовину, визначено включають казеїн, желатин, полісахариди (наприклад, крохмаль, гуміарабік, похідні целюлози, альгінову кислоту), похідні лігніну, бентоніт, сахариди, синтетичні водорозчинні полімери (наприклад, полівініловий спирт, полівінілпіролідон, поліакрилові кислоти), РАР (фосфат ізопропілової кислоти), ВНТ (БГТ) (2,6-ди-трет-бутил-4-метилфенол),

ВНА (суміш 2-трет-бутил-4-метоксифенолу і 3-трет-бутил-4-метоксифенолу), рослинні олії, мінеральні масла, жирні кислоти і складні ефіри жирних кислот.

Спосіб контролювання бур'янів даного винаходу включає стадію застосування ефективної кількості сполуки даного винаходу до бур'янів або ґрунту, в якому бур'яни ростуть. Для способу контролювання бур'янів даного винаходу звичайно використовують гербіцидну композицію даного винаходу. Приклади способу застосування гербіцидної композиції даного винаходу включають обприскування листя бур'янів за допомогою гербіцидної композиції даного винаходу, обробку поверхні ґрунту, де ростуть бур'яни, за допомогою гербіцидної композиції даного винаходу або внесення ґрунту з гербіцидною композицією даного винаходу у ґрунт, де ростуть бур'яни. У способі контролювання бур'янів даного винаходу сполуку даного винаходу використовують у кількості звичайно від 1 до 5000 г, переважно від 10 до 1000 г на 10000 м² області, де бажаний контроль над бур'янами.

Спосіб контролювання артроподів даного винаходу включає застосування ефективної кількості сполуки даного винаходу до артроподів або середовищ проживання артроподів. Для способу контролювання артроподів даного винаходу звичайно використовують склад, який містить сполуку даного винаходу.

При використанні сполуки даного винаходу для контролювання артроподів у сільському господарстві і лісівництві кількість для застосування звичайно складає від 1 до 10000 г/га, переважно від 10 до 1000 г/га сполуки даного винаходу. У способі контролювання артроподів даного винаходу склад, який містить сполуку даного винаходу, можуть застосовувати до рослин, які будуть захищені від артроподів, наприклад, за допомогою розпилення. Крім того, ґрунт можуть обробити складом, який містить сполуку даного винаходу, для контролювання артроподів, проживаючих у ґрунті.

При використанні сполуки даного винаходу для контролювання артроподів у громадській і відповідній санітарним станам навколишнього середовища області, кількість для застосування звичайно складає від 0,001 до 10 мг/м³ сполуки даного винаходу для застосування до простору і від 0,001 до 100 мг/м² сполуки даного винаходу для застосування до поверхні.

Гербіцидну композицію даного винаходу або композицію, що контролює артроподів, можуть використовувати, наприклад, у місці, де вирощують наведені нижче рослини.

"Рослини":

сільськогосподарські культури: кукурудза, рис, пшениця, ячмінь, жито, овес посівний, сорго звичайне, бавовна, соя, арахіс, гречка посівна, цукровий буряк, рапс, соняшник, цукрова тростина, тютюновий лист і подібні;

овочі: овочі з сімейства пасльонових (наприклад, баклажан, помідор, зелений перець, червоний перець, картопля і подібні), овочі з сімейства гарбузових (наприклад, огірок, гарбуз, кабачок, кавун, диня і подібні), овочі з сімейства капустяних (наприклад, японський хрін, ріпа, хрін, кольрабі, китайська капуста, капуста, гірчиця, броколі, цвітна капуста і подібні), овочі з сімейства складноцвітих (наприклад, лопух, вінцева хризантема, артишок, салат-латук і подібні), овочі з сімейства лілейних (наприклад, лук-порей, лук, часник, спаржа і подібні), овочі з сімейства зонтичних (наприклад, морква, петрушка, селера, пастернак посівний і подібні), овочі з сімейства лободових (наприклад, шпинат, швейцарський мангольд і подібні), овочі з сімейства губоцвітих (наприклад, перила, м'ята, базилік і подібні), полуниці, батат, японський батат, таро і подібні;

фрукти: насіннячкові фрукти (наприклад, яблуко, груша, японська груша, китайська айва, айва і подібні), кісточкові фрукти (кістянки) (наприклад, персик, слива, нектарин, японська слива, черешня антипка, абрикоса, слива і подібні), плоди цитрусових культур (наприклад, мандарин, апельсин, лимон, лайм, грейпфрут і подібні), горіхи (наприклад, каштан, волоський горіх, лісовий горіх, мигдаль, фісташка, горіх кеш'ю, горіх макадамія і подібні), ягоди (наприклад, чорниця, журавлина, ожина, малина і подібні), виноград, хурма, маслина, мушмула, банан, кава, фінік, кокосова пальма, олійна пальма і подібні;

дерева, крім плодових дерев: чайний кущ, шовковичне дерево, квітучі дерева і чагарники (наприклад, азалія, камелія, гортензія, камелія сазанка, японське анісове дерево, японська квітуча вишня, тюльпанне дерево, індійський бузок, ароматна оранжева олива і подібні), придорожні дерева (наприклад, ясен, береза, кизил флоридський, евкаліпт, гінґо, бузок, клен, верболистий дуб, тополя, багряник, амброве дерево, платан західний, дзельква, туя, ялиця, тсуга канадська, ялівець твердий, сосна, ялина звичайна, тис, в'яз, каштан звичайний і подібні), коралове дерево, ногоплідник, кедр, японський кипарис, кротон, японський бересклет, японська фотинія і подібні;

газон: Цойсія японська (zoysiagrass, Zoysia matrella і подібні), Бермудські трави (bermudagrass і подібні), польовиця (Agrostis alba, польовиця біла, hilland bent і подібні), тонконіг

луговий (тонконіг луговий, канаркова трава канарська і подібні), костриця (костриця висока, костриця червона, костриця червона повзуча і подібні), ежа збірна, тимофіївка лугова і подібні; і інші: квіти (наприклад, троянда, гвоздика, хризантема, тирлич луговий, гіпсофіла, гербера, календула, шавлія, петунія, вербена, тюльпан, айстра, тирлич, лілія, фіалка триколіорова, цикламен, орхідея, конвалія, лаванда, матіола, декоративна капуста, примула, пуансетія, гладіолус, кетлея, маргаритка, цимбідіум, бегонія і подібні), рослини біологічного палива (ятрофа, сафлор, рижий, просо лозиноподібне, міскант, двокиточник тростиноподібний, арундо тростинний, гібіскус коноплевий, маніока, верба, морські водорості і подібні), декоративні рослини і подібні.

Описані вище "рослини" включають рослини, що мають резистентність відносно гербіцидів, таких як інгібітори HPPD (наприклад, ізоксафлютол), інгібітори ALS (наприклад, імазетапир і тифенсульфурон-метил), інгібітори ферменту, що синтезує EPSP (наприклад, гліфосат), інгібітори ферменту, що синтезує глутамін (наприклад, глюфосинат), інгібітори ацетил CoA карбоксилази (наприклад, сетоксидим), інгібітори PPO (наприклад, флуміоксазин), бромоксиніл, дикамба і 2,4-D, резистентність яких одержана за допомогою класичного методу селекції або методу генної інженерії.

Приклади "рослин", що мають резистентність відносно гербіциду, одержану за допомогою класичного методу селекції, включають рапс, пшеницю, соняшник, рис і кукурудзу, резистентні відносно інгібітору імідазолінону-типу ALS, такого як імазетапир, які знаходяться вже на ринку під торговою маркою Clearfield (зареєстрована торгова марка). Аналогічно, соя, що має резистентність відносно інгібітору сульфонілсечовини-типу ALS, такого як тифенсульфурон-метил, одержана за допомогою класичного методу селекції, знаходиться вже на ринку під торговою маркою сої STS.

Аналогічно, SR кукурудза, одержана за допомогою класичного методу селекції, являє собою приклад рослини, що має резистентність відносно інгібітору ацетил CoA карбоксилази, такого як гербіцид типу тріон оксима або гербіцид типу арилоксифеноксипропіонової кислоти.

Наприклад, рослини, що мають резистентність відносно інгібіторів ацетил CoA карбоксилази, описані у Proc. Natl. Acad. Sci. USA, Vol. 87, pp.7175-7179 (1990).

Крім того, про мутантну ацетил CoA карбоксилазу, яка забезпечує резистентність відносно інгібітору ацетил CoA карбоксилази, повідомляють, наприклад, у Weed Science vol. 53, pp.:728-746(2005). Рослину, що має резистентність відносно інгібітору ацетил CoA карбоксилази, можуть одержати за допомогою введення гена, що кодує мутантну ацетил CoA карбоксилазу, у рослину за допомогою методу генної інженерії або за допомогою введення мутації, зв'язаної з наданням резистентності, у ген рослини, що кодує ацетил CoA карбоксилазу.

Приклади "рослин", що мають резистентність, одержану за допомогою класичного методу селекції, також включають рослини, резистентні відносно нематод і попелиць. Як приклад гена, що надає резистентність відносно попелиць, відомий RAG1.

Додатково нуклеїнові кислоти для введення мутації заміни основ можуть вводити у клітину рослини за допомогою методу хімерапластики (див., Gura T., Repairing the Genome's Spelling Mistakes, Science vol.285, p.316-318 (1999)) для одержання сайт-направленої амінокислотної мутації у гені рослини, на яку будуть впливати за допомогою гербіциду, і таким чином можуть одержати рослину, резистентну відносно гербіциду.

Приклади "рослин", що мають резистентність, одержану за допомогою методу генної інженерії, включають культурні сорти кукурудзи, сої, бавовни, рапсу і цукрового буряка, що мають резистентність відносно гліфосату, які знаходяться вже на ринку під торговою маркою RoundupReady (зареєстрована торгова марка), Agrisure (зареєстрована торгова марка) GT або подібні. Подібно до цього існують культурні сорти кукурудзи, сої, бавовни і рапсу, що мають резистентність відносно глюфосинату, одержану за допомогою методу генної інженерії, які знаходяться вже на ринку під торговою маркою LibertyLink (зареєстрована торгова марка) або подібні. Подібно до цього бавовна, що має резистентність відносно бромоксинілу, одержану за допомогою методу генної інженерії, знаходиться вже на ринку під торговою маркою BXN.

Описані вище "рослини" також включають рослини, що мають здатність виробляти інсектицидний токсин, наприклад, селективний токсин, одержаний з Bacillus, здатність якого передана за допомогою методу генної інженерії.

Приклади інсектицидних токсинів, одержаних у таких генно-інженерних рослинах, включають інсектицидні протеїни, одержані з Bacillus cereus і Bacillus popilliae; інсектицидні протеїни, такі як δ -ендотоксини, одержані з Bacillus thuringiensis (наприклад, Cry1Ab, Cry1Ac, Cry1F, Cry1Fa2, Cry2Ab, Cry3A, Cry3Bb1 і Cry9C), VIP 1, VIP 2, VIP 3 і VIP 3A; інсектицидні протеїни, одержані з нематод; токсини, одержані за допомогою тварин, такі як токсини скорпіона, токсини павука, токсини бджоли і нервові токсини, специфічні до комах; грибні

токсини; рослинний лектин; аглютинін; інгібітори протеази, такі як інгібітори трипсину, інгібітори серинпротеази, інгібітори пататину, цистатину і папаїну; рибосом-інактивуючі білки (RIP (PIB)), такі як рицин, cogn-RIP, абрин, люфін, сапорин і бріудин; ферменти, що метаболізують стероїди, такі як 3-гідроксистероїдоксидаза, екдистероїд-UDP-глікозилтрансфераза і холестериноксидаза; інгібітори екдизони; HMG-CoA редуктаза; інгібітори іонних каналів, такі як інгібітори натрієвих каналів та інгібітори кальцієвих каналів; естеразу ювенільного гормону; рецептори діуретичного гормону; стильбенсинтазу; бібензилсинтазу; хітиназу; і глюканазу.

Токсини, одержані у таких генно-інженерних рослинах, також включають гібридні токсини, частково недостатні токсини і модифіковані токсини інсектицидних протеїнів, таких як протеїни δ-ендотоксину (наприклад, Cry1Ab, Cry1Ac, Cry1F, Cry1Fa2, Cry2Ab, Cry3A, Cry3Bb1 і Cry9C), VIP1, VIP2, VIP3 і VIP3A. Гібридний токсин одержують при комбінуванні різних доменів інсектицидних білків за допомогою методу генної інженерії. Приклад частково недостатнього токсину включає Cry1Ab, в якому видалена частина амінокислот. Приклад модифікованого токсину включає токсин, в якому заміщені одна або більше амінокислот токсину природного походження.

Приклади інсектицидного токсину і генно-інженерної сільськогосподарської рослини, що має здатність виробляти інсектицидний токсин, описані, наприклад, в EP-A-0 374 753, WO 93/07278, WO 95/34656, EP-A-0 427 529, EP-A-451878 або WO 03/052073.

Генно-інженерна сільськогосподарська рослина, що має здатність виробляти інсектицидний токсин, зокрема має резистентність до нападу твердокрилих комах-шкідників, двокрилих комах-шкідників і лускокрилих комах-шкідників.

Генно-інженерні рослини, які мають один або більше генів резистентності відносно комах-шкідників і таким чином виробляють один або більше токсинів, також відомі і деякі з них комерційно доступні. Приклади таких генно-інженерних рослин включають YieldGard (зареєстрована торгова марка) (культурний сорт кукурудзи, що експресує токсин Cry1Ab), YieldGard Rootworm (зареєстрована торгова марка) (культурний сорт кукурудзи, що експресує токсин Cry3Bb1), YieldGard Plus (зареєстрована торгова марка) (культурний сорт кукурудзи, що експресує токсини Cry1Ab і Cry3Bb1), Herculex I (зареєстрована торгова марка) (культурний сорт кукурудзи, що експресує токсин Cry1Fa2 і фосфінотрицин N-ацетилтрансферазу (PAT) для надання резистентності відносно глюфосинату), NuCOTN33B (зареєстрована торгова марка) (культурний сорт бавовни, що експресує токсин Cry1Ac), Bollgard I (зареєстрована торгова марка) (культурний сорт бавовни, що експресує токсин Cry1Ac), Bollgard II (зареєстрована торгова марка) (культурний сорт бавовни, що експресує токсини Cry1Ac і Cry2Ab), VPCOT (зареєстрована торгова марка) (культурний сорт бавовни, що експресує токсин VIP), NewLeaf (зареєстрована торгова марка) (культурний сорт картоплі, що експресує токсин Cry3A), NatureGard Agrisure GT Advantage (зареєстрована торгова марка) (характерна особливість - резистентність відносно гліфосату GA21), Agrisure CB Advantage (зареєстрована торгова марка) (характерна особливість Bt11 метелик кукурудзяний (CB)) і Protecta (зареєстрована торгова марка).

Описані вище "рослини" також включають рослини, що мають здатність виробляти антипатогенну речовину, яку одержують за допомогою методу генної інженерії.

Приклади антипатогенної речовини включають PR протеїни (PRP, описані в EP-A-0 392 225); інгібітори іонних каналів, такі як інгібітори натрієвих каналів та інгібітори кальцієвих каналів (наприклад, KP1, KP4 і KP6 токсини, одержані за допомогою вірусів); стильбенсинтазу; бібензилсинтазу; хітиназу; глюканазу; і речовини, одержані за допомогою мікроорганізмів, такі як пептидні антибіотики, гетероциклічні антибіотики і білкові фактори, залучені до резистентності рослин відносно захворювань. Такі антипатогенні речовини і генно-інженерні рослини, які виробляють антипатогенні речовини, описані в EP-A-0 392 225, WO 95/33818 або EP-A-0 353 191.

Описані вище "рослини" включають рослини, що мають корисні характеристики, такі як компонент модифікованої олії і розширений вміст амінокислот, які одержані за допомогою методу генної інженерії. Приклади таких рослин включають VISTIVE (зареєстрована торгова марка) (низьколіноленова соя, яка має скорочений вміст ліноленової кислоти) і високолізинова (високоолійна) кукурудза (кукурудза, яка має збільшений вміст лізину або олії).

Крім того, описані вище "рослини" включають різновиди складених рослин, які мають комбінацію двох або більше корисних характеристик, таких як описані вище класичні характеристики: резистентність відносно гербіциду і резистентний відносно гербіциду ген, резистентний відносно комах-шкідників інсектицидний ген, ген, що виробляє антипатогенну речовину, компонент модифікованого масла і розширений вміст амінокислот.

При використанні сполуки даного винаходу для рослини, резистентної відносно гербіциду, рослину обробляють послідовно сполукою даного винаходу і гербіцидом, до якого рослина є резистентною (наприклад, гліфосат або його сіль, глюфосинат або його сіль, дикамба або її сіль, імазетапір або його сіль, ізоксафлютол), або сумішшю обох, і таким чином можуть досягти

5 всебічного контролю над бур'янами.

Сполуку даного винаходу можуть використовувати у суміші з або у комбінації з іншими інсектицидами, акарицидами, нематоцидами, фунгіцидами, гербіцидами, регуляторами росту рослин, синергістами і/або антидотами.

Приклади активних інгредієнтів для інсектицидів включають:

10 (1) фосфорорганічні інсектицидні сполуки:

ацефат, бутатіофос, хлоретоксифос, хлорфенвінфос, хлорпірифос, хлорпірифос-метил, ціанофос: CYAP, діазинон, дихлорфентіон: ECP, дихлорфос: DDVP, диметоат, диметилвінфос, дисульфотон, EPN, етіон, етопрофос, етримфос, фентіон: MPP, фенітротіон: MEP, фостіазат, формотіон, ізофенфос, ізоксатіон, малатіон, месульфенфос, метидатіон: DMTP, монокротофос, налед: BRP, оксидепрофос: ESP, паратіон, фозалон, фосмет: PMP, піриміфос-метил, піридафентіон, квіналфос, фентоат: PAP, профенофос, пропафос, протіофос, пірахлорфос, салітіон, сулпрофос, тебупіримфос, темефос, тетрахлорвінфос, тербуфос, тіометон, трихлорфон: DEP, вамідотіон, форат, кадусафос;

(2) карбаматні інсектицидні сполуки:

20 аланікарб, бендіокарб, бенфуракарб, BPMC, карбарил, карбофуран, карбосульфат, хлоетокарб, етіофенкарб, фенобукарб, фенотіокарб, феноксикарб, фураціокарб, ізопрокарб: MIPC, метолкарб, метоміл, метіокарб, оксаміл, піримікарб, пропоксур: PNC, XMC, тіодикарб, ксилікарб, алдикарб;

(3) піретроїдні сполуки:

25 акринатрин, алетрин, бета-цифлутрин, біфентрин, циклопротрин, цифлутрин, цигалотрин, циперметрин, емпетрин, делтаметрин, есфенвалерат, етофенпрокс, фенпропатрин, фенвалерат, флуцитринат, флуфенопрокс, флуметрин, флувалінат, галфенпрокс, іміпротрин, перметрин, пралетрин, піретрини, резметрин, сигма-циперметрин, силафлуофен, тефлутрин, тралометрин, трансфлутрин, тетраметрин, фенотрин, цифенотрин, альфа-циперметрин, дзета-циперметрин, лямбда-цигалотрин, гамма-цигалотрин, фураметрин, тау-флувалінат, метофлутрин, профлутрин, димефлутрин, 2,3,5,6-тетрафтор-4-(метоксиметил)бензил 2,2-диметил-3-(2-ціано-1-пропеніл)циклопропанкарбоксилат, 2,3,5,6-тетрафтор-4-(метоксиметил)бензил 2,2,3,3-тетраметилциклопропанкарбоксилат, протрифенбут;

(4) нереістоксिनіві інсектицидні сполуки:

35 картап, бенсультап, тіоциклам, моносультат, бісультат;

(5) неонікотиніодні сполуки:

імідаклоприд, нітенпірам, ацетаміприд, тіаметоксам, тіаклоприд, динотефуран, клотіанідин;

(6) бензоїлсечовинні інсектицидні сполуки:

40 хлорфлуазурон, бістрифлурон, дифлубензурон, флуазурон, флуциклоксурон, флуфеноксурон, гексафлумурон, луфенурон, новалурон, новімфлумурон, тефлубензурон, трифлумурон;

(7) фенілпіразольні інсектицидні сполуки:

ацетопрол, етипрол, фіпроніл, ваніліпрол, пірипрол, пірафлупрол;

(8) Bt токсин:

45 живі спори або кристалічні токсини, одержані з *Bacillus thuringiensis* і їх суміші;

(9) гідразиніві інсектицидні сполуки:

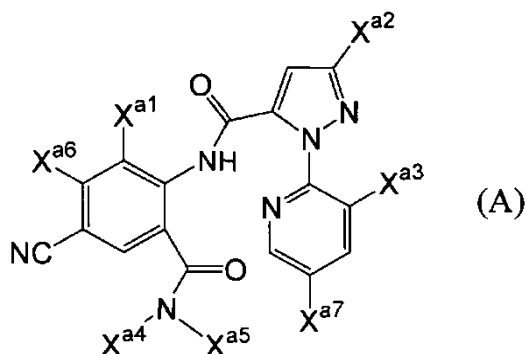
хромафенозид, галофенозид, метоксифенозид, тебуфенозид;

(10) інсектицидні сполуки органічного хлору:

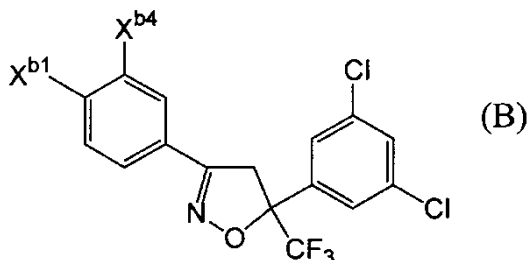
алдрин, діелдрин, хлордан, ДДТ, дієнохлор, ендосульфат, метоксихлор; і

50 (11) інші інсектицидні активні інгредієнти:

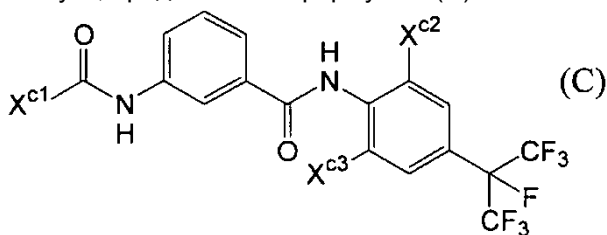
машинне масло, нікотин-сульфат; авермектин-В, бромпропілат, бупрофезин, хлорфенапір, цирмазин, DCIP (дихлордіізопропіловий ефір), D-D (1,3-Дихлорпропен), емаметин бензоат, феназаквін, флупіразофос, гідропрен, метопрен, індоксакарб, метоксadiaзон, мілбеміцин-А, піметрозин, піридаліл, пірипроксифен, спіносад, сульфлурамід, толфенпірад, триазамат, флубендіамід, лепіметин, фосфід алюмінію, оксид миш'яку, бенклотіаз, ціанамід кальцію, полісульфід кальцію, DSP, флонікамід, флуфенерим, форметанат, фосфін, метам-амоній, метам-натрій, метилбромід, олеат калію, спіромезифен, сірка, метафлумізон, спіротетрамат, пірифлуквіназон, спінеторам, хлорантраніліпрол, тралопірил, діафентіурон, сполука, представлена формулою (A):



в якій X^{a1} являє собою метильну групу, хлор, бром або фтор, X^{a2} являє собою фтор, хлор, бром, C_1 - C_4 галогеноалкільну групу або C_1 - C_4 галогеноалкоксигрупу, X^{a3} являє собою фтор, хлор або бром, X^{a4} являє собою необов'язково заміщену C_1 - C_4 алкільну групу, необов'язково заміщену C_3 - C_4 алкенільну групу, необов'язково заміщену C_3 - C_4 алкінільну групу, необов'язково заміщену C_3 - C_5 циклоалкілалкільну групу або водень, X^{a5} являє собою водень або метильну групу, X^{a6} являє собою водень, фтор або хлор і X^{a7} являє собою водень, фтор або хлор, сполука, представлена формулою (B):



в якій X^{b1} являє собою X^{b2} -NH-C(=O) групу, X^{b2} -C(=O)-NH-CH₂ групу, X^{b3} -S(O) групу, необов'язково заміщену пірол-1-ільну групу, необов'язково заміщену імідазол-1-ільну групу, необов'язково заміщену піразол-1-ільну групу або необов'язково заміщену 1,2,4-триазол-1-ільну групу, X^{b2} являє собою необов'язково заміщену C_1 - C_4 галогеноалкільну групу, таку як 2,2,2-трифторетильна група, або необов'язково заміщену C_3 - C_6 циклоалкільну групу, таку як циклопропільна група, X^{b3} являє собою необов'язково заміщену C_1 - C_4 алкільну групу, таку як метильна група, і X^{b4} являє собою водень, хлор, ціаногрупу або метильну групу; сполука, представлена формулою (C):



в якій X^{c1} являє собою необов'язково заміщену C_1 - C_4 алкільну групу, таку як 3,3,3-трифторпропільна група, необов'язково заміщену C_1 - C_4 алкоксигрупу, таку як 2,2,2-трихлоретоксигрупа, необов'язково заміщену фенільну групу, таку як 4-ціанофенільна група, або необов'язково заміщену піридинільну групу, таку як 2-хлор-3-піридинільна група, X^{c2} являє собою метильну групу або трифторметилтіогрупу і X^{c3} являє собою метильну групу або галоген.

Приклади активних інгредієнтів для акарицидів включають:

ацеквіноцил, амітраз, бензоксимат, біфеназат, бромпропілат, хінометіонат, хлорбензилат, CPCBS (хлорфензон), клофентезин, цифлуметофен, кельтан (дікофол), етоксазол, фенбутатину оксид, фенотіокарб, фенпіроксимат, флуакрипирим, галфенпрокс, гекситіазокс, пропаргіт: BPPS, полінактини, піридабен, піримідифен, тебуфенпірад, тетрадіфон, спіродиклофен, спіромезифен, спіротетрамат, амідифлумет і цієнопірафен.

Приклади активних інгредієнтів для нематодцидів включають:

DCIP, фостіазат, левамізол, метил ізотіоціанат, морантел тартрат та іміціафос.

Приклади активних інгредієнтів для фунгіцидів включають:

(1) полігалогеноалкілтіо фунгіцидні сполуки [каптан, фольпет і подібні];

(2) фосфорорганічні фунгіцидні сполуки [IBP, EDDP, толклофос-метил і подібні];

(3) бензімідазольні фунгіцидні сполуки [беноміл, карбендазим, тіофанат-метил, тіабендазол і подібні];

(4) карбоксамідні фунгіцидні сполуки [карбоксин, мепроніл, флутоланіл, тифлузамід, фураметпір, боскалід, пентіопірад і подібні];

5 (5) дикарбоксимідні фунгіцидні сполуки [процимідон, іпродіон, вінклозолін і подібні];

(6) ацилаланінові фунгіцидні сполуки (металаксил і подібні);

(7) азольні фунгіцидні сполуки [тріадимефон, тріадименол, пропіконазол, тебуконазол, ципроконазол, епоксиконазол, протіконазол, іпроконазол, трифлумізол, прохлораз, пенконазол, флусилазол, диніконазол, бромуконазол, дифенокназол, метконазол, 10 тетраконазол, міклобутаніл, фенбуконазол, гексаконазол, флуквінконазол, тритиконазол, бітертанол, імазаліл, флутриафол і подібні];

(8) морфолінові фунгіцидні сполуки [додеморф, тридеморф, фенпропіморф і подібні];

(9) стробілуринові сполуки [азоксистробін, крезоксим-метил, метоміностробін, 15 трифлуксистробін, пікоксистробін, піраклостробін, флуоккастробін, димоксистробін і подібні];

(10) антибіотики [валідаміцин А, бластицидин S, касугаміцин, поліоксин і подібні];

(11) дитіокарбаматні фунгіцидні сполуки [манкозеб, манеб, тіурам і подібні]; і

(12) інші фунгіцидні активні інгредієнти [фталід, пробеназол, ізопротіолан, трициклазол, піроквілон, феримзон, ацибензолар S-метил, карпропамід, диклоцимет, феноксаніл, тіадиніл, 20 дикломезин, теклофталам, пенцицирон, оксолінова кислота, TPN, трифорин, фенпропідин, спіроксамін, флаузінам, іміноктадин, фенпиклоніл, флудіоксоніл, квіноксифен, фенгексамід, силтіофам, проквіназид, цифлуфенамід, бордоська рідина, диклофлуанід, ципродиніл, піриметаніл, мепаніпірим, діетофенкарб, пірибенкарб, фамоксадон, фенамідон, зоксамід, етабоксам, амисульбром, іпровалікарб, бентіавалікарб, ціазофамід, мандипропамід, метрафенон, флуопірам, біксафен і подібні].

25 Приклади активних інгредієнтів для гербіцидів включають:

(1) фенокси жирнокислотні гербіцидні сполуки [2, 4-РА, MCP, MCPB, фенотіол, мекопроп, флуороксіпір, триклопір, кломепроп, напроанлід і подібні];

(2) бензоатні гербіцидні сполуки [2,3,6-ТВА, дикамба, клопіралід, піклорам, амінопіралід, 30 квінклорак, квінмерак і подібні];

(3) сечовинні гербіцидні сполуки [діурон, лінурон, хлортолурон, ізопротурон, флуометурон, ізоурон, тебутіурон, метабензтіазурон, кумулурон, даімурон, метил-даімурон і подібні];

(4) триазинові гербіцидні сполуки [атразин, аметорин, ціаназин, симазин, пропазин, симетрин, диметаметрин, прометрин, метрибузин, триазифлам, індазифлам і подібні];

(5) біпіридинієві гербіцидні сполуки [паракват, дикват і подібні];

35 (6) гідроксибензонітрилові гербіцидні сполуки [бромоксиніл, іюксиніл і подібні];

(7) динітроанілінові гербіцидні сполуки [пендиметалін, продіамін, трифлуралін і подібні];

(8) фосфорорганічні гербіцидні сполуки [аміпрофос-метил, бутаміфос, бенсулід, піперофос, 40 анілофос, гліфосат, глюфосинат, глюфосинат-Р, біалафос і подібні];

(9) карбаматні гербіцидні сполуки [ді-алат, три-алат, ЕРТС, бутилат, бентіокарб, еспрокарб, 40 молінат, димепіперат, свеп, хлорпрофам, фенмедифам, фенізофам, пірибутикарб, азулам і подібні];

(10) гербіцидні сполуки на основі амідів кислот [пропаніл, пропізамід, бромбутид, етобензанід і подібні];

(11) хлорацетанлідні гербіцидні сполуки [ацетохлор, алахлор, бутахлор, диметенамід, 45 пропахлор, метазахлор, метолахлор, претілахлор, тенілхлор, петоксамід і подібні];

(12) дифенілефірні гербіцидні сполуки [ацифлуорфен-натрій, біфенокс, оксифлуорфен, лактофен, фомесафен, хлометоксиніл, аклоніфен і подібні];

(13) гербіцидні сполуки на основі циклічних імідів [оксадіазон, цинідон-етил, карфентразон-етил, сурфентразон, флуміклорак-пентил, флуміоксазин, пірафлуфен-етил, оксадіаргіл, 50 пентоксазон, флутіацет-метил, бутафенацил, бензфендизон, бенкарбазон, сафлуфенацил і подібні];

(14) піразольні гербіцидні сполуки [бензофенап, піразолат, піразоксифен, топрамезон, пірасульфотол і подібні].

(15) трикетоніві гербіцидні сполуки [ізоксафлютол, бензобіциклон, сулькотріон, мезотріон, 55 темботріон, тефурилтріон, біциклопірон і подібні];

(16) арилоксифеноксипропіонатні гербіцидні сполуки [клодинафоп-пропаргіл, цигалофоп-бутил, диклофоп-метил, феноксапроп-етил, флаузіфоп-бутил, галоксифоп-метил, квізалофоп-етил, метаміфоп і подібні];

(17) триоксимні гербіцидні сполуки [алоксидим-натрій, сетоксидим, бутроксидим, 60 клетодим, клопроксидим, циклоксидим, тепралоксидим, тралоксидим, профоксидим і подібні];

(18) сульфонілсечовинні гербіцидні сполуки [хлорсульфурон, сульфометурон-метил, метсульфурон-метил, хлоримурон-етил, трибенурон-метил, триасульфурон, бенсульфурон-метил, тифенсульфурон-метил, піразосульфурон-етил, примісульфурон-метил, нікосульфурон, амідосульфурон, циносульфурон, імазосульфурон, римсульфурон, галосульфурон-метил, просульфурон, етаметсульфурон-метил, трифлусульфурон-метил, флазасульфурон, циклосульфамурон, флупірсульфурон, сульфосульфурон, азимсульфурон, етоксисульфурон, оксасульфурон, йодосульфурон-метил-натрій, формасульфурон, мезосульфурон-метил, трифлорисульфурон, тритосульфурон, ортосульфамурон, флуцетосульфурон, пропірисульфурон, метазосульфурон і подібні];

(19) імідазолінонові гербіцидні сполуки [імазаметабенз-метил, імазаметапір, імазамокс, імазапір, імазаквін, імазетапір і подібні];

(20) сульфонамідні гербіцидні сполуки [флуметсулам, метосулам, диклосулам, флорасулам, клорансулам-метил, пеноксулам, піроксулам і подібні];

(21) піримідинілоксибензоатні гербіцидні сполуки [піритіобак-натрій, біспірибак-натрій, пірмінобак-метил, пірибензоксим, пірифталід, пірмісульфан і подібні]; і

(22) інші гербіцидні активні інгредієнти [бентазон, бромацил, тербацил, хлортіамід, ізоксабен, диносеб, амітрол, цинметилін, тридифан, далапон, дифлуфензопір-натрій, дитіопір, тіазопір, флукарбазон-натрій, пропоксикарбазон-натрій, мефенацет, флуфенацет, фентразамід, кафенстрол, інданофан, оксацикломефон, бенфуресат, ACN, піридат, хлоридазон, норфлуразон, флуртамон, дифлуфенікан, піколінафен, бефлбутамід, кломазон, амікарбазон, піноксаден, піраклоніл, піроксасульфон, тіенкарбазон-метил, аміноциклопірахлор, іпфенкарбазон, метіозолін, феноксасульфон і подібні].

Приклади активних інгредієнтів для регуляторів росту рослин включають:

гімексазол, паклобутразол, уніказол-Р, інабенфід, прогексацион-кальцій, авігліцин, 1-нафталінацетамід, абсцизова кислота, індолілмасляна кислота, етихлорат, етефон, клоксифонак, хлормекват, дихлорпроп, гібереліни, прогідроясмон, бензиладенін, форхлорфенурон, гідрозид малеїнової кислоти, пероксид кальцію, мепікват-хлорид і 4-CPA (4-ХФОК) (4-хлорфеноксіоцтова кислота).

Приклади активних інгредієнтів для синергістів включають:

піпероніл бутоксид, сезамекс, сульфоксид, N-(2-етилгексил)-8,9,10-тринорборн-5-ен-2,3-дихарбоксимід (MGK 264), N-декліімідазол, WARF-антирезистентний, TBPT, TPP, IBP, PSCP, метилйодид (CH₃I), трет-фенілбутенон, діетилмалеат, DMC, FDMC, ETP і ETN.

Приклади активних інгредієнтів для антидотів включають:

фурилазол, дихлормід, беноксакор, алідохлор, ізоксацифен-етил, фенхлоразол-етил, мефенпір-діетил, клоквінтоцет-мексил, фенклорим, ципросульфамід, ціометриніл, оксабетриніл, флуксофенім, флуразол, 2-дихлорметил-2-метил-1,3-діоксолан і 1,8-нафталіновий ангідрид.

Приклади бур'янів, які можуть контролювати за допомогою сполуки даного винаходу, включають:

Digitaria ciliaris, *Eleusine indica*, *Setaria viridis*, *Setaria faberi*, *Setaria glauca*, *Echinochloa crus-galli*, *Panicum dichotomiflorum*, *Panicum texanum*, *Brachiaria platyphylla*, *Brachiaria plantaginea*, *Sorghum halepense*, *Andropogon sorghum*, *Avena fatua*, *Lolium multiflorum*, *Alopecurus myosuroides*, *Bromus tectorum*, *Bromus sterilis*, *Phalaris minor*, *Apera spica-venti*, *Poa annua*, *Agropyron repens*, *Cyperus iria*, *Cyperus rotundus*, *Cyperus esculentus*, *Portulaca oleracea*, *Amaranthus retroflexus*, *Amaranthus hybridus*, *Abutilon theophrasti*, *Sida spinosa*, *Fallopia convolvulus*, *Polygonum scabrum*, *Persicaria pennsylvanica*, *Persicaria vulgaris*, *Rumex crispus*, *Rumex obtusifolius*, *Fallopia japonica*, *Chenopodium album*, *Kochia scoparia*, *Polygonum longisetum*, *Solanum nigrum*, *Datura stramonium*, *Ipomoea purpurea*, *Ipomoea hederacea*, *Ipomoea hederacea* var. *integriuscula*, *Ipomoea lacunosa*, *Convolvulus arvensis*, *Lamium purpureum*, *Lamium amplexicaule*, *Xanthium pensylvanicum*, *Helianthus annuus* (дивосил високий), *Matricaria perforata* або *inodora*, *Matricaria chamomilla*, *Chrysanthemum segetum*, *Matricaria matricarioides*, *Ambrosia artemisiifolia*, *Ambrosia trifida*, *Erigeron canadensis*, *Artemisia princeps*, *Solidago altissima*, *Conyza bonariensis*, *Sesbania exaltata*, *Cassia obtusifolia*, *Desmodium tortuosum*, *Trifolium repens*, *Pueraria lobata*, *Vicia angustifolia*, *Commelina communis*, *Commelina benghalensis*, *Galium aparine*, *Stellaria media*, *Raphanus raphanistrum*, *Sinapis arvensis*, *Capsella bursa-pastoris*, *Veronica persica*, *Veronica hederifolia*, *Viola arvensis*, *Viola tricolor*, *Papaver rhoeas*, *Myosotis scorpioides*, *Asclepias syriaca*, *Euphorbia helioscopia*, *Chamaesyce nutans*, *Geranium carolinianum*, *Erodium cicutarium*, *Equisetum arvense*, *Leersia japonica*, *Echinochloa oryzicola*, *Echinochloa crus-galli* var. *formosensis*, *Cyperus difformis*, *Fimbristylis miliacea*, *Eleocharis acicularis*, *Scirpus juncoides*, *Scirpus wallichii*, *Cyperus serotinus*, *Eleocharis kuroguwai*, *Bolboschoenus koshevnikovii*, *Schoenoplectus nipponicus*, *Monochoria vaginalis*, *Lindernia procumbens*, *Dopatrium junceum*, *Rotala indica*, *Ammannia*

multiflora, *Elatine triandra*, *Ludwigia epilobioides*, *Sagittaria pygmaea*, *Alisma canaliculatum*, *Sagittaria trifolia*, *Potamogeton distinctus*, *Oenanthe javanica*, *Callitriche palustris*, *Lindernia micrantha*, *Lindernia dubia*, *Eclipta prostrata*, *Murdannia keisak*, *Paspalum distichum* і *Leersia oryzoides*.

- 5 Приклади артроподів, на які впливає сполука даного винаходу, включають шкідливих комах і шкідливих кліщів, і більш визначено включають наведені нижче артроподи.

Напівтвердокрили клопи:

- Комахи надродини *Fulgoroidea* (Дельфациди), такі як маленькі коричневі комахи надродини *Fulgoroidea* (*Laodelphax striatellus*), комахи надродини *Fulgoroidea* неочищеного рису (*Nilaparvata lugens*) і комахи надродини *Fulgoroidea* білого осадженого рису (*Sogatella furcifera*); цикадки (*Deltocephalidae*), такі як цикадка зелена рисова (*Nephotettix cincticeps*), цикадка зелена рисова (*Nephotettix virescens*) і цикадка зеленого чаю (*Empoasca onukii*); попелиці (*Aphididae*), такі як попелиці бавовняні (*Aphis gossypii*), попелиці зелені персикові (*Myzus persicae*), попелиці капустяні (*Brevicoryne brassicae*), попелиці спіреєві (*Aphis spiraeicola*), попелиці картопляні (*Macrosiphum euphorbiae*), попелиці картопляні (*Aulacorthum solani*), попелиці черемхові звичайні (*Rhopalosiphum padi*), попелиці тропічні цитрусові (*Toxoptera citricidus*) і попелиці борошністі сливові (*Hyalopterus pruni*); щитники (*Pentatomidae*), такі як щитник зелений (*Nezara antennata*), клоп бобовий (*Riptortus clavetus*), клоп-сліпняк рисовий (*Leptocoris chinensis*), волохатий клоп з білим опушенням (*Eysarcoris parvus*) і щитник (*Halyomorpha mista*); білокрилки (*Aleyrodidae*), такі як білокрилка оранжерейна (*Trialeurodes vaporariorum*), білокрилка бататова (*Bemisia tabaci*), білокрилка магнолієва (*Bemisia argentifolii*), білокрилка цитрусова (*Dialeurodes citri*) і білокрилка цитрусова колюча (*Aleurocanthus spiniferus*); червці і щитівки (*Coccidae*), такі як червона померанцева щитівка (*Aonidiella aurantii*), щитівка каліфорнійська (*Comstockaspis perniciosus*), щитівка північна цитрусова (*Unaspis citri*), щитівка рожева воскова (*Ceroplastes rubens*), червець австралійський жолобчатий (*Icerya purchasi*), червець японський борошністий (*Planococcus kraunhiae*), червець Комстока (*Pseudococcus longispinus*) і щитівка шовковична (*Pseudaulacaspis pentagona*); клопи-мереживниці (*Tingidae*); постільні клопи, такі як *Cimex lectularius*; псиліди (*Psyllidae*);

Лускокрилі:

- Вогнівки (*Pyralidae*), такі як свердлувальник рисовий стебловий (*Chilo suppressalis*), свердлувальник жовтий рисовий (*Tryporyza incertulas*), рисова листовійка-вогнівка (*Snaphalocrocis medinalis*), бавовняна листовійка-вогнівка (*Notarcha derogata*), міль індійська борошняна (*Plodia interpunctella*), *Ostrinia furnacalis*, гусениця вогнівки капустяної (*Hellula undalis*) і вогнівка (*Pediasia teterrellus*); совки (*Noctuidae*), такі як совка азіатська бавовняна (*Spodoptera litura*), совка мала наземна (*Spodoptera exigua*), совка рисова (*Pseudaletia separata*), совка капустяна (*Mamestra brassicae*), совка-іпсилон (*Agrotis ipsilon*), совка бурякова (*Plusia nigrisigna*), *Thoricoplosia* spp., *Heliothis* spp. і *Helicoverpa* spp.; білянки (*Pieridae*), такі як білянка звичайна (*Pieris rapae*); листовійки (*Tortricidae*), такі як *Adoxophyes* spp., листовійка східна перськова (*Grapholita molesta*), плодоярка соєва (*Leguminivora glycinivorella*), совка квасоляна (*Matsumuraes azukivora*), листовійка сітчаста (*Adoxophyes orana fasciata*), листовійка маленька чайна (*Adoxophyes* sp.), листовійка чайна східна (*Homona magnanima*), листовійка яблучна (*Archips fuscocupreanus*) і плодоярка яблунева (*Cydia pomonella*); міль-пістрянка (*Gracillariidae*), така як листовійка чайна (*Caloptilia theivora*) і міль-мінер яблунева (*Phyllonorycter ringoneella*); садова міль (*Carposinidae*), така як перськова плодоярка (*Carposina niponensis*); листові міль (*Lyonetiidae*), така як *Lyonetia* spp.; волнянки (*Lymantriidae*), такі як *Lymantria* spp. і *Euproctis* spp.; горностаєва міль (*Yponomeutidae*), така як міль капустяна (*Plutella xylostella*); виїмчастокрила міль (*Gelechiidae*), така як виїмчастокрилка бавовняна (*Pectinophora gossypiella*) і міль картопляна бульбова (*Phthorimaea operculella*); метелик-ведмедиця і споріднені породи (*Arctiidae*), такі як метелик білий американський (*Hyphantria cunea*); справжня міль (*Tineidae*), така як міль (*Tinea translucens*) і міль кімнатна (*Tineola bisselliella*);

Бахромчастокрили:

Західний квітковий (каліфорнійський) трипс (*Frankliniella occidentalis*), пальмовий трипс (*Thrips palmi*), жовтий чайний трипс (*Scirtothrips dorsalis*), тютюновий трипс (*Thrips tabaci*), трипс звичайний (*Frankliniella intonsa*);

- 55 Двокрилі:

- Кулекс (*Culex* spp.), такий як комар звичайний (*Culex pipiens pallens*), *Culex tritaeniorhynchus* і *Culex quinquefasciatus*; *Aedes* spp., такі як жовтолихоманковий комар (*Aedes aegypti*) і азіатський жовтолихоманковий комар (*Aedes albopictus*); комар малярійний, такий як *Anopheles sinensis*; комарі-дергуни (*Chironomidae*); мухи кімнатні (*Muscidae*), такі як муха кімнатна (*Musca domestica*) і муха будинкова (*Muscina stabulans*); м'ясна муха (*Calliphoridae*); саркофагіди (*Sarcophagidae*);

Fannia canicularis; сновиги (Anthomyiidae), такі як муха паросткова (*Delia platura*) і муха цибульна (*Delia antiqua*); мінуючі мушки (Agromyzidae), такі як мінер рисовий (*Agromyza oryzae*), мінер ячмінний (*Hydrellia griseola*), мінер томатний листовий (*Liriomyza sativae*), американський конюшинний мінер (*Liriomyza trifolii*) і пасльонова мінуюча муха (*Chromatomyia horticola*); злакові мушки (Chloropidae), такі як рисова стеблова личинка (*Chlorops oryzae*); строкатокрилки (Tephritidae), такі як муха динна (*Dacus cucurbitae*) і муха середземноморська плодова (*Ceratitis capitata*); дрозюфіли (Drosophilidae); горбатки (Phoridae), такі як *Megaselia spiracularis*; метелівки (Psychodidae), такі як *Clogmia albipunctata*; мошки (Simuliidae); гедзі (Tabanidae), такі як гедзь (*Tabanus trigonus*); жигалка звичайна (Stomoxysidae);

Твердокрилі:

Жуки-блішки (*Diabrotica* spp.), такі як західний кукурудзяний жук (*Diabrotica virgifera virgifera*) і блішка 11-крапкова Говарда (*Diabrotica undecimpunctata howardi*); пластинчатувусі жуки (Scarabaeidae), такі як хрущик медяний (*Anomala cuprea*), хрущик соєвий (*Anomala rufocuprea*) і хрущик японський (*Popillia japonica*); довгоносики (Curculionidae), такі як кукурудзяний довгоносик (*Sitophilus zeamais*), довгоносик рисовий водяний (*Lissorhoptrus oryzophilus*), зернівка бобова китайська (*Callosobruchus chinensis*), рисовий довгоносик (*Echinocnemus squameus*), довгоносик бавовняний (*Anthonomus grandis*) і мисливський довгоносик (*Sphenophorus venatus*); чорниші (Tenebrionidae), такі як борошняний хрущак великий (*Tenebrio molitor*) і хрущак каштановий (*Tribolium castaneum*); листоїди (Chrysomelidae), такі як п'явиця рисова (*Oulema oryzae*), гарбузовий листоїд (*Aulacophora femoralis*), блішка земляна світлонога (*Phyllotreta striolata*) і жук колорадський картопляний (*Leptinotarsa decemlineata*); шкіроїди (Dermestidae), такі як шкіроїд коров'яковий (*Anthrenus verbasci*) і шкіроїд плямистий (*Dermestes maculatus*); шашелі (Anobiidae), такі як жук тютюновий (*Lasioderma serricornis*); баштанні корівки (*Epilachna*), такі як двадцяти восьми-плямиста картопляна корівка (*Epilachna vigintioctopunctata*); жуки-короїди (Scolytidae), такі як деревогриз темно-бурий (*Lyctus brunneus*) і лубоїд сосновий (*Tomicus piniperda*); псевдокороїди (Bostrichidae); притвірники (Ptinidae); жуки-дроворуби (Cerambycidae), такі як біло-плямистий довгогогий жук (*Anoplophora malasiaca*); жуки-ковалики (*Agriotes* spp.); *Paederus fuscipes*;

Прямокрилі:

Сарана азіатська (*Locusta migratoria*), ведмедик африканський (*Gryllotalpa africana*), кобилка рисова короткокрила (*Oxya yezoensis*), кобилка рисова японська (*Oxya japonica*), цвіркунові (Grylloidea);

Блохи:

Блоха котяча (*Ctenocephalides felis*), блоха собача (*Ctenocephalides canis*), блоха людська (*Pulex irritans*), блоха щуряча південна (*Xenopsylla cheopis*);

Воші:

Людська платтяна воша (*Pediculus humanus corporis*), лобкова воша (*Phthirus pubis*), воша коров'яча коротконога (*Haematopinus eurysternus*), воша овеча (*Damalinia ovis*), воша свиняча (*Haematopinus suis*);

Перетинчастокрилі:

Мурашки (Formicidae), такі як *Monomorium pharaonis*, *Formica fusca japonica*, чорна домашня мурашка (*Ochetellus glaber*), *Pristomyrmex pungens*, *Pheidole noda*, мурашки-листорізи (*Acromyrmex* spp.), і мурашка вогненна (*Solenopsis* spp.); шершні (Vespidae); бетиліди (Bethylidae); справжні пильщики (Tenthredinidae), такі як пильщик рапсовий (*Athalia rosae*), і *Athalia japonica*;

Таргани:

Таргани (Blattariae), такі як тарган рудий (*Blattella germanica*), тарган димчасто-коричневий (*Periplaneta fuliginosa*), тарган американський (*Periplaneta americana*), *Periplaneta brunnea* і тарган чорний (*Blatta orientalis*);

Терміти:

Терміти (Termitidae), такі як терміт жовтоногий японський (*Reticulitermes speratus*), терміт жовтоногий тайванський (*Coptotermes formosanus*), західний суходеревний терміт (*Incisitermes minor*), Дайкоку суходеревний терміт (*Cryptotermes domesticus*), *Odontotermes formosanus*, *Neotermes koshunensis*, *Glyptotermes satsumensis*, *Glyptotermes nakajimai*, *Glyptotermes fuscus*, *Glyptotermes kodamai*, *Glyptotermes kushimensis*, японський вологодеревний терміт (*Hodotermopsis japonica*), *Coptotermes guangzhouensis*, *Reticulitermes miyatakei*, *Reticulitermes flavipes amamianus*, *Reticulitermes* sp., *Nasutitermes takasagoensis*, *Pericapritermes nitobei*, *Sinocapritermes mushae*, *Reticulitermes flavipes*, *Reticulitermes hesperus*, *Reticulitermes virginicus*, *Reticulitermes tibialis*, *Heterotermes aureus* і *Zootermopsis nevadensis*;

Кліщі:

Павутинні кліщі (Tetranychidae), такі як двоплямистий павутинний кліщ (*Tetranychus urticae*), павутинний кліщ Канзави (*Tetranychus kanzawai*), червоний цитрусовий кліщ (*Panonychus citri*), червоний плодовий кліщ (*Panonychus ulmi*) і *Oligonychus* spp.; галові чотириногі кліщі (Eriophyidae), такі як іржастий кліщ цитрусових (*Aculops pelekassi*), *Phyllocoptruta citri*, іржастий кліщ томатів (*Aculops lycopersici*), несправжній червоний кліщ (*Calacarus carinatus*), рожевий чайний іржастий кліщ (*Acapthya theavagran*), *Eriophyes chibaensis* і яблучний іржастий кліщ (*Aculus schlechtendali*); тарзонемідні або прозорі кліщі (Tarsonemidae), такі як оранжереєвий прозорий кліщ (*Polyphagotarsonemus latus*); плоскі кліщі (Tenuipalpidae), такі як *Brevipalpus phoenicis*; тукерелідові кліщі (Tuckerellidae); іксодові кліщі (Ixodidae), такі як *Haemaphysalis longicornis*, *Haemaphysalis flava*, *Dermacentor taiwanicus*, кліщ іксодовий собачий (*Dermacentor variabilis*), *Ixodes ovatus*, *Ixodes persulcatus*, кліщ чорноногий (*Ixodes scapularis*), кліщ зірчастий (*Amblyomma americanum*), *Boophilus microplus* і *Rhipicephalus sanguineus*; саркоптоїдні кліщі (Sarcoptidae), такі як вушний кліщ (*Otodectes cynotis*); коростяні кліщі (Sarcoptidae), такі як *Sarcoptes scabiei*; кліщі (Demodicidae), такі як собачий кліщ (*Demodex canis*); акариди (Acaridae), такі як гнильний подовжений кліщ (*Tyrophagus putrescentiae*) і *Tyrophagus similis*; пірогліфідові кліщі (Pyroglyphidae), такі як *Dermatophagoides farinae* і *Dermatophagoides pteronyssinus*; кліщі-хейлетиди (Cheyletidae), такі як *Cheyletus eruditus*, *Cheyletus malaccensis* і *Cheyletus moorei*; кліщі-дерманісиди (Dermanyssidae), такі як тропічний щурячий кліщ (*Ornithonyssus bacoti*), північний курячий кліщ (*Ornithonyssus sylviarum*) і червоний курячий кліщ (*Dermanyssus gallinae*); кліщі-тромбікуліди (Trombiculidae), такі як *Leptotrombidium akamushi*; павуки (Araneae), такі як японський листяний павук (*Chiracanthium japonicum*), червоноспинний павук (*Latrodectus hasseltii*);

Губоні: *Thereuonema hilgendorfi*, *Scolopendra subspinipes*;

Двопарноногі: багатозв'язи (*Oxidus gracilis*), *Nedyopus tambanus*;

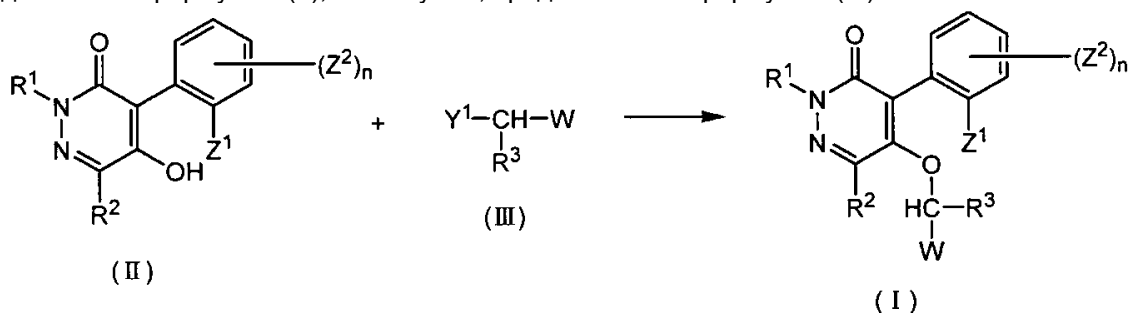
Рівноногі: мокриця-броненосець звичайна (*Armadillidium vulgare*).

Сполуки даного винаходу можуть також використовувати для контролю над паразитами.

Сполуки даного винаходу можуть одержати, наприклад, за допомогою наведених нижче способів одержання.

Спосіб одержання 1

Сполуку, представлену формулою (I), можна одержати за допомогою взаємодії сполуки, представлені формулою (II), зі сполукою, представлену формулою (III).



в якій Y¹ являє собою галоген або групу, представлену формулою: OSO₂R¹³ (в якій R¹³ являє собою C₁₋₃алкільну групу або фенільну групу, в якій C₁₋₃алкільна група може бути заміщена галогеном і фенільна група може бути заміщена галогеном або C₁₋₃алкільною групою), і R¹, R², R³, W, Z¹, Z² і n являють собою, як визначено вище.

Реакцію проводять у розчиннику. Приклади розчинника, що використовується у реакції, включають ароматичні вуглеводні, такі як бензол, толуол і ксилол; прості ефіри, такі як діетиловий ефір, діізопропіловий ефір, діоксан, тетрагідрофуран і диметоксітан; галогеновані вуглеводні, такі як дихлорметан, хлороформ і 1,2-дихлоретан; кетони, такі як ацетон і метилетилкетон; нітрили, такі як ацетонітрил; складні ефіри, такі як етилацетат; аміді, такі як диметилформамід і диметилацетамід; сульфоксиди, такі як диметилсульфоксид; сульфони, такі як сульфолан; і їх суміші.

Кількість сполуки формули (III), що використовується у реакції, становить звичайно 1 моль або більше, переважно від 1 до 3 моль на 1 моль сполуки формули (II).

Реакцію звичайно проводять у присутності основи. Приклади основи, що використовується у реакції, включають органічні основи, такі як триетиламін, трипропіламін, піридин, диметиламінопіридин і 1,8-діазабіцикло[5.4.0]-7-ундецен; і неорганічні основи, такі як гідроксид натрію, гідроксид калію, гідроксид кальцію, карбонат натрію, карбонат калію, гідрокарбонат натрію, карбонат кальцію, гідрид натрію, метоксид натрію, етоксид натрію і трет-бутоксид калію.

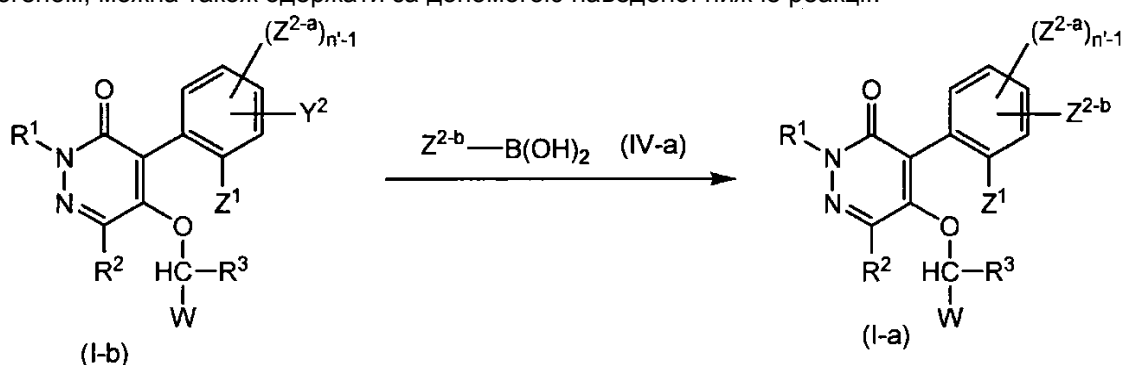
Кількість основи, що використовується у реакції, становить звичайно від 0,5 до 10 моль, переважно від 1 до 5 моль на 1 моль сполуки формули (II).

Температура реакції становить звичайно від -30 до 180 °С, переважно від 0 до 100 °С. Час проведення реакції становить звичайно від 10 хвилин до 30 годин.

Проходження реакції можна підтвердити, аналізуючи частину реакційної суміші за допомогою тонкошарової хроматографії або вискоефективної рідинної хроматографії. Після завершення реакції сполуку, представлену формулою (I), можна виділити, наприклад, за допомогою змішування реакційної суміші з водою з подальшою екстракцією органічним розчинником і потім висушуванням і концентруванням результуючого органічного шару.

Спосіб одержання 2

Сполуку, представлену формулою (I-a), що являє собою сполуку формули (I) даного винаходу, в якій n являє собою 1, 2, 3 або 4, один з Z^2 являє собою C_{3-8} циклоалкільну групу, C_{6-10} арильну групу або 5- або 6-членну гетероарильну групу (в якій C_{3-8} циклоалкільна група, C_{6-10} арильна група і 5- або 6-членна гетероарильна група можуть бути заміщені щонайменше одним членом, вибраним з групи, що складається з галогену і C_{1-6} алкільних груп), і коли n являє собою 2, 3 або 4, інші Z^2 являють собою, як визначено вище, за умови, що виключені галоген, C_{6-10} арильна група, заміщена галогеном, і 5- або 6-членна гетероарильна група, заміщена галогеном, можна також одержати за допомогою наведеної нижче реакції.



в якій Y^2 являє собою галоген; Z^{2-a} являє собою, як визначено вище для Z^2 , за умови, що виключені галоген, C_{6-10} арильна група, заміщена галогеном, і 5- або 6-членна гетероарильна група, заміщена галогеном; Z^{2-b} являє собою C_{3-8} циклоалкільну групу, C_{6-10} арильну групу або 5- або 6-членну гетероарильну групу (в якій C_{3-8} циклоалкільна група, C_{6-10} арильна група і 5- або 6-членна гетероарильна група можуть бути заміщені щонайменше одним членом, вибраним з групи, що складається з галогену і C_{1-6} алкільних груп), R^1 , R^2 , R^3 , W і Z^1 являють собою, як визначено вище, і n являє собою 1, 2, 3 або 4.

Кількість сполуки, представлені формулою (IV-a), що використовується у реакції, становить звичайно 1 моль або більше, переважно від 1 до 3 моль на 1 моль сполуки, представлені формулою (I-b).

Реакцію проводять у розчиннику. Приклади розчинника, що використовується у реакції, включають ароматичні вуглеводні, такі як бензол, толуол і ксилол; спирти, такі як метанол, етанол і пропанол; прості ефіри, такі як діетиловий ефір, діізопропіловий ефір, діоксан, тетрагідрофуран і диметоксіетан; кетони, такі як ацетон і метилетилкетон; нітрили, такі як ацетонітрил; аміді, такі як диметилформамід і диметилацетамід; сульфоксиди, такі як диметилсульфоксид; сульфони, такі як сульфолан; воду; і їх суміші.

Реакцію проводять у присутності основи. Приклади основи, що використовується у реакції, включають органічні основи, такі як триетиламін, трипропіламін, піридин, диметиланілін, диметиламінопіридин і 1,8-дізабіцикло[5.4.0]-7-ундецен; і неорганічні основи, такі як гідроксид натрію, гідроксид калію, гідроксид кальцію, карбонат натрію, карбонат калію, гідрокарбонат натрію, карбонат кальцію, карбонат цезію і фосфат калію. Кількість основи, що використовується у реакції, становить звичайно від 0,5 до 10 моль, переважно від 1 до 5 моль на 1 моль сполуки, представлені формулою (I-b).

Реакцію звичайно проводять у присутності паладієвого каталізатора, такого як тетракіс(трифенілфосфін)паладій, дихлорбіс(трифенілфосфін)паладій або дихлорбіс(трициклогексилфосфін)паладій. Кількість паладієвого каталізатора, що використовується у реакції, становить звичайно від 0,001 до 0,5 моль, переважно від 0,01 до 0,2 моль на 1 моль сполуки, представлені формулою (I-b).

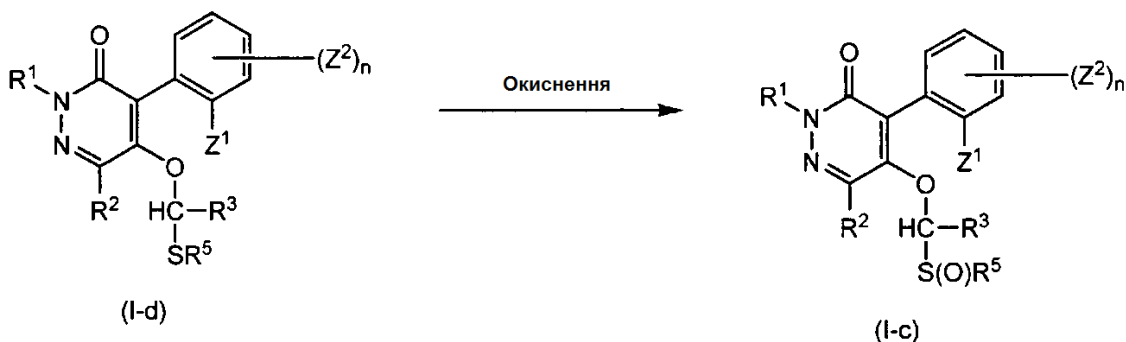
Температура реакції становить звичайно від 20 до 180 °С і переважно від 60 до 150 °С. Час проведення реакції становить звичайно від 30 хвилин до 100 годин.

Проходження реакції можна підтвердити, аналізуючи частину реакційної суміші за допомогою тонкошарової хроматографії або вискоефективної рідинної хроматографії. Після завершення реакції сполуку, представлену формулою (I-a), можна виділити, наприклад, за допомогою змішування реакційної суміші з водою з подальшою екстракцією органічним розчинником і потім висушуванням і концентруванням результуючого органічного шару.

5

Спосіб одержання 3

Сполуку, представлену формулою (I-c), яка являє собою сполуку формули (I), в якій W являє собою $-S(O)R^5$, можна також одержати за допомогою наведеної нижче реакції.



10

в якій R^1 , R^2 , R^3 , R^5 , Z^1 , Z^2 і n являють собою, як визначено вище.

У реакції використовують окисник. Приклади окисника включають пероксид водню; надкислоти, такі як надоцтова кислота, надбензойна кислота і м-хлорнадбензойна кислота; періодат натрію, озон, діоксид селену, хромову кислоту, тетраоксид діазоту, ацетилнітрат, йод, бром, NBS і йодозилбензол. Кількість окисника, що використовується у реакції, становить звичайно від 0,8 до 1,2 моль на 1 моль сполуки, представлені формулою (I-d).

15

Реакцію проводять у розчиннику. Приклади розчинника, що використовується у реакції, включають насичені вуглеводні, такі як гексан, гептан, октан і циклогексан; ароматичні вуглеводні, такі як бензол, толуол, ксилол, хлорбензол і дихлорбензол; галогеновані насичені вуглеводні, такі як дихлорметан, хлороформ, 1,2-дихлоретан і тетрахлорид вуглецю; спирти, такі як метанол, етанол і пропанол; нітрили, такі як ацетонітрил; аміді, такі як диметилформамід і диметилацетамід; сульфи, такі як сульфолан; органічні кислоти, такі як оцтова кислота і пропіонова кислота; воду; і їх суміші.

20

Температура реакції становить звичайно від -50 до 100 $^{\circ}\text{C}$, переважно від 0 до 50 $^{\circ}\text{C}$. Час проведення реакції становить звичайно від 10 хвилин до 100 годин.

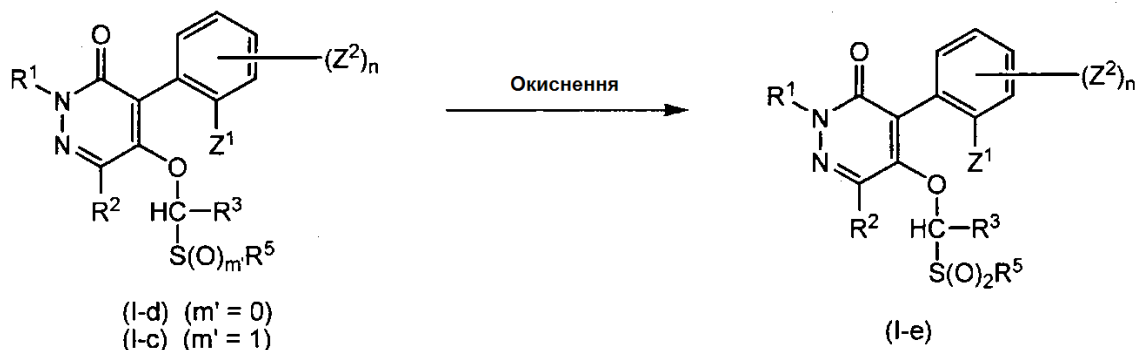
25

Проходження реакції можна підтвердити, аналізуючи частину реакційної суміші за допомогою тонкошарової хроматографії або вискоефективної рідинної хроматографії. Після завершення реакції сполуку, представлену формулою (I-c), можна виділити, наприклад, за допомогою змішування реакційної суміші з водою з подальшою екстракцією органічним розчинником і потім висушуванням і концентруванням результуючого органічного шару.

30

Спосіб одержання 4

Сполуку, представлену формулою (I-e), яка являє собою сполуку формули (I), в якій W являє собою $-S(O)_2R^5$, можна також одержати за допомогою наведеної нижче реакції.



в якій m' являє собою 0 або 1 і R^1 , R^2 , R^3 , R^5 , Z^1 , Z^2 і n являють собою, як визначено вище.

35

У реакції використовують окисник. Приклади окисника включають пероксид водню; надкислоти, такі як надоцтова кислота, надбензойна кислота і м-хлорнадбензойна кислота; періодат натрію, озон, діоксид селену, хромову кислоту, тетраоксид діазоту, ацетилнітрат, йод,

бром, NBS і йодозилбензол, комбінацію пероксиду водню і вольфрамового каталізатора, комбінацію пероксиду водню і ванадієвого каталізатора і перманганат калію.

При використанні сполуки, представлені формулою (I-d), як вихідного матеріалу, кількість окисника, що використовується у реакції, становить звичайно від 2 до 10 моль, переважно від 2 до 4 моль на 1 моль сполуки, представлені формулою (I-d). При використанні сполуки, представлені формулою (I-c), як вихідного матеріалу, кількість окисника, що використовується у реакції, становить звичайно від 1 до 10 моль, переважно від 1 до 3 моль на 1 моль сполуки, представлені формулою (I-c).

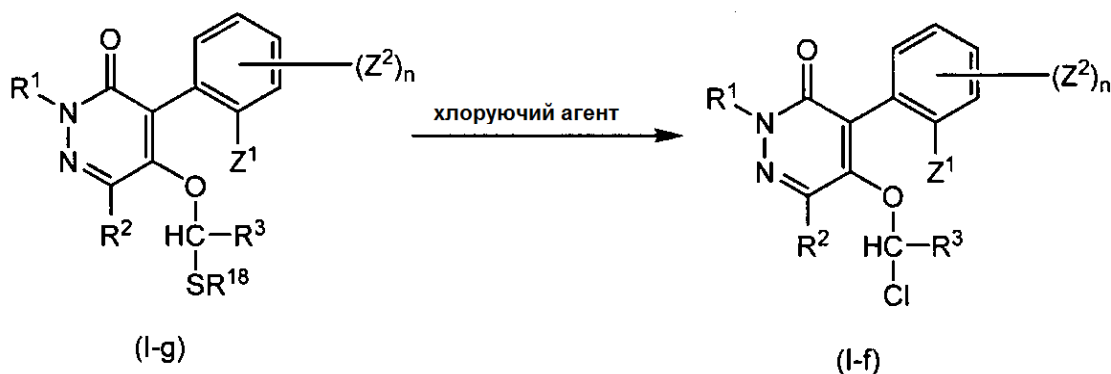
Реакцію проводять у розчиннику. Приклади розчинника, що використовується у реакції, включають насичені вуглеводні, такі як гексан, гептан, октан і циклогексан; ароматичні вуглеводні, такі як бензол, толуол, ксилол, хлорбензол і дихлорбензол; галогеновані насичені вуглеводні, такі як дихлорметан, хлороформ, 1,2-дихлоретан і тетрахлорид вуглецю; спирти, такі як метанол, етанол і пропанол; нітрили, такі як ацетонітрил; аміди, такі як диметилформамід і диметилацетамід; сульфони, такі як сульфолан; органічні кислоти, такі як оцтова кислота і пропіонова кислота; воду; і їх суміші.

Температура реакції становить звичайно від 0 до 200 °С, переважно від 20 до 150 °С. Час проходження реакції становить звичайно від 30 хвилин до 100 годин.

Проходження реакції можна підтвердити, аналізуючи частину реакційної суміші за допомогою тонкошарової хроматографії або вискоєфективної рідинної хроматографії. Після завершення реакції сполуку, представлену формулою (I-e), можна виділити, наприклад, за допомогою змішування реакційної суміші з водою з подальшою екстракцією органічним розчинником і потім висушуванням і концентруванням результуючого органічного шару.

Спосіб одержання 5

Сполуку, представлену формулою (I-f), яка являє собою сполуку формули (I), в якій W являє собою хлор, можна також одержати за допомогою наведеної нижче реакції.



в якій R^{18} являє собою C_{1-6} алкілну групу і R^1 , R^2 , R^3 , Z^1 , Z^2 і n являють собою, як визначено вище.

У цій реакції використовують хлоруючий агент. Приклади хлоруючого агента включають сульфурилхлорид. Кількість хлоруючого агента, що використовується у реакції, становить звичайно від 0,8 до 1,2 моль на 1 моль сполуки, представлені формулою (I-g).

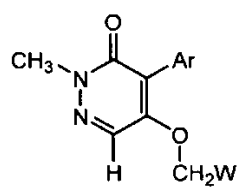
Реакцію проводять у розчиннику. Приклади розчинника, що використовується у реакції, включають галогеновані вуглеводні, такі як дихлорметан, хлороформ і 1,2-дихлоретан.

Температура реакції становить звичайно від -100 до 50 °С, переважно від -80 до 30 °С. Час проходження реакції становить звичайно від 10 хвилин до 30 годин.

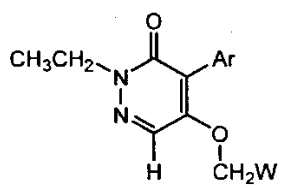
Проходження реакції можна підтвердити, аналізуючи частину реакційної суміші за допомогою тонкошарової хроматографії або вискоєфективної рідинної хроматографії.

Після завершення реакції сполуку, представлену формулою (I-f), можна виділити, наприклад, піддаючи реакційну суміш концентруванню, хроматографічному очищенню і подібному.

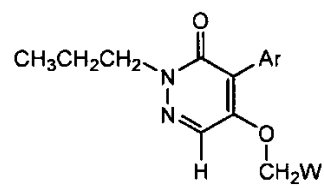
Визначені приклади сполуки даного винаходу включають:



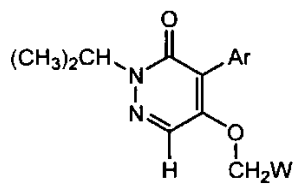
(I ¹)



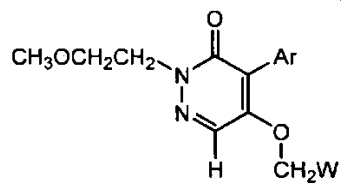
(I ²)



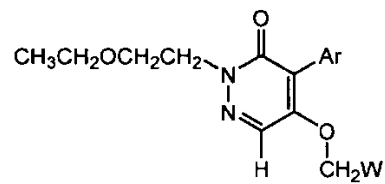
(I ³)



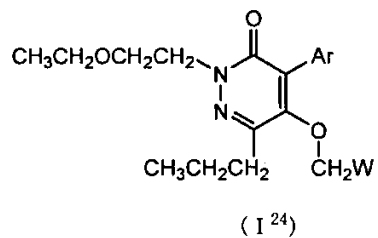
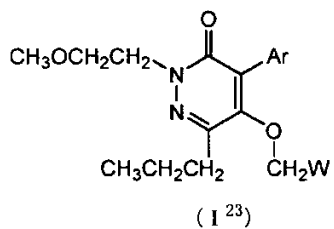
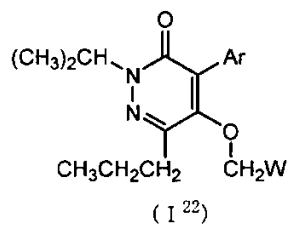
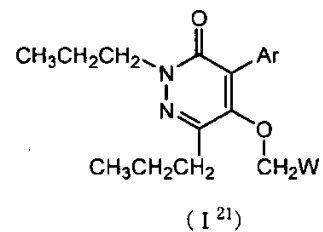
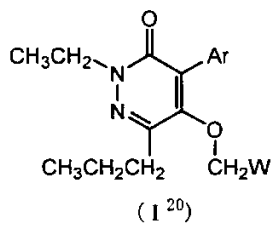
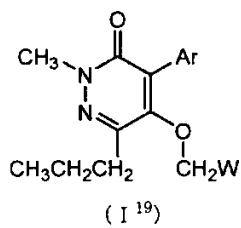
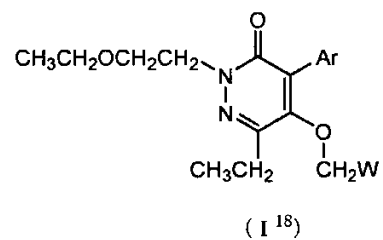
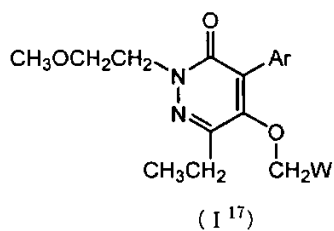
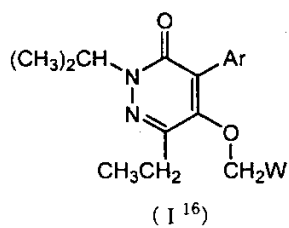
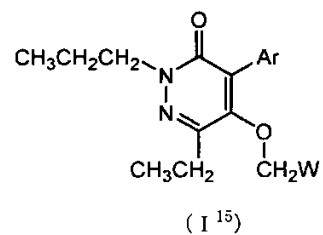
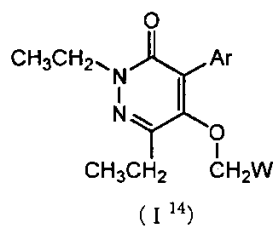
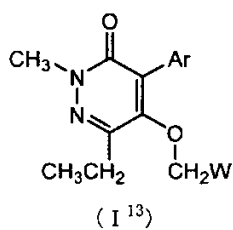
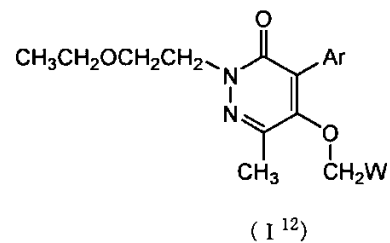
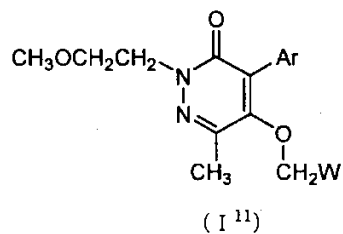
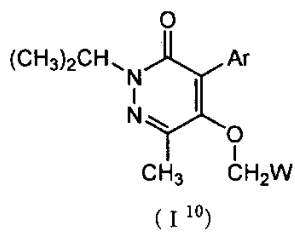
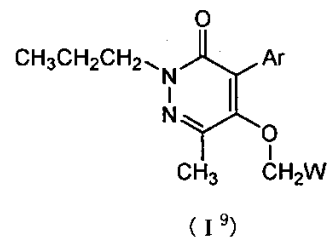
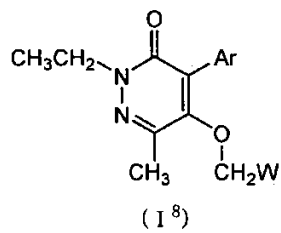
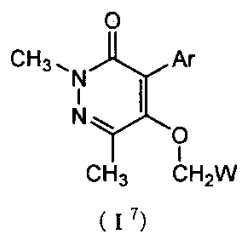
(I ⁴)



(I ⁵)



(I ⁶)



етоксигрупу, пропілоксигрупу, ізопропілоксигрупу, бензилоксигрупу, метилтіогрупу, етилтіогрупу, метилсульфінільну групу, метилсульфонільну групу або N-феніл-N-етоксикарбоніламіногрупу;

42) сполуку піридазину, представлену будь-якою з формул від (I¹) до (I³⁰), в якій Ag являє собою 5-(4-фторфеніл)-2-метилфенільну групу і W являє собою хлор, метоксигрупу, етоксигрупу, пропілоксигрупу, ізопропілоксигрупу, бензилоксигрупу, метилтіогрупу, етилтіогрупу, метилсульфінільну групу, метилсульфонільну групу або N-феніл-N-етоксикарбоніламіногрупу;

43) сполуку піридазину, представлену будь-якою з формул від (I¹) до (I³⁰), в якій Ag являє собою 2-бром-4,6-диметилфенільну групу і W являє собою хлор, метоксигрупу, етоксигрупу, пропілоксигрупу, ізопропілоксигрупу, бензилоксигрупу, метилтіогрупу, етилтіогрупу, метилсульфінільну групу, метилсульфонільну групу або N-феніл-N-етоксикарбоніламіногрупу;

44) сполуку піридазину, представлену будь-якою з формул від (I¹) до (I³⁰), в якій Ag являє собою 2-метокси-4,6-диметилфенільну групу і W являє собою хлор, метоксигрупу, етоксигрупу, пропілоксигрупу, ізопропілоксигрупу, бензилоксигрупу, метилтіогрупу, етилтіогрупу, метилсульфінільну групу, метилсульфонільну групу або N-феніл-N-етоксикарбоніламіногрупу;

45) сполуку піридазину, представлену будь-якою з формул від (I¹) до (I³⁰), в якій Ag являє собою 2-етиніл-4,6-диметилфенільну групу і W являє собою хлор, метоксигрупу, етоксигрупу, пропілоксигрупу, ізопропілоксигрупу, бензилоксигрупу, метилтіогрупу, етилтіогрупу, метилсульфінільну групу, метилсульфонільну групу або N-феніл-N-етоксикарбоніламіногрупу.

Довідковий спосіб одержання 1

Сполуку, представлену формулою (II), можна одержати за допомогою взаємодії сполуки, представленної формулою (V), з гідроксидом металу.



в якій R¹⁴ являє собою C₁₋₆алкільну групу і R¹, R², Z¹, Z² і n являють собою, як визначено вище.

Реакцію звичайно проводять у розчиннику. Приклади розчинника, що використовується у реакції, включають воду; ефіри, такі як тетрагідрофуран і діоксан; і їх суміші.

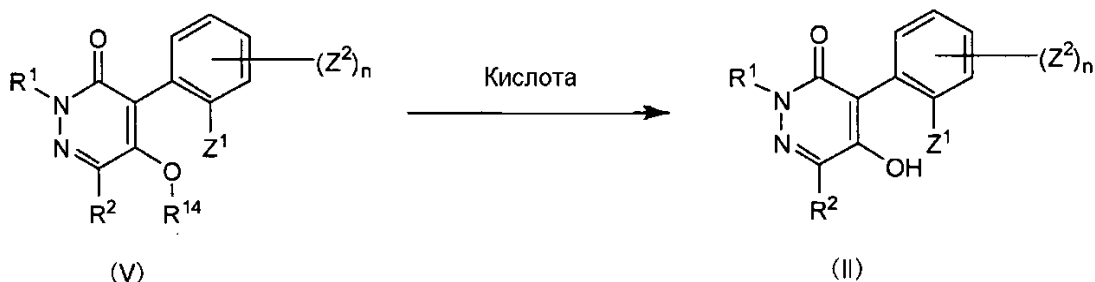
Приклади гідроксиду металу, що використовується у реакції, включають гідроксиди лужних металів, такі як гідроксид натрію і гідроксид калію. Кількість гідроксиду металу, що використовується у реакції, становить звичайно від 1 до 120 моль, переважно від 1 до 40 моль на 1 моль сполуки, представленної формулою (V).

Температура реакції становить звичайно від кімнатної температури до температури кипіння розчинника, переважно температуру кипіння розчинника. Реакцію можна також проводити у запаяній трубці або у розрахованій на високий тиск міцній закритій посудині при нагріванні. Час проходження реакції становить звичайно від приблизно 5 хвилин до декількох тижнів.

Проходження реакції можна підтвердити, аналізуючи частину реакційної суміші за допомогою тонкошарової хроматографії або вискоєфективної рідинної хроматографії. Після завершення реакції сполуку, представлену формулою (II), можна виділити, наприклад, нейтралізуючи реакційну суміш за допомогою додання кислоти, змішуючи реакційну суміш з водою з подальшою екстракцією органічним розчинником і потім висушуванням і концентруванням результуючого органічного шару.

Довідковий спосіб одержання 2

Сполуку, представлену формулою (II), можна також одержати за допомогою взаємодії сполуки, представленної формулою (V), з кислотою.



в якій R^1 , R^2 , R^{14} , Z^1 , Z^2 і n являють собою, як визначено вище.

Реакцію звичайно проводять у розчиннику. Приклади розчинника, що використовується у реакції, включають воду; органічні карбонові кислоти, такі як оцтова кислота і пропіонова кислота; і їх суміші.

Приклади кислоти, що використовується у реакції, включають бромистоводневу кислоту і трифторметансульфонову кислоту. Кількість кислоти, що використовується у реакції, становить звичайно від 1 до 120 моль, переважно від 2 до 20 моль на 1 моль сполуки, представлені формулою (V).

Температура реакції становить звичайно від кімнатної температури до температури кипіння використовуваного розчинника, переважно від 80 °C до температури кипіння розчинника. Реакцію можна також проводити у запайній трубці або у розрахованій на високий тиск міцній закритій посудині при нагріванні. Час проходження реакції становить звичайно від приблизно 5 хвилин до декількох тижнів.

Проходження реакції можна підтвердити, аналізуючи частину реакційної суміші за допомогою тонкошарової хроматографії або вискоєфективної рідинної хроматографії. Після завершення реакції сполуку, представлену формулою (II), можна виділити, наприклад, змішуючи реакційну суміш з водою з подальшою екстракцією органічним розчинником і потім висушуванням і концентруванням результуючого органічного шару.

Сполуку, представлену формулою (II), можна також одержати за допомогою взаємодії сполуки, представлені формулою (V), з кислотою Льюїса з подальшою взаємодією з водним розчином лугу.

Реакцію проводять у розчиннику. Приклади розчинника, що використовується у реакції, включають галогеновані вуглеводні, такі як дихлорметан, хлороформ і 1,2-дихлоретан.

Приклади кислоти Льюїса, що використовується у реакції, включають трибромід бору і хлорид алюмінію. Кількість кислоти Льюїса, що використовується у реакції, становить звичайно від 1 до 10 моль, переважно від 1 до 3 моль на 1 моль сполуки, представлені формулою (V).

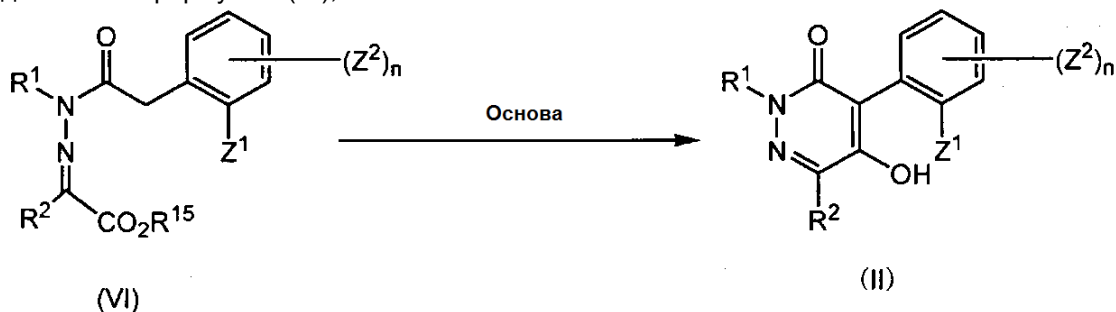
Приклади лугу, що використовується у реакції, включають гідроксид лужного металу або гідроксид лужноземельного металу, такий як гідроксид натрію, гідроксид калію і гідроксид кальцію. Кількість лугу, що використовується у реакції, становить звичайно від 1 до 10 моль на 1 моль сполуки, представлені формулою (V).

Температура реакції становить звичайно від -50 до 100 °C, переважно від 0 до 30 °C. Час проходження реакції становить звичайно від приблизно 5 хвилин до 10 годин.

Проходження реакції можна підтвердити, аналізуючи частину реакційної суміші за допомогою тонкошарової хроматографії або вискоєфективної рідинної хроматографії. Після завершення реакції сполуку, представлену формулою (II), можна виділити, наприклад, змішуючи реакційну суміш з кислотою і водою з подальшою екстракцією органічним розчинником і потім висушуванням і концентруванням результуючого органічного шару.

Довідковий спосіб одержання 3

Сполуку, представлену формулою (II), можна одержати за допомогою взаємодії сполуки, представлені формулою (VI), з основою.



в якій R^{15} являє собою C_{1-6} алкільну групу і R^1 , R^2 , Z^1 , Z^2 і n являють собою, як визначено вище.

Реакцію звичайно проводять у розчиннику. Приклади розчинника, що використовується у реакції, включають ароматичні вуглеводні, такі як бензол, толуол і ксилол; прості ефіри, такі як діетиловий ефір, діізопропіловий ефір, діоксан, тетрагідрофуран і диметоксіетан; галогеновані вуглеводні, такі як дихлорметан, хлороформ і 1,2-дихлоретан; нітрили, такі як ацетонітрil; аміди, такі як диметилформамід і диметилацетамід; сульфоксиди, такі як диметилсульфоксид; сульфони, такі як сульфолан; і їх суміші.

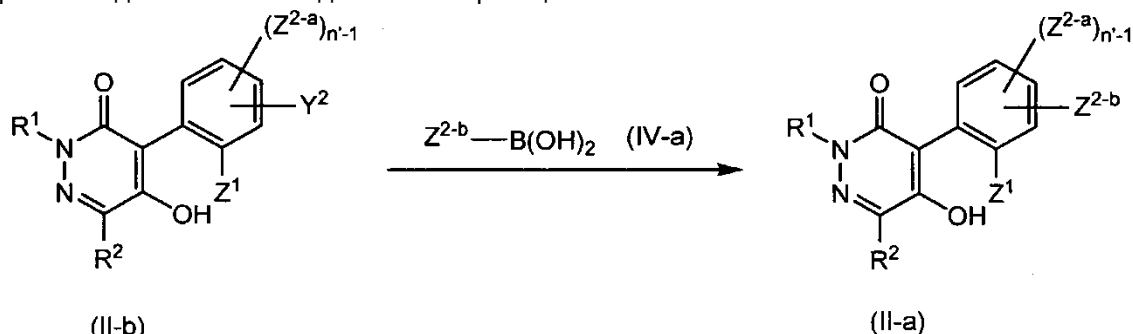
Приклади основи, що використовується у реакції, включають алкоксиди металів, такі як трет-бутоксид калію; гідрид лужного металу, такий як гідрид натрію; і органічні основи, такі як триетиламін, трибутиламін і N , N -діізопропілетиламін. Кількість основи, що використовується у реакції, становить звичайно від 1 до 10 моль, переважно від 2 до 5 моль на 1 моль сполуки, представленої формулою (VI).

Температура реакції становить звичайно від -60 до 180 °C і переважно від -10 до 100 °C. Час проходження реакції становить звичайно від 10 хвилин до 30 годин.

Проходження реакції можна підтвердити, аналізуючи частину реакційної суміші за допомогою тонкошарової хроматографії або вискооефективної рідинної хроматографії. Після завершення реакції сполуку, представлену формулою (II), можна виділити, наприклад, змішуючи реакційну суміш з водою і кислотою з подальшою екстракцією органічним розчинником і потім висушуванням і концентруванням результуючого органічного шару.

Довідковий спосіб одержання 4

Сполуку, представлену формулою (II-a), яка являє собою сполуку формули (II), в якій n являє собою 1, 2, 3 або 4, один з Z^2 являє собою C_{3-8} циклоалкільну групу, C_{6-10} арильну групу або 5- або 6-членну гетероарильну групу (в якій C_{3-8} циклоалкільна група, C_{6-10} арильна група і 5- або 6-членна гетероарильна група можуть бути заміщені щонайменше одним членом, вибраним з групи, що складається з галогену і C_{1-6} алкільних груп), і коли n являє собою 2, 3 або 4, інші Z^2 являють собою, як визначено вище, за умови, що виключені галоген, C_{6-10} арильна група, заміщена галогеном, і 5- або 6-членна гетероарильна група, заміщена галогеном, можна також одержати за допомогою наведеної нижче реакції.



в якій R^1 , R^2 , Z^1 , Z^{2-a} , Z^{2-b} , Y^2 і n являють собою, як визначено вище.

Кількість сполуки, представленої формулою (IV-a), що використовується у реакції, становить звичайно 1 моль або більше, переважно від 1 до 3 моль на 1 моль сполуки, представленої формулою (II-b).

Реакцію проводять у розчиннику. Приклади розчинника, що використовується у реакції, включають ароматичні вуглеводні, такі як бензол, толуол і ксилол; спирти, такі як метанол, етанол і пропанол; прості ефіри, такі як діетиловий ефір, діізопропіловий ефір, діоксан, тетрагідрофуран і диметоксіетан; кетони, такі як ацетон і метилетилкетон; нітрили, такі як ацетонітрil; аміди, такі як диметилформамід і диметилацетамід; сульфоксиди, такі як диметилсульфоксид; сульфони, такі як сульфолан; воду; і їх суміші.

Реакцію проводять у присутності основи. Приклади основи, що використовується у реакції, включають органічні основи, такі як триетиламін, трипропіламін, піридин, диметиланілін, диметиламінопіридин і 1,8-діазабіцикло[5.4.0]-7-ундецен; і неорганічні основи, такі як гідроксид натрію, гідроксид калію, гідроксид кальцію, карбонат натрію, карбонат калію, гідрокарбонат натрію, карбонат кальцію, карбонат цезію і фосфат калію. Кількість основи, що використовується у реакції, становить звичайно від 0,5 до 10 молярних еквівалентів, переважно від 1 до 5 молярних еквівалентів на 1 моль сполуки, представленої формулою (II-b).

Реакцію звичайно проводять у присутності паладієвого каталізатора, такого як тетракіс(трифенілфосфін)паладій, дихлорбіс(трифенілфосфін)паладій або дихлорбіс(трициклогексилфосфін)паладій. Кількість паладієвого каталізатора, що

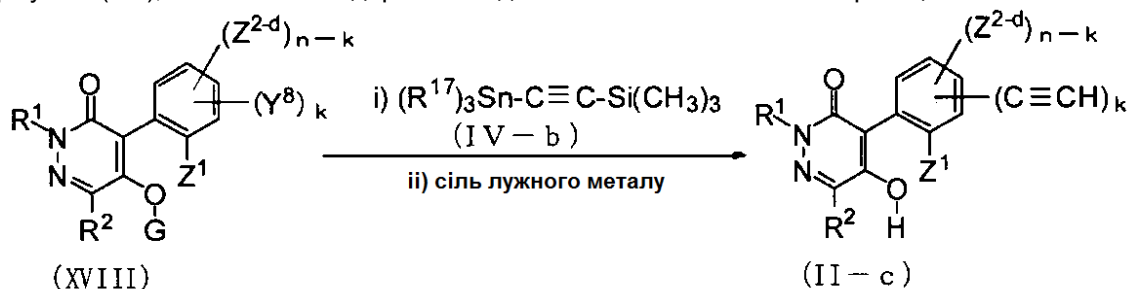
використовується у реакції, становить звичайно від 0,001 до 0,5 моль, переважно від 0,01 до 0,2 моль на 1 моль сполуки, представленої формулою (II-b).

Температура реакції становить звичайно від 20 до 180 °C і переважно від 60 до 150 °C. Час проведення реакції становить звичайно від 30 хвилин до 100 годин.

Проходження реакції можна підтвердити, аналізуючи частину реакційної суміші за допомогою тонкошарової хроматографії або вискоефективної рідинної хроматографії. Після завершення реакції сполуку, представлену формулою (II-a), можна виділити, наприклад, змішуючи реакційну суміш з водою і кислотою з подальшою екстракцією органічним розчинником і потім висушуванням і концентруванням результуючого органічного шару.

Довідковий спосіб одержання 5

Серед сполук, представлених формулою (II), сполуку, представлену наведеною нижче формулою (II-с), можна також одержати за допомогою показаної нижче реакції.



в якій Y^8 являє собою галоген (наприклад, хлор, бром або йод); R^{17} являє собою C_{1-6} алкілну групу (наприклад, метильну групу або бутильну групу); Z^{2-d} являє собою, як визначено для Z^2 , за умови, що виключені C_{2-6} алкілні група, галоген, C_{6-10} арильна група, заміщена щонайменше одним галогеном, і 5- або 6-членна гетероарильна група, заміщена щонайменше одним галогеном; k являє собою 1, 2, 3 або 4; G являє собою C_{1-6} алкілкарбонільну групу або C_{1-6} алкілоксикарбонільну групу; $i R^1, R^2, Z^1$ і n являють собою, як визначено вище.

У реакції сполуку, представлену формулою (XVIII), і металоорганічний реагент, представлений формулою (IV-b), піддають реакції сполучення з подальшою реакцією з сіллю лужного металу для видалення триметилсилільної групи і перетворення G замісника у водень. Таким чином можна одержати сполуку, представлену формулою (II-c).

Першу стадію реакції при використанні сполуки, представлені формулою (IV-b), проводять у розчиннику. Приклади розчинника включають ароматичні вуглеводні, такі як бензол і толуол; прості ефіри, такі як діетиловий ефір, діізопропіловий ефір, діоксан, тетрагідрофуран і диметоксіетан; галогеновані вуглеводні, такі як хлороформ і 1,2-дихлоретан; амід, такі як диметилформамід, диметилацетамід; і їх суміші.

У першій стадії реакції металоорганічний реагент, представлений формулою (IV-b), звичайно можна використовувати у кількості k молярних еквівалентів або більше, переважно від 1 до 10 молярних еквівалентів до сполуки, представленої формулою (XVIII).

Першу стадію реакції проводять у присутності каталізатора. Приклади каталізатора включають паладієві каталізатори, такі як тетракіс(трифенілфосфін)паладій і дихлорбіс(трифенілфосфін)паладій. Кількість каталізатора, що використовується у реакції, становить звичайно від 0,001 до 0,5 молярних еквівалентів, переважно від 0,01 до 0,2 молярних еквівалентів до сполуки, представленої формулою (XVIII).

Температура реакції першої стадії реакції становить звичайно від -80 до 180 °С, переважно від -30 до 150 °С. Час проходження реакції першої стадії реакції становить звичайно від 30 хвилин до 100 годин.

Завершення реакції можна підтвердити за допомогою аналітичних методів, таких як тонкошарова хроматографія, вискоефективна рідинна хроматографія або подібні після взяття зразків частини реакційної суміші. Після завершення реакції продукт з першої стадії реакції можна виділити, наприклад, піддаючи реакційну суміш концентруванню, хроматографічному очищенню і подібному.

Другу стадію реакції при використанні солі лужного металу проводять у розчиннику. Приклади розчинника включають воду; спирти, такі як метанол і етанол; прості ефіри, такі як діоксан, тетрагідрофуран і диметоксіетан; і їх суміші.

Приклади солі лужного металу, що використовується для другої стадії реакції, включають гідроксиди лужних металів, такі як гідроксид натрію і гідроксид калію; і карбонати лужних металів, такі як карбонат натрію і карбонат калію. У другій стадії реакції кількість солі лужного

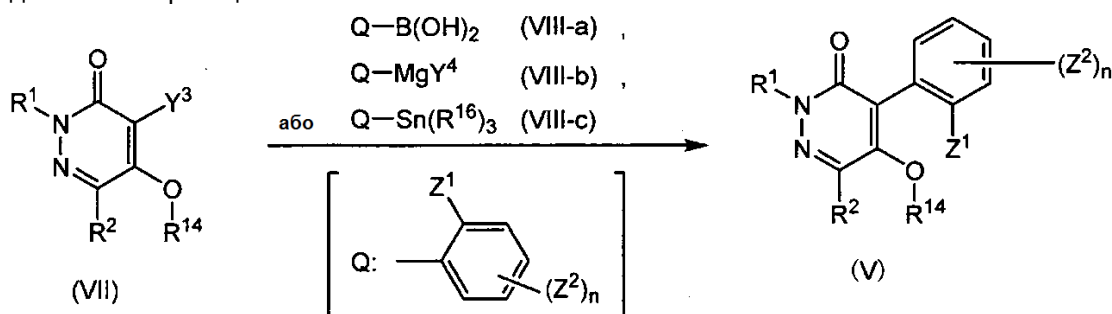
металу становить звичайно $(1+k)$ молярних еквівалентів або більше, переважно від 2 до 10 молярних еквівалентів до сполуки, представленої формулою (XVIII).

Температура реакції другої стадії реакції становить звичайно від -30 до $180\text{ }^{\circ}\text{C}$, переважно від -10 до $50\text{ }^{\circ}\text{C}$. Час проходження реакції другої стадії реакції становить звичайно від 30 хвилин до 100 годин.

Завершення реакції можна підтвердити за допомогою аналітичних методів, таких як тонкошарова хроматографія, високоефективна рідинна хроматографія або подібні після взяття зразків частини реакційної суміші. Після завершення реакції сполуку, представлену формулою (II-c), можна виділити, наприклад, змішуючи реакційну суміш з водою, нейтралізувати реакційну суміш за допомогою додання кислоти з подальшою екстракцією органічним розчинником і потім висушуванням і концентруванням результуючого органічного шару.

Довідковий спосіб одержання 6

Сполуку, представлену формулою (V), можна одержати, наприклад, за допомогою наведеної нижче реакції.



в якій Y^3 являє собою відхідну групу (наприклад, галоген), Y^4 являє собою галоген, R^{16} являє собою C_{1-6} алкільну групу (наприклад, метильну групу або бутильну групу) і R^1 , R^2 , R^{14} , Z^1 , Z^2 і n являють собою, як визначено вище.

Взаємодія сполуки формули (VII) зі сполукою формули (VIII-a):

Реакцію проводять у розчиннику. Приклади розчинника, що використовується у реакції, включають ароматичні вуглеводні, такі як бензол, толуол і ксилол; спирти, такі як метанол, етанол і пропанол; прості ефіри, такі як діетиловий ефір, діізопропіловий ефір, діоксан, тетрагідрофуран і диметоксіетан; кетони, такі як ацетон і метилетилкетон; нітрили, такі як ацетонітрил; аміді, такі як диметилформамід і диметилацетамід; сульфоксиди, такі як диметилсульфоксид; сульфони, такі як сульфолан; воду; і їх суміші.

Реакцію проводять у присутності основи. Приклади основи, що використовується у реакції, включають органічні основи, такі як триетиламін, трипропіламін, піридин, диметиланілін, диметиламінопіридин і 1,8-дізабіцикло[5.4.0]-7-ундецен; і неорганічні основи, такі як гідроксид натрію, гідроксид калію, гідроксид кальцію, карбонат натрію, карбонат калію, гідрокарбонат натрію, карбонат кальцію, карбонат цезію і фосфат калію. Кількість основи, що використовується у реакції, становить звичайно від 0,5 до 10 моль, переважно від 1 до 5 моль на 1 моль сполуки, представленої формулою (VII).

Реакцію звичайно проводять у присутності паладієвого каталізатора, такого як тетракіс(трифенілфосфін)паладій або дихлорбіс(трифенілфосфін)паладій. Кількість каталізатора, що використовується у реакції, становить звичайно від 0,001 до 0,5 моль, переважно від 0,01 до 0,2 моль на 1 моль сполуки, представленої формулою (VII). Реакцію можна також проводити у присутності четвертинної солі амонію. Приклади четвертинної солі амонію, що використовується у реакції, включають тетрабутиламонію бромід.

Кількість сполуки, представленої формулою (VIII-a), що використовується у реакції, становить звичайно 1 моль або більше, переважно від 1 до 3 моль на 1 моль сполуки, представленої формулою (VII).

Температура реакції становить звичайно від 20 до $180\text{ }^{\circ}\text{C}$, переважно від 60 до $150\text{ }^{\circ}\text{C}$. Час проходження реакції становить звичайно від 30 хвилин до 100 годин. Проходження реакції можна підтвердити, аналізуючи частину реакційної суміші за допомогою тонкошарової хроматографії або високоефективної рідинної хроматографії. Після завершення реакції сполуку, представлену формулою (V), можна виділити, наприклад, за допомогою змішування реакційної суміші з водою з подальшою екстракцією органічним розчинником і потім висушуванням і концентруванням результуючого органічного шару.

Взаємодія сполуки формули (VII) зі сполукою формули (VIII-b):

Реакцію проводять у розчиннику. Приклади розчинника, що використовується у реакції, включають ароматичні вуглеводні, такі як бензол, толуол і ксилол; прості ефіри, такі як діетиловий ефір, діізопропіловий ефір, діоксан, тетрагідрофуран і диметоксіетан; і їх суміші.

Реакцію звичайно проводять у присутності нікелевого каталізатора, такого як дихлорбіс(1,3-дифенілфосфін)пропаннікель або дихлорбіс(трифеніл-фосфін)нікель; або паладієвого каталізатора, такого як тетракіс(трифенілфосфін)паладій або дихлорбіс(трифенілфосфін)паладій. Кількість каталізатора, що використовується у реакції, становить звичайно від 0,001 до 0,5 моль, переважно від 0,01 до 0,2 моль на 1 моль сполуки, представлені формулою (VII).

Кількість сполуки, представлені формулою (VIII-b), що використовується у реакції, становить звичайно 1 моль або більше, переважно від 1 до 3 моль на 1 моль сполуки, представлені формулою (VII).

Температура реакції становить звичайно від -80 до 180 °C, переважно від -30 до 150 °C. Час проходження реакції становить звичайно від 30 хвилин до 100 годин. Проходження реакції можна підтвердити, аналізуючи частину реакційної суміші за допомогою тонкошарової хроматографії або високоефективної рідинної хроматографії. Після завершення реакції сполуку, представлену формулою (V), можна виділити, наприклад, за допомогою змішування реакційної суміші з водою з подальшою екстракцією органічним розчинником і потім висушуванням і концентруванням результуючого органічного шару.

Взаємодія сполуки формули (VII) зі сполукою формули (VIII-c):

Реакцію проводять у розчиннику. Приклади розчинника, що використовується у реакції, включають ароматичні вуглеводні, такі як бензол, толуол і ксилол; прості ефіри, такі як діетиловий ефір, діізопропіловий ефір, діоксан, тетрагідрофуран і диметоксіетан; галогеновані вуглеводні, такі як хлороформ і 1,2-дихлоретан; аміді, такі як диметилформамід і диметилацетамід; і їх суміші.

Реакцію звичайно проводять у присутності паладієвого каталізатора, такого як тетракіс(трифенілфосфін)паладій або дихлорбіс(трифенілфосфін)паладій. Кількість каталізатора, що використовується у реакції, становить звичайно від 0,001 до 0,5 моль, переважно від 0,01 до 0,2 моль на 1 моль сполуки, представлені формулою (VII).

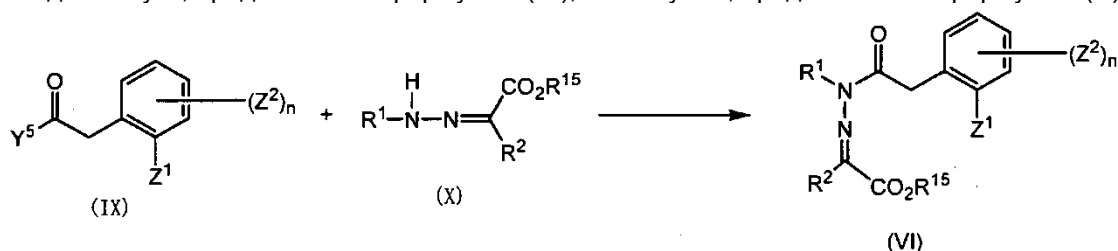
Кількість сполуки, представлені формулою (VIII-c), що використовується у реакції, становить звичайно 1 моль або більше, переважно від 1 до 3 моль на 1 моль сполуки, представлені формулою (VII).

Температура реакції становить звичайно від -80 до 180 °C, переважно від -30 до 150 °C. Час проходження реакції становить звичайно від 30 хвилин до 100 годин.

Проходження реакції можна підтвердити, аналізуючи частину реакційної суміші за допомогою тонкошарової хроматографії або високоефективної рідинної хроматографії. Після завершення реакції сполуку, представлену формулою (V), можна виділити, наприклад, за допомогою змішування реакційної суміші з водою з подальшою екстракцією органічним розчинником і потім висушуванням і концентруванням результуючого органічного шару.

Довідковий спосіб одержання 7

Сполуку, представлену формулою (VI), можна одержати, наприклад, за допомогою взаємодії сполуки, представлені формулою (IX), зі сполукою, представлену формулою (X).



в якій Y^5 являє собою галоген і R^1 , R^2 , R^{15} , Z^1 , Z^2 і n являють собою, як визначено вище.

Реакцію звичайно проводять у розчиннику. Приклади розчинника, що використовується у реакції, включають ароматичні вуглеводні, такі як бензол, толуол і ксилол; прості ефіри, такі як діетиловий ефір, діізопропіловий ефір, діоксан, тетрагідрофуран і диметоксіетан; галогеновані вуглеводні, такі як дихлорметан, хлороформ і 1,2-дихлоретан; кетони, такі як ацетон і метилетилкетон; нітрили, такі як ацетонітрил; аміді, такі як диметилформамід і диметилацетамід; сульфони, такі як сульфолан і їх суміші.

Реакцію звичайно проводять у присутності основи. Приклади основи, що використовується у реакції, включають органічні основи, такі як триетиламін, трипропіламін, піридин, диметиламінопіридин, 1,8-діазабіцикло[5.4.0]-7-ундецен і 1,4-діазабіцикло[2.2.2]октан; і

неорганічні основи, такі як гідроксид натрію, гідроксид калію, гідроксид кальцію, карбонат натрію, карбонат калію, гідрокарбонат натрію, карбонат кальцію і гідрид натрію.

Кількість сполуки, представленої формулою (X), що використовується у реакції, становить звичайно 0,5 моль або більше, переважно від 0,8 до 2 моль на 1 моль сполуки, представленої формулою (IX). Кількість основи, що використовується у реакції, становить звичайно від 0,5 до 10 молярних еквівалентів, переважно від 1 до 5 молярних еквівалентів на 1 моль сполуки, представленої формулою (IX).

Температура реакції становить звичайно від -30 до 180 °С, переважно від -10 до 50 °С. Час проходження реакції становить звичайно від 10 хвилин до 30 годин.

Проходження реакції можна підтвердити, аналізуючи частину реакційної суміші за допомогою тонкошарової хроматографії або вискоєфективної рідинної хроматографії. Після завершення реакції сполуку, представлену формулою (VI), можна виділити, наприклад, за допомогою змішування реакційної суміші з водою з подальшою екстракцією органічним розчинником і потім висушуванням і концентруванням результуючого органічного шару.

Довідковий спосіб одержання 8

Сполуку, представлену формулою (IX), можна одержати, наприклад, за допомогою наведеного нижче способу одержання.

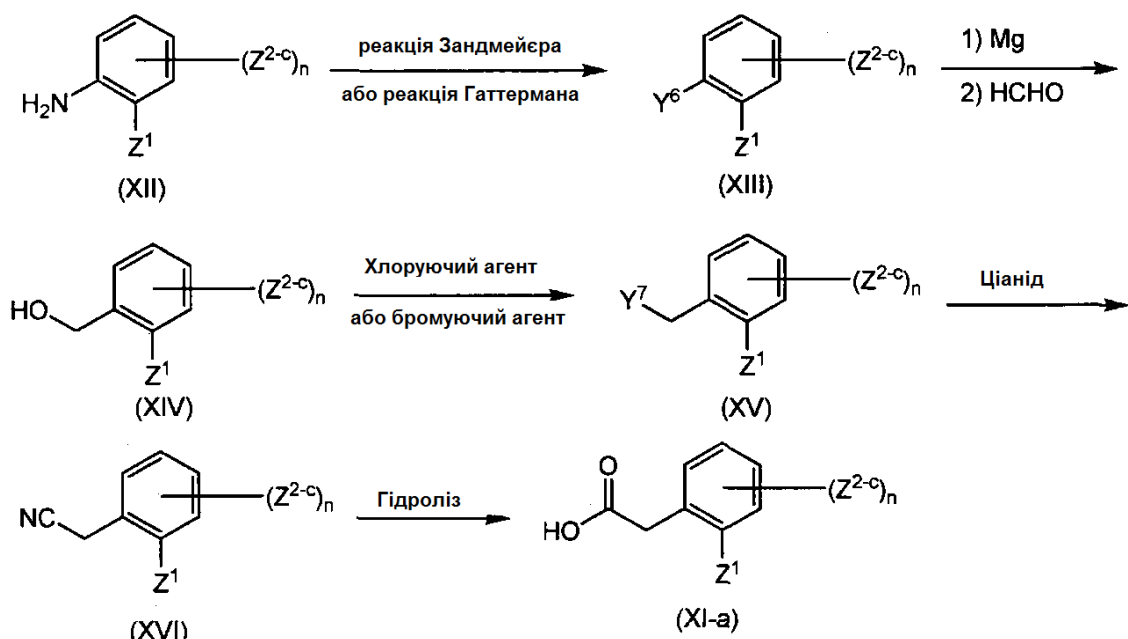


в якій Z^1 , Z^2 , Y^5 і n являють собою, як визначено вище.

Приклади сполуки формули (XI) включають 2,4,6-триметилфенілоцтову кислоту, 2,4,6-триетилфенілоцтову кислоту, 2,6-діетил-4-метилфенілоцтову кислоту, 2-етилфенілоцтову кислоту, 2-етил-4-метилфенілоцтову кислоту, 2-етил-4,6-диметилфенілоцтову кислоту, 2,4-діетилфенілоцтову кислоту, 2,6-діетилфенілоцтову кислоту, 2,4-діетил-6-метилфенілоцтову кислоту, 4-хлор-2,6-діетилфенілоцтову кислоту, 4-бром-2,6-діетилфенілоцтову кислоту, 4-ціано-2,6-діетилфенілоцтову кислоту, 2,6-діетил-4-метоксифенілоцтову кислоту, 2,6-діетил-4-фенілфенілоцтову кислоту, 4-(4-хлорфеніл)-2,6-діетилфенілоцтову кислоту, 2,6-діетил-4-(4-метилфеніл)фенілоцтову кислоту, 2,6-діетил-4-етинілфенілоцтову кислоту, 2,6-діетил-4-нітрофенілоцтову кислоту, 2-ціано-4,6-диметилфенілоцтову кислоту, 2-ціано-6-етил-4-метилфенілоцтову кислоту, 2,4-дихлор-6-метилфенілоцтову кислоту, 2-хлор-4,6-диметилфенілоцтову кислоту, 2-хлор-6-етил-4-метилфенілоцтову кислоту, 2,4-дихлор-6-етилфенілоцтову кислоту, 2-бром-6-етил-4-метилфенілоцтову кислоту, 4-хлор-2-етил-6-метоксифенілоцтову кислоту, 2-етил-6-метокси-4-метилфенілоцтову кислоту, 2-етил-6-етиніл-4-фенілфенілоцтову кислоту, 2-хлор-6-етил-4-фенілфенілоцтову кислоту, 2-етил-6-метокси-4-фенілфенілоцтову кислоту, 2,6-діетил-4-трифторметилфенілоцтову кислоту, 2,6-діетил-4-трифторметоксифенілоцтову кислоту, 2-етил-6-етиніл-4-метилфеніл-оцтову кислоту, 2-хлор-6-етил-4-метоксифенілоцтову кислоту, 2-циклопропіл-6-етил-4-метилфенілоцтову кислоту, 4-циклопропіл-2,6-діетилфенілоцтову кислоту, 5-(4-хлорфеніл)-2-метилфенілоцтову кислоту, 5-(4-фторфеніл)-2-метилфенілоцтову кислоту, 2-бром-4,6-диметилфенілоцтову кислоту, 2-метокси-4,6-диметилфенілоцтову кислоту і 2-етиніл-4,6-диметилфенілоцтову кислоту.

Довідковий спосіб одержання 9

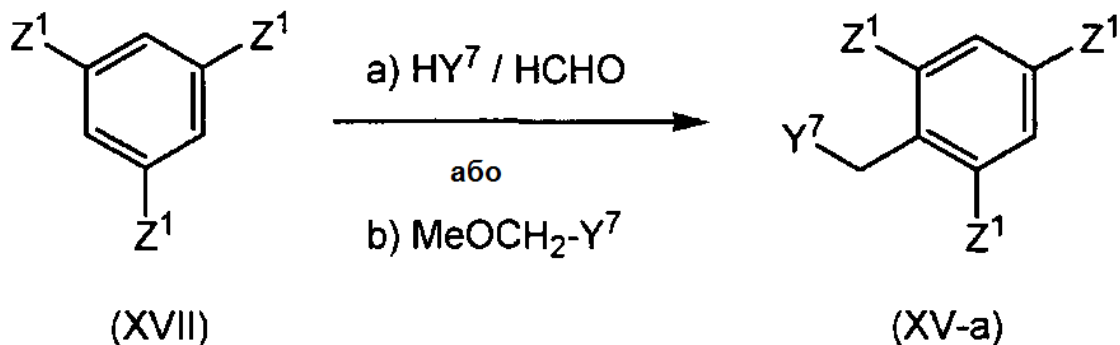
Сполуку, представлену формулою (XI), можна одержати, наприклад, відповідно до наведеної нижче схеми реакції.



5 в якій Z^1 і n являють собою, як визначено вище, Z^{2-c} являє собою, як визначено вище для Z^2 , за умови, що виключені галоген, C_{6-10} арильна група, заміщена галогеном, 5- або 6-членна гетероарильна група, заміщена галогеном, і ціаногрупа, Y^6 являє собою хлор, бром або йод і Y^7 являє собою хлор або бром.

Довідковий спосіб одержання 10

Сполуку, представлену формулою (XV-a), можна одержати, наприклад, за допомогою наведеного нижче способу.



10 в якій Z^1 і Y^7 являють собою, як визначено вище.

Приклади

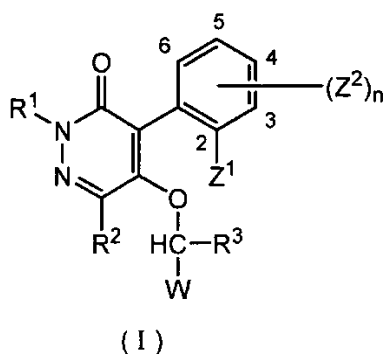
Даний винахід буде описаний більш визначено за допомогою Прикладів, Довідкових прикладів, Прикладів складу і Прикладів дослідження, однак, даний винахід не обмежується прикладами.

15 Приклад 1

До суміші 0,30 г 4-(2,6-діетил-4-метилфеніл)-5-гідрокси-2,6-диметил-3(2H)-піридазину [сполука (II-1-2)] і 10 мл дихлорметану додавали 0,21 г триетиламіну, 0,15 г хлорметилетилового ефіру і 0,013 г 4-диметиламінопіридину. Цю суміш перемішували при кімнатній температурі протягом 23,5 годин. Реакційну суміш концентрували при зниженому тиску. До осаду додавали 20 мл льодяної води з подальшою екстракцією етилацетатом (20 мл x 2). Органічний шар промивали водним насиченим розчином хлориду натрію (10 мл x 2), висушували над безводним сульфатом магнію і потім концентрували при зниженому тиску. Осад піддавали колонковій хроматографії на силікагелі (етилацетат:гексан=1:4) для одержання 0,29 г твердої речовини. Тверду речовину промивали гексаном і висушували для одержання 0,26 г 4-(2,6-діетил-4-метилфеніл)-5-етоксиметокси-2,6-диметил-3(2H)-піридазину [сполука (I-1-2)] у вигляді білого порошку.

¹H ЯМР ($CDCl_3$) δ м. ч.: 1,12 (3H, т, $J=7,1$ Гц), 1,13 (6H, т, $J=7,6$ Гц), 2,27-2,51 (4H, м), 2,33 (3H, с), 2,34 (3H, с), 3,51 (2H, кв., $J=7,1$ Гц), 3,74 (3H, с), 4,53 (2H, с), 6,95 (2H, с).

Сполуки даного винаходу, одержані тим самим способом як у Прикладі 1, показані у Таблиці 1.



Таблиця 1

Номер	R ¹	R ²	Z ¹	(Z ²) _n	R ³	W	Температура плавлення/°C
I-1-1	Me	Me	Et	4-Me, 6-Et	H	OMe	79-80
I-1-2	Me	Me	Et	4-Me, 6-Et	H	OEt	71-72
I-1-3	Me	Me	Et	4-Et, 6-Et	H	OEt	94-95
I-1-4	Me	Me	Et	4-Me, 6-Me	H	OEt	40-42
I-1-5	Me	Me	Et	4-Et, 6-Et	H	OCH ₂ Ph	78-80
I-1-6	Me	Me	Me	5-(4-Cl-Ph)	H	OMe	120-122
I-1-7	Me	H	Me	4-Me, 6-Me	H	OMe	101-102
I-1-8	Me	H	Me	4-Me, 6-Me	H	OEt	*

Для сполуки з символом (*) у колонці Температура плавлення у Таблиці 1 дані ¹H ЯМР показані нижче.

Сполука (I-1-8):

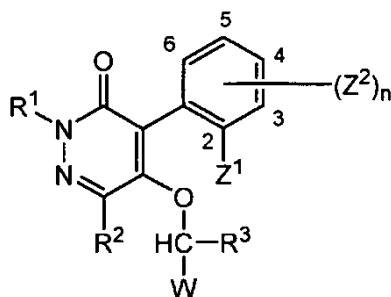
¹H ЯМР (CDCl₃) δ м. ч.: 1,19 (3H, т, J=6,5 Гц), 2,04 (6H, с), 2,30 (3H, с), 3,62 (2H, кв., J=6,5 Гц), 3,82 (3H, с), 5,13 (2H, с), 6,92 (2H, с), 8,03 (1H, с).

Приклад 2

В атмосфері азоту до суміші 0,10 г гідриду натрію (60 % у маслі) і 5 мл N, N-диметилформаміду при охолодженні по краплях додавали розчин 0,30 г 4-(2,6-діетил-4-метилфеніл)-5-гідрокси-2,6-диметил-3(2H)піридазину [сполука (II-1-2)] у 5 мл N, N-диметилформаміду. Цю суміш перемішували при кімнатній температурі протягом 20 хвилин. До реакційної суміші по краплях додавали розчин 0,19 г хлорметилметилсульфіду у 3 мл N, N-диметилформаміду. Потім цю суміш перемішували при кімнатній температурі протягом 22 годин. До реакційної суміші додавали 30 мл льодяної води з подальшою екстракцією етилацетатом (20 мл x 2). Органічний шар промивали водою (20 мл x 2), висушували над безводним сульфатом магнію і потім концентрували при зниженому тиску. Осад піддавали колонковій хроматографії на силікагелі (етилацетат:гексан=1:4) для одержання 0,16 г твердої речовини. Тверду речовину промивали гексаном і висушували для одержання 0,15 г 4-(2,6-діетил-4-метилфеніл)-2,6-диметил-5-метилтіометокси-3(2H)-піридазину [сполука (I-2-1)] у вигляді білого порошку.

¹H ЯМР (CDCl₃) δ м. ч.: 1,13 (6H, т, J=7,6 Гц), 2,10 (3H, с), 2,30-2,50 (4H, м), 2,34 (6H, с), 3,75 (3H, с), 4,51 (2H, с), 6,97 (2H, с).

Сполуки даного винаходу, одержані тим самим способом як у Прикладі 2, показані у Таблиці 2.



(I)

Таблиця 2

Номер	R ¹	R ²	Z ¹	(Z ²) _n	R ³	W	Температура плавлення/°C
I-2-1	Me	Me	Et	4-Me, 6-Et	H	SMe	102-103
I-2-2	Me	Me	Et	4-Et, 6-Et	H	SMe	88-89
I-2-3	Me	Me	Me	5-(4-Cl-Ph)	H	SMe	*

Для сполуки з символом (*) у колонці Температура плавлення у Таблиці 2 дані ¹H ЯМР показані нижче.

Сполука (I-2-3):

¹H ЯМР (CDCl₃) δ м. ч.: 2,06 (3H, c), 2,26 (3H, c), 2,37 (3H, c), 3,78 (3H, c), 4,59 (2H, c), 7,32-7,62 (7H, м).

Приклад 3

До суміші 0,30 г 2,6-диметил-5-метилтіометокси-4-(2,4,6-триетилфеніл)-3(2H)-піридазинону [сполука (I-2-2)] і 4 мл дихлорметану додавали 77 мг м-хлорнадбензойної кислоти з подальшим перемішуванням при кімнатній температурі протягом 30 хвилин. До реакційної суміші додавали водний насичений розчин тіосульфату натрію (10 мл) з подальшою екстракцією хлороформом (10 мл x 2). Органічні шари промивали водним насиченим розчином бікарбонату натрію (10 мл), висушували над безводним сульфатом магнію і потім концентрували при зниженому тиску. Осад піддавали колонковій хроматографії на силікагелі (етилацетат) для одержання 0,16 г 2,6-диметил-5-метилсульфонілметокси-4-(2,4,6-триетилфеніл)-3(2H)-піридазинону [сполука (I-3-1)].

¹H ЯМР (CDCl₃) δ м. ч.: 1,14 (6H, т, J=7,6 Гц), 1,25 (3H, т, J=8,0 Гц), 2,08 (3H, c), 2,34 (3H, c), 2,32-2,49 (4H, м), 2,64 (2H, кв., J=7,6 Гц), 3,75 (3H, c), 4,49 (2H, c), 6,98 (2H, c).

Приклад 4

До суміші 0,30 г 2,6-диметил-5-метилтіометокси-4-(2,4,6-триетилфеніл)-3(2H)-піридазинону [сполука (I-2-2)] і 4 мл дихлорметану додавали 205 мг м-хлорнадбензойної кислоти з подальшим перемішуванням при кімнатній температурі протягом 16 годин. До реакційної суміші додавали водний насичений розчин тіосульфату натрію (10 мл) з подальшою екстракцією хлороформом (10 мл x 2). Органічний шар промивали водним насиченим розчином бікарбонату натрію (10 мл), висушували над безводним сульфатом магнію і концентрували при зниженому тиску. Осад піддавали колонковій хроматографії на силікагелі (етилацетат:гексан=1:1) для одержання 0,23 г 2,6-диметил-5-метилсульфонілметокси-4-(2,4,6-триетилфеніл)-3(2H)-піридазинону [сполука (I-4-1)]. Температура плавлення: від 142 до 143 °C.

Приклад 5

До суміші 0,31 г 2,6-диметил-5-метилтіометокси-4-(2,4,6-триетилфеніл)-3(2H)-піридазинону [сполука (I-2-2)] і 3 мл хлороформу додавали 0,08 мл сульфурилхлориду з подальшим перемішуванням при охолодженні льодом протягом 2,5 годин. Реакційну суміш концентрували при зниженому тиску. Осад піддавали колонковій хроматографії на силікагелі (етилацетат:гексан=1:4) для одержання 0,14 г 5-хлорметокси-2,6-диметил-4-(2,4,6-триетилфеніл)-3(2H)-піридазинону [сполука (I-5-1)]. Температура плавлення: від 103 до 104 °C.

Приклад 6

До суміші 0,30 г 4-(2,6-діетил-4-метилфеніл)-5-гідрокси-2,6-диметил-3(2H)-піридазинону [сполука (II-1-2)] і 5 мл хлороформу додавали 0,22 мл триетиламіну і 0,52 мл етил N-хлорметил-N-фенілкарбамату з подальшим перемішуванням при кімнатній температурі протягом 13,5 годин. Реакційну суміш концентрували при зниженому тиску. Осад піддавали колонковій хроматографії на силікагелі (етилацетат:гексан=1:1) для одержання 0,27 г 4-(2,6-діетил-4-

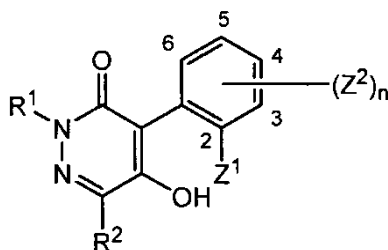
метилфеніл)-5-(N-етоксикарбоніл-N-феніламінометокси)-2,6-диметил-3(2H)-піридазину [сполука (I-6-1)].

¹H ЯМР (CDCl₃) δ м. ч.: 1,11 (6H, т, J=7,2 Гц), 1,18 (3H, т, J=7,2 Гц), 2,29 (3H, с), 2,32 (3H, с), 2,31-2,48 (4H, м), 3,73 (3H, с), 4,15 (2H, кв., J=7,2 Гц), 4,80 (2H, с), 6,92 (2H, с), 7,12 (2H, д, J=7,6 Гц), 7,22-7,40 (3H, м).

Довідковий приклад 1

До 13 мл розчину (1 моль/л) трет-бутоксиду калію у тетрагідрофурані по краплях додавали розчин 1,9 г етил 2-[2-(2,6-діетил-4-метилфенілацетил)-2-метилгідразоно]пропаноату [сполука (VI-2)] у 55 мл толуолу приблизно більше 1 години в атмосфері азоту. Цю суміш перемішували при кімнатній температурі протягом 30 хвилин. Потім реакційну суміш концентрували при зниженому тиску. До осаду додавали 30 мл льодяної води з подальшим промиванням трет-бутилметиловим ефіром (20 мл х 2). До водного шару додавали 1,6 г 35 % хлористоводневої кислоти з подальшою екстракцією етилацетатом (20 мл х 3). Органічний шар промивали водним насиченим розчином хлориду натрію (20 мл х 2), висушували над безводним сульфатом магнію і потім концентрували при зниженому тиску. Осад піддавали колонковій хроматографії на силікагелі (етилацетат:гексан=1:3) для одержання 0,76 г твердої речовини. Тверду речовину промивали гексаном і висушували для одержання 0,59 г 4-(2,6-діетил-4-метилфеніл)-5-гідрокси-2,6-диметил-3(2H)-піридазину [сполука (II-1-2)] у вигляді білого порошку.

Сполуки, одержані тим самим способом як у Довідковому прикладі 1, показані у Таблиці 3.



(II)

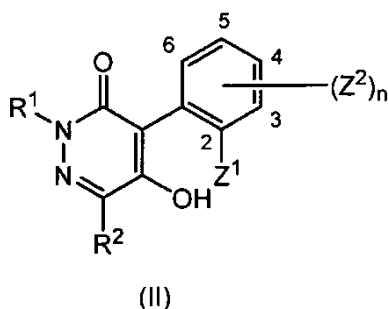
Таблиця 3

Номер	R ¹	R ²	Z ¹	(Z ²) _n	Температура плавлення/°C
II-1-1	Me	Me	Me	4-Me, 6-Me	199-201
II-1-2	Me	Me	Et	4-Me, 6-Et	205-206
II-1-3	Me	Me	Et	4-Et, 6-Et	188-190
II-1-4	Me	Me	Et	4-Me, 6-Me	176-177

Довідковий приклад 2

До суміші 0,55 г трет-бутоксиду калію і 20 мл тетрагідрофурану при від 36 до 38 °C приблизно більше 20 хвилин в атмосфері азоту по краплях додавали розчин 0,79 г етил 2-[2-(4-хлор-2,6-діетилфенілацетил)-2-метилгідразоно]пропаноату [сполука (VI-7)] у толуолі (15 мл). Цю суміш перемішували при від 36 до 38 °C протягом 10 хвилин. Реакційну суміш концентрували при зниженому тиску. До осаду додавали 20 мл льодяної води з подальшим промиванням трет-бутилметиловим ефіром (20 мл х 2). До водного шару додавали 0,6 г 35 % хлористоводневої кислоти з подальшою екстракцією етилацетатом (20 мл х 2). Органічний шар промивали водним насиченим розчином хлориду натрію (20 мл х 2), висушували над безводним сульфатом магнію і потім концентрували при зниженому тиску. Результуючий осад піддавали колонковій хроматографії на силікагелі (етилацетат:гексан=1:4) для одержання 0,1 г твердої речовини. Тверду речовину промивали змішаним розчином етилацетат-гексан (1:10) і висушували для одержання 0,07 г 4-(4-хлор-2,6-діетилфеніл)-5-гідрокси-2,6-диметил-3(2H)-піридазину [сполука (II-1-5)] у вигляді білого порошку.

Сполуки, одержані тим самим способом як у Довідковому прикладі 2, показані у Таблиці 4.



Таблиця 4

Номер	R ¹	R ²	Z ¹	(Z ²) _n	Температура плавлення/°C
II-1-5	Me	Me	Et	4-Cl, 6-Et	234-235
II-1-6	Me	Me	Me	5-(4-Cl-Ph)	234-236

Довідковий приклад 3

До суміші 55 мл діоксану і 17 мл води додавали 1,38 г 4-хлор-5-метокси-2-метил-3(2H)-піридазину, 1,55 г 2,4,6-триметилфенілборонової кислоти, 1,86 г карбонату натрію, 2,53 г тетрабутиламонію броміду і 0,38 г тетракіс(трифенілфосфін)паладію. Цю суміш нагрівали зі зворотним холодильником протягом 32 годин в атмосфері азоту. Частину реакційної суміші випаровували. До результуючого концентрату додавали 150 мл води з подальшою екстракцією етилацетатом (двічі). Органічний шар промивали водним розчином хлориду натрію, висушували над безводним сульфатом магнію і потім концентрували при зниженому тиску. Осад піддавали колонковій хроматографії на силікагелі (етилацетат:гексан=1:2) для одержання 0,77 г 5-метокси-2-метил-4-(2,4,6-триметилфеніл)-3(2H)-піридазину [сполука (V-2-1)] у вигляді білої кристалічної речовини.

Температура плавлення: від 186 до 192 °C.

До розчину 1,4 г сполуки (V-2-1) у 7 мл оцтової кислоти додавали 5 мл 47 % бромистоводневої кислоти з подальшим перемішуванням при 80 °C протягом 5,5 годин і потім при 100 °C протягом 14,5 годин. Реакційну суміш концентрували, доки вона не зменшувалася наполовину. До осаду додавали холодну воду для кристалізації. Кристалічну речовину збирали за допомогою фільтрування, промивали водою і потім висушували. Кристалічну речовину промивали змішаним розчином етилацетат-гексан (2:1) і висушували для одержання 1,1 г 5-гідрокси-2-метил-4-(2,4,6-триметилфеніл)-3(2H)-піридазину [сполука (II-2-1)] у вигляді білої кристалічної речовини.

Температура плавлення: 272-275 °C.

¹H ЯМР (CDCl₃) δ м. ч.: 2,04 (6H, c), 2,29 (3H, c), 3,89 (3H, c), 6,97 (2H, c), 7,67 (1H, c).

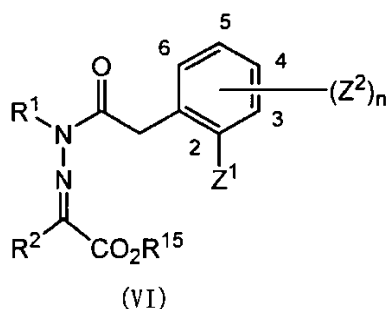
Серед сполук, представлених формулою (II), наведені нижче одержували за допомогою способу, подібного до способу у Довідковому прикладі 3.

5-Гідрокси-2-метил-4-(2,4,6-триетилфеніл)-3(2H)-піридазинон [сполука (II-2-2)] т. пл.: 212-214 °C

Довідковий приклад 4

До суміші 2,0 г етил 2-(метилгідразоно)пропаноату і 35 мл ацетонітрилу додавали 1,5 г карбонату калію. До суміші при охолодженні льодом більше приблизно 20 хвилин по краплях додавали розчин 2,6 г 2,6-діетил-4-метилфенілацетилхлориду у 10 мл ацетонітрилу. Цю суміш перемішували при кімнатній температурі протягом 3,5 годин. Реакційну суміш концентрували при зниженому тиску. До осаду додавали 20 мл льодяної води з подальшою екстракцією етилацетатом (20 мл × 3). Органічний шар промивали водним насиченим розчином хлориду натрію (20 мл × 2), висушували над безводним сульфатом магнію і концентрували при зниженому тиску. Осад піддавали колонковій хроматографії на оксиді алюмінію (етилацетат:гексан=1:3) для одержання 1,9 г етил 2-[2-(2,6-діетил-4-метилфенілацетил)-2-метилгідразоно]пропаноату [сполука (VI-2)] у вигляді білої кристалічної речовини.

Сполуки, представлені формулою (VI), одержані тим самим способом як у Довідковому прикладі 4, показані у Таблиці 5.



Таблиця 5

Номер	R ¹	R ²	Z ¹	(Z ²) _n	R ¹⁵	Температура плавлення/°C
VI-1	Me	Me	Me	4-Me, 6-Me	Et	90-91
VI-2	Me	Me	Et	4-Me, 6-Et	Et	73-76
VI-3	Me	Me	Et	4-Et, 6-Et	Et	63-66
VI-4	Me	Me	Et	4-Me, 6-Me	Et	*
VI-5	Me	Me	Me	4-Me, 6-Me	Me	*
VI-6	Me	Me	Et	4-Et, 6-Et	Me	*

Для сполук з символом (*) у колонці Температура плавлення у Таблиці 5 дані ¹H ЯМР показані нижче.

Сполука (VI-4):

¹H ЯМР (CDCl₃) δ м. ч.: 1,16 (3H, т, J=7,7 Гц), 1,36 (3H, т, J=7,2 Гц), 2,22 (3H, с), 2,27 (3H, с), 2,30 (3H, ушир. с), 2,56 (2H, кв., J=7,7 Гц), 3,39 (3H, ушир. с), 4,02 (2H, ушир. с), 4,32 (2H, кв., J=7,1 Гц), 6,86 (2H, ушир. с).

Сполука (VI-5):

¹H ЯМР (CDCl₃) δ м. ч.: 2,21 (6H, с), 2,25 (3H, с), 2,29 (3H, ушир. с), 3,39 (3H, ушир. с), 3,88 (3H, с), 3,99 (2H, ушир. с), 6,85 (2H, с).

Сполука (VI-6):

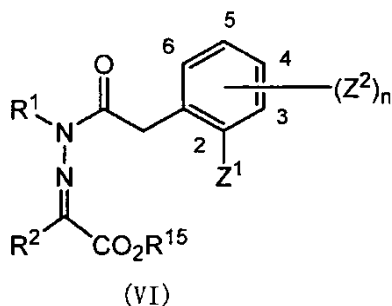
¹H ЯМР (CDCl₃) δ м. ч.: 1,18 (6H, т, J=7,6 Гц), 1,23 (3H, т, J=7,6 Гц), 2,32 (3H, ушир. с), 2,57 (4H, кв., J=7,6 Гц), 2,60 (2H, кв., J=7,6 Гц), 3,40 (3H, ушир. с), 3,88 (3H, с), 4,04 (2H, ушир. с), 6,90 (2H, с).

Довідковий приклад 5

До суміші 1,1 г етил 2-(метилгідрозо)пропаноату і 20 мл ацетонітрилу додавали 0,68 г карбонату калію. До цієї суміші при охолодженні льодом більше приблизно 10 хвилин по краплях додавали розчин 1,26 г 4-хлор-2,6-діетилфенілацетилхлориду у 8 мл ацетонітрилу. Цю суміш перемішували при кімнатній температурі протягом 3 годин. Реакційну суміш концентрували при зниженому тиску. До осаду додавали 20 мл льодяної води з подальшою екстракцією етилацетатом (20 мл, 10 мл х 2). Органічний шар промивали водним насиченим розчином хлориду натрію (20 мл х 2), висушували над безводним сульфатом магнію і концентрували при зниженому тиску. Осад піддавали колонковій хроматографії на оксиді алюмінію (етилацетат:гексан=1:6) для одержання 1,2 г блідо-жовтої твердої речовини. Тверду речовину промивали гексаном і потім висушували для одержання 0,79 г етил 2-[2-(4-хлор-2,6-діетилфенілацетил)-2-метилгідрозо]пропаноату [сполука (VI-7)] у вигляді білого порошку.

Сполуки, представлені формулою (VI), одержані тим самим способом як у Довідковому прикладі 5, показані у Таблиці 6.

Сполуки, представлені формулою (VI):



Таблиця 6

Номер	R ¹	R ²	Z ¹	(Z ²) _n	R ¹⁵	Температура плавлення/°C
VI-7	Me	Me	Et	4-Cl, 6-Et	Et	85-89
VI-8	Me	Me	Me	5-(4-Cl-Ph)	Et	*

Для сполуки з символом (*) у колонці Температура плавлення у Таблиці 6 дані ¹H ЯМР показані нижче.

Сполука (VI-8):

¹H ЯМР (CDCl₃) δ м. ч.: 1,33 (3H, т, J=7,2 Гц), 2,21 (3H, с), 2,35 (3H, с), 3,37 (3H, с), 4,06 (2H, ушир. с), 4,28 (2H, кв., J=7,1 Гц), 7,22 (1H, д, J=7,8 Гц), 7,30-7,40 (3H, м), 7,43 (1H, ушир. с), 7,47 (2H, д, J=8,3 Гц).

Довідковий приклад 6

До суміші 283,03 г 2,6-діетил-4-метилфенілоцтової кислоти і 690,8 г толуолу при 100 °C більше 3 годин по краплях додавали 120,81 г тіонілхлориду. Цю суміш перемішували при 100 °C протягом 3,5 годин. Реакційну суміш охолоджували до кімнатної температури і потім концентрували при зниженому тиску для одержання 274,8 г коричневої маслянистої речовини. Цю коричневу маслянисту речовину дистильовали для одержання 2,6-діетил-4-метилфенілацетилхлориду у вигляді жовтої маслянистої речовини.

Температура кипіння: від 116 до 120 °C (0,20 кПа).

¹H ЯМР (CDCl₃) δ м. ч.: 1,20 (6H, т, J=7,6 Гц), 2,31 (3H, с), 2,59 (4H, кв., J=7,6 Гц), 4,24 (2H, с), 6,91 (2H, с).

Відповідно до Довідкового прикладу 6 одержували наведену нижче сполуку.

2,4,6-Триетилфенілацетилхлорид:

¹H ЯМР (CDCl₃) δ м. ч.: 1,21 (6H, т, J=7,6 Гц), 1,23 (3H, т, J=7,6 Гц), 2,60 (4H, кв., J=7,6 Гц), 2,61 (2H, кв., J=7,6 Гц), 4,25 (2H, с), 6,94 (2H, с).

Довідковий приклад 7

Суміш 236,77 г 2,6-діетил-4-метилфенілацетонітрилу (ГХ-площа: 71 %) і 713,5 г 65 % сірчаної кислоти перемішували при 130 °C протягом 25 годин. Цю суміш охолоджували до кімнатної температури і до неї додавали 760 г толуолу і 900 г води. Суміш розділяли. Органічний шар промивали 710 мл води. Після висушування над безводним сульфатом магнію розчинник відганяли для одержання 283,58 г коричневої кристалічної речовини, що містить 2,6-діетил-4-метилфенілоцтову кислоту.

¹H ЯМР (CDCl₃) δ м. ч.: 1,19 (6H, т, J=7,6 Гц), 2,29 (3H, с), 2,61 (4H, кв., J=7,6 Гц), 3,72 (2H, с), 6,89 (2H, с), 10-11 (1H, ушир.).

Відповідно до Довідкового прикладу 7 одержували наведену нижче сполуку.

2,4,6-Триетилфенілоцтова кислота:

¹H ЯМР (CDCl₃) δ м. ч.: 1,20 (6H, т, J=7,6 Гц), 1,23 (3H, т, J=7,6 Гц), 2,60 (2H, кв., J=7,6 Гц), 2,63 (4H, кв., J=7,6 Гц), 3,73 (2H, с), 6,92 (2H, с), 10-12 (1H, ушир.).

Довідковий приклад 8

У суміші 50 г води і 99 г ацетонітрилу розчиняли 27,98 г ціаніду натрію. До цієї суміші при 75 °C більше 2,5 годин по краплях додавали розчин 157,18 г 2,6-діетил-4-метилбензилхлориду (ГХ-площа: 71 %) в ацетонітрилі (293 г). Цю суміш перемішували при 75 °C протягом 3 годин. До реакційної суміші додавали 99 г води і суміш розділяли. Органічний шар концентрували. До осаду додавали 99 г води і 198 г гексану і суміш розділяли. Органічний шар промивали 99 г водного насиченого розчину хлориду натрію, висушували над безводним сульфатом магнію і потім концентрували для одержання 123,46 г 2,6-діетил-4-метилфенілацетонітрилу (ГХ-площа: 71 %) у вигляді коричневої маслянистої речовини.

^1H ЯМР (CDCl_3) δ м. ч.: 1,26 (6H, т, $J=7,6$ Гц), 2,31 (3H, с), 2,68 (4H, кв., $J=7,6$ Гц), 3,64 (2H, с), 6,92 (2H, с).

Відповідно до Довідкового прикладу 8 одержували наведену нижче сполуку.

2,4,6-Триетилфенілацетонітрил:

5 ^1H ЯМР (CDCl_3) δ м. ч.: 1,23 (3H, т, $J=7,7$ Гц), 1,27 (6H, т, $J=7,7$ Гц), 2,61 (2H, кв., $J=7,7$ Гц), 2,70 (4H, кв., $J=7,7$ Гц), 3,65 (2H, с), 6,94 (2H, с).

Довідковий приклад 9

10 До суміші 138,41 г 2,6-діетил-4-метилбензилового спирту і 820 г толуолу при 25 °С більше 4,5 годин по краплях додавали 60,96 г тіонілхлориду. Результуючу суміш перемішували протягом 15 годин. Реакційну суміш концентрували для одержання 159,58 г 2,6-діетил-4-метилбензилхлориду (ГХ-площа: 71 %) у вигляді коричневої маслянистої речовини.

^1H ЯМР (CDCl_3) δ м. ч.: 1,26 (6H, т, $J=7,6$ Гц), 2,30 (3H, с), 2,74 (4H, кв., $J=7,6$ Гц), 4,68 (2H, с), 6,89 (2H, с).

Відповідно до Довідкового прикладу 9 одержували наведену нижче сполуку.

15 2,4,6-Триетилбензилхлорид:

^1H ЯМР (CDCl_3) δ м. ч.: 1,23 (3H, т, $J=7,6$ Гц), 1,28 (6H, т, $J=7,6$ Гц), 2,61 (2H, кв., $J=7,6$ Гц), 2,77 (4H, кв., $J=7,6$ Гц), 4,70 (2H, с), 6,93 (2H, с).

Довідковий приклад 10

20 В атмосфері азоту змішували 11,24 г магнію, 200 г тетрагідрофурану, 0,1 г йоду і 1,0 г 1,2-диброметану. Цю суміш нагрівали до 60 °С. До цієї суміші додавали невелику кількість 2,6-діетил-4-метилбромбензолу. До цієї суміші додавали 0,1 г йоду і 1,0 г 1,2-диброметану. Потім більше 2,5 годин по краплях додавали 2,6-діетил-4-метилбромбензол (загальна кількість, включаючи додану спочатку: 100,12 г). Після завершення додання результуючу суміш перемішували при 50 °С протягом 1,5 години. Цю суміш охолоджували до 30 °С. До цієї суміші більше 30 хвилин порціями за п'ять підходів додавали 14,84 г параформальдегіду. Результуючу суміш перемішували при 30 °С протягом 2 годин. До реакційної суміші додавали 143 г 10 %

25 хлористоводневої кислоти з подальшою екстракцією 300 г трет-бутилметилового ефіру. Органічний шар висушували над безводним сульфатом магнію і потім концентрували для одержання 77,56 г 2,6-діетил-4-метилбензилового спирту у вигляді жовтої кристалічної речовини.

30

^1H ЯМР (CDCl_3) δ м. ч.: 1,24 (6H, т, $J=7,6$ Гц), 1,32 (1H, с), 2,30 (3H, с), 2,74 (4H, кв., $J=7,6$ Гц), 4,70 (2H, с), 6,90 (2H, с).

Відповідно до Довідкового прикладу 10 одержували наведену нижче сполуку.

2,4,6-Триетилбензиловий спирт:

35 ^1H ЯМР (CDCl_3) δ м. ч.: 1,23 (3H, т, $J=7,7$ Гц), 1,25 (6H, т, $J=7,7$ Гц), 1,59 (1H, ушир. с), 2,60 (2H, кв., $J=7,7$ Гц), 2,77 (4H, кв., $J=7,7$ Гц), 4,73 (2H, с), 6,93 (2H, с).

Довідковий приклад 11

40 До суміші 3,00 г 1,3,5-триетилбензолу (чистота: 93 %) і 5,58 г оцтової кислоти додавали 0,82 г параформальдегіду і 4,7 мл 33 % розчину бромводню в оцтовій кислоті. Цю суміш нагрівали при 45 °С протягом 7,5 годин при перемішуванні. Потім реакційну суміш охолоджували до кімнатної температури і до неї додавали 16,8 г води і 16,8 г толуолу. Реакційну суміш розділяли. Органічний шар промивали послідовно 11,2 г води, сумішшю 5,6 г водного насиченого розчину гідрокарбонату натрію і 5,6 г води і 11,2 г води, висушували над безводним сульфатом магнію і потім концентрували для одержання 4,72 г 2,4,6-триетилбензилброміду (ГХ-площа: 84 %) у вигляді жовтої маслянистої речовини.

45

^1H ЯМР (CDCl_3) δ м. ч.: 1,23 (3H, т, $J=7,6$ Гц), 1,29 (6H, т, $J=7,6$ Гц), 2,60 (2H, кв., $J=7,6$ Гц), 2,76 (4H, кв., $J=7,6$ Гц), 4,62 (2H, с), 6,91 (2H, с).

Довідковий приклад 12

50 Суміш 81,1 г 1,3,5-триетилбензолу, 60,4 г хлорметилметилового ефіру і 6,0 г оцтової кислоти перемішували у запаяній трубці при 120 °С протягом 7 годин. Реакційну суміш виливали у 500 мл води і екстрагували гексаном. Органічний шар промивали водним розчином бікарбонату натрію, висушували над безводним сульфатом магнію і потім концентрували. Осад дистильовали при зниженому тиску для одержання 68,07 г 2,4,6-триетилбензилхлориду. Температура кипіння: від 88 до 98 °С (0,18 кПа).

55 Приклади складу будуть показані нижче.

Приклад складу 1

Змочуваний порошок

Сполука (I-1-2)

50 ваг. %

Лігносульфонат натрію

5 ваг. %

Поліоксіетилен алкільний ефір	5 ваг. %
Біла сажа	5 ваг. %
Глина	35 ваг. %

Зазначені вище інгредієнти змішують і подрібнюють для одержання змочуваного порошку.

- Таким самим способом кожну зі сполук (I- 1 - 1), від (I- 1 - 3) до (I- 1 - 8), від (I- 2 - 1) до (I- 2 - 3), (I- 3 - 1), (I- 4 - 1), (I- 5 - 1) і (I- 6 - 1) використовують замість сполуки (I- 1 - 2) для одержання змочуваного порошку кожної сполуки.

Приклад складу 2

Гранула

Сполука (I- 1 - 3)	1,5 ваг. %
Лігносульфонат натрію	2 ваг. %
Тальк	40 ваг. %
Бентоніт	56,5 ваг. %

Зазначені вище інгредієнти змішують, замішують з водою і потім гранулюють для одержання гранули.

- Таким самим способом кожну зі сполук (I- 1 - 1), (I- 1 - 2), від (I- 1 - 4) до (I- 1 - 8), від (I- 2 - 1) до (I- 2 - 3), (I- 3 - 1), (I- 4 - 1), (I- 5 - 1) і (I- 6 - 1) використовують замість сполуки (I- 1 - 3) для одержання гранули кожної сполуки.

Приклад складу 3

Рідкотекучий склад

Сполука (I- 1 - 4)	10 ваг. %
Біла сажа, що містить 50 ваг. % поліоксіетилен алкільного ефіру	35 ваг. %
солі сульфату амонію	
Вода	55 ваг. %

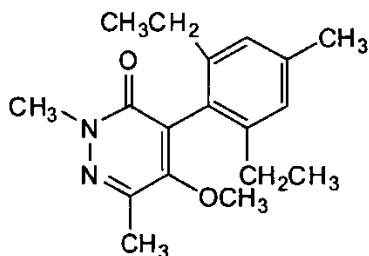
- Зазначені вище інгредієнти змішують і дрібно подрібнюють за допомогою способу мокрого шліфування для одержання рідкотекучого складу.

Таким самим способом кожну зі сполук від (I- 1 - 1) до (I- 1 - 3), від (I- 1 - 5) до (I- 1 - 8), від (I- 2 - 1) до (I- 2 - 3), (I- 3 - 1), (I- 4 - 1), (I- 5 - 1) і (I- 6 - 1) використовують замість сполуки (I- 1 - 4) для одержання рідкотекучого складу кожної сполуки.

- Приклад дослідження 1 - 1

- Пластмасову чашку з діаметром 8 см і глибиною 6,5 см заповнювали ґрунтом. У чашку сіяли насіння *Lolium multiflorum* і потім рослину вирощували до стадії від першого до другого листа. Потім визначену кількість досліджуваного розчину, що містить сполуку даного винаходу, однорідно розпилювали на всю рослину. Досліджуваний розчин одержували при розчиненні визначеної раніше кількості сполуки даного винаходу у 2 % розчині Твін 20 (поліоксіетиленовий ефір сорбіту і жирної кислоти, MP Biomedicals, Inc.) у диметилформаміді і потім розбавленні розчину водою. Після обробки за допомогою розпилення рослину вирощували у парнику. Після 20 днів контрольний ефект сполуки на *Lolium multiflorum* оцінювали візуально. Ефект класифікували на 11 рівнів від 0 до 10 (0 являє собою "відсутність ефекту"; 10 являє собою "повне знищення"; і стан рослини класифікували між ними від 1 до 9).

Сполуку D, показану нижче, досліджували подібним чином як порівняльний приклад.



Порівняльний Приклад (Сполука D)

- У результаті сполуки (I- 1 - 1), (I- 1 - 2), (I- 1 - 3), (I- 1 - 4), (I- 2 - 1) і (I- 6 - 1) показали ефект 8 або більше при кількості обробки 250 г/га. Навпаки, Сполука D показала ефект 0 при кількості обробки 250 г/га.

Приклад дослідження 1 - 2

Пластмасову чашку з діаметром 8 см і глибиною 6,5 см заповнювали ґрунтом. У чашку сіяли насіння *Echinochloa crus-galli* і потім рослину вирощували до стадії від другого до третього

листа. Потім визначену кількість досліджуваного розчину, що містить сполуку даного винаходу, однорідно розпилювали на всю рослину. Досліджуваний розчин одержували при розчиненні визначеної раніше кількості сполуки даного винаходу у 2 % розчині Твін 20 (поліоксіетиленовий ефір сорбіту і жирної кислоти, MP Biomedicals, Inc.) у диметилформаміді і потім розбавленні розчину водою. Після обробки за допомогою розпилення рослину вирощували у парнику. Після 20 днів контрольний ефект сполуки на *Echinochloa crus-galli* оцінювали візуально. Ефект класифікували на 11 рівнів від 0 до 10 (0 являє собою "відсутність ефекту"; 10 являє собою "повне знищення"; і стан рослини класифікували між ними від 1 до 9).

Сполуку D досліджували подібним чином як порівняльний приклад.

У результаті сполуки (I- 1 - 1), (I- 1 - 2), (I- 1 - 3), (I- 1 - 4), (I- 1 - 5), (I- 1 - 6), (I- 1 - 8), (I- 2 - 1), (I- 2 - 2), (I- 2 - 3), (I- 3 - 1), (I- 5 - 1) і (I- 6 - 1) показали ефект 8 або більше при кількості обробки 1000 г/га. Навпаки, Сполука D показала ефект 0 при кількості обробки 1000 г/га.

Приклад дослідження 1 - 3

Пластмасову чашку з діаметром 8 см і глибиною 6,5 см заповнювали ґрунтом. У чашку сіяли насіння *Galium aparine* і потім рослину вирощували до стадії від другого до третього листа. Потім визначену кількість досліджуваного розчину, що містить сполуку даного винаходу, однорідно розпилювали на всю рослину. Досліджуваний розчин одержували при розчиненні визначеної раніше кількості сполуки даного винаходу у 2 % розчині Твін 20 (поліоксіетиленовий ефір сорбіту і жирної кислоти, MP Biomedicals, Inc.) у диметилформаміді і потім розбавленні розчину водою. Після обробки за допомогою розпилення рослину вирощували у парнику. Після 20 днів контрольний ефект сполуки на *Galium aparine* оцінювали візуально. Ефект класифікували на 11 рівнів від 0 до 10 (0 являє собою "відсутність ефекту"; 10 являє собою "повне знищення"; і стан рослини класифікували між ними від 1 до 9).

Сполуку D досліджували подібним чином як порівняльний приклад.

У результаті сполуки (I- 1 - 1), (I- 1 - 2), (I- 1 - 3), (I- 1 - 4), (I- 1 - 5), (I- 2 - 1), (I- 2 - 2), (I- 3 - 1), (I- 5 - 1) і (I- 6 - 1) показали ефект 8 або більше при кількості обробки 250 г/га. Навпаки, Сполука D показала ефект 0 при кількості обробки 250 г/га.

Приклад дослідження 2 - 1

Склад сполуки даного винаходу, одержаний у Прикладі складу 3, розбавляли водою так, що концентрація активного інгредієнта становила 500 частин/мільйон для одержання досліджуваного розчину.

Штучне поживне середовище, Silkmate 2S (Nihon Nosan Kogyo Corp.) нарізали у 2 мм товщиною і потім вміщували на дно поліетиленової чашки. Потім 1 мл досліджуваного розчину виливали у поліетиленову чашку. Після висушування на повітрі 30 личинок першої вікової стадії *Adoxophyes orana* вивільняли у поліетиленову чашку і чашку запечатували кришкою. Після цього поліетиленову чашку зберігали при 25 °C протягом 7 днів, підраховували число комах, які вижили. Показник смертності обчислювали за допомогою наведеного нижче рівняння і ефект досліджуваної сполуки оцінювали за допомогою зазначених нижче інсектицидних показників.

Показник смертності (%) = $\{1 - (\text{Число комах, які вижили} / \text{Число досліджуваних комах})\} \times 100$

Інсектицидні показники 4: показник смертності 100 %, 3: показник смертності 80 - 99 %, 2: показник смертності 60 - 79 %, 1: показник смертності 30 - 59 %, 0: показник смертності 0 - 29 %

У результаті сполуку (I- 1 - 6) оцінювали як показник 4.

Приклад дослідження 2 - 2

Склад сполуки даного винаходу, одержаний у Прикладі складу 3, розбавляли водою так, що концентрація активного інгредієнта становила 500 частин/мільйон для одержання досліджуваного розчину.

Штучне поживне середовище, Insecta LF (Nihon Nosan Kogyo Corp.) нарізали у 2 мм товщиною і потім вміщували на дно поліетиленової чашки. Потім 1 мл досліджуваного розчину виливали у поліетиленову чашку. Після висушування на повітрі 5 личинок четвертої вікової стадії *Spodoptera litura* вивільняли у поліетиленову чашку і чашку запечатували кришкою. Після цього поліетиленову чашку зберігали при 25 °C протягом 6 днів, підраховували число комах, які вижили. Показник смертності обчислювали за допомогою наведеного нижче рівняння і ефект досліджуваної сполуки оцінювали за допомогою зазначених нижче інсектицидних показників.

Показник смертності (%) = $\{1 - (\text{Число комах, які вижили} / \text{Число досліджуваних комах})\} \times 100$

Інсектицидні показники 4: показник смертності 100 %, 3: показник смертності 80 - 99 %, 2: показник смертності 60 - 79 %, 1: показник смертності 30 - 59 %, 0: показник смертності 0 - 29 %

У результаті сполуку (I- 1 - 6) оцінювали як показник 3.

Приклад дослідження 2 - 3

Склад сполуки даного винаходу, одержаний у Довідковому прикладі 3, розбавляли водою так, що концентрація активного інгредієнта становила 500 частин/мільйон для одержання досліджуваного розчину.

0,7 мл досліджуваного розчину розбавляли іонообмінною водою так, що концентрація активного інгредієнта становила 3,5 частини/мільйон. У розбавлений розчин вивільняли 20 личинок останньої вікової стадії *Culex pipiens pallens*. Після 8 днів підраховували число мертвих комах.

Показник смертності обчислювали за допомогою наведеного нижче рівняння і ефект досліджуваної сполуки оцінювали за допомогою зазначених нижче інсектицидних показників 4: показник смертності 91 - 100 %, 2: показник смертності 11 - 90 % і 0: показник смертності 0 - 10 %.

Показник смертності (%) = $(\text{Число мертвих комах} / \text{Число досліджуваних комах}) \times 100$

У результаті сполуку (I- 1 - 6) оцінювали як показник 4.

Приклад дослідження 2 - 4

Склад сполуки даного винаходу, одержаний у Довідковому прикладі 3, розбавляли водою так, що концентрація активного інгредієнта становила 500 частин/мільйон для одержання досліджуваного розчину.

На капусту (*Brassicae oleacea*) на стадії третього листа, вміщену у поліетиленову чашку, розпилювали 20 мл/чашку досліджуваного розчину. Після цього досліджуваний розчин висушували, надземну частину капусти відрізали і потім вміщували у чашку (об'єм: 50 мл). У чашку вивільняли 5 личинок другої вікової стадії *Plutella xylostella* і чашку запечатували кришкою. Після цього чашку зберігали при 25 °C протягом 5 днів, підраховували число мертвих комах. Показник смертності обчислювали за допомогою наведеного нижче рівняння.

Показник смертності (%) = $(\text{Число мертвих комах} / \text{Число досліджуваних комах}) \times 100$

У результаті кожна зі сполук (I- 1 - 6) і (I- 2 - 3) мала показник смертності 80 % або більше.

Приклад дослідження 2 - 5

Склад сполуки даного винаходу, одержаний у Довідковому прикладі 3, розбавляли водою так, що концентрація активного інгредієнта становила 500 частин/мільйон для одержання досліджуваного розчину.

На розсаду рису на стадії другого листа, вміщену у поліетиленову чашку, розпилювали 10 мл досліджуваного розчину. Після цього досліджуваний розчин висушували, на рослину вивільняли 30 личинок першої вікової стадії *Nilaparvata lugens*. Рослину зберігали при 25 °C протягом 6 днів. Потім підраховували число комах, які паразитують на рослині, і контрольне значення визначали за допомогою наведеного нижче рівняння.

Контрольне значення (%) = $\{1 - (C_b \times T_{ai}) / (C_{ai} \times T_b)\} \times 100$,

в якому:

C_b : число комах у необробленій секції перед обробкою,

C_{ai} : число комах у необробленій секції при спостереженні,

T_b : число комах в обробленій секції перед обробкою,

40 T_{ai} : число комах в обробленій секції при спостереженні.

У результаті кожна зі сполук (I- 1 - 6) і (I- 2 - 3) показала контрольне значення 90 % або більше.

Приклад дослідження 2 - 6

Склад сполуки даного винаходу, одержаний у Довідковому прикладі 3, розбавляли водою так, що концентрація активного інгредієнта становила 500 частин/мільйон для одержання досліджуваного розчину.

На розсаду огірків на стадії другого справжнього листа, вміщену у поліетиленову чашку, вивільняли приблизно 30 імаго *Aphis gossypii*. Через один день після вивільнення попелиць на рослину розпилювали 10 мл досліджуваного розчину. Через п'ять днів після обробки за допомогою розпилення підраховували число комах, які паразитують на листі рослини, і контрольне значення визначали за допомогою наведеного нижче рівняння.

Контрольне значення (%) = $\{1 - (C_b \times T_{ai}) / (C_{ai} \times T_b)\} \times 100$,

в якому:

C_b : число комах у необробленій секції перед обробкою,

55 C_{ai} : число комах у необробленій секції при спостереженні,

T_b : число комах в обробленій секції перед обробкою,

T_{ai} : число комах в обробленій секції при спостереженні.

У результаті сполука (I- 1 - 6) показала контрольне значення 90 % або більше.

Приклад дослідження 2 - 7

Склад сполуки даного винаходу, одержаний у Довідковому прикладі 4, розбавляли водою так, що концентрація активного інгредієнта ставала 500 частин/мільйон для одержання досліджуваного розчину.

На розсаду томатів на стадії третього справжнього листа, вміщену у поліетиленову чашку, вивільняли імаго *Bemisia tabaci* і дозволяли відкладати яйця протягом приблизно 24 годин. Рослину вміщували у парник на 8 днів. Коли личинки *Bemisia tabaci* виводилися з яєць, розпилювали 10 мл/чашку досліджуваного розчину. Після цього рослину зберігали при 25 °C протягом 7 днів, підраховували число личинок, які вижили на томатному листі, і контрольне значення визначали за допомогою наведеного нижче рівняння.

$$\text{Контрольне значення (\%)} = \{1 - (C_b \times T_{ai}) / (C_{ai} \times T_b)\} \times 100,$$

в якому:

C_b : число комах у необробленій секції перед обробкою,

C_{ai} : число комах у необробленій секції при спостереженні,

T_b : число комах в обробленій секції перед обробкою,

T_{ai} : число комах в обробленій секції при спостереженні.

У результаті сполука (I- 1 - 6) показала контрольне значення 90 % або більше.

Приклад дослідження 2 - 8

Склад сполуки даного винаходу, одержаний у Довідковому прикладі 3, розбавляли водою так, що концентрація активного інгредієнта ставала 500 частин/мільйон для одержання досліджуваного розчину.

На розсаду огірків на стадії другого справжнього листа, вміщену у поліетиленову чашку, розпилювали 10 мл/чашку досліджуваного розчину. Після цього досліджуваний розчин висушували, перший справжній лист відрізали і потім вміщували у поліетиленову чашку. У поліетиленову чашку вивільняли 20 личинок *Frankliniella occidentalis* і чашку запечатували кришкою. Після цього чашку зберігали при 25 °C протягом 7 днів, підраховували число комах, які вижили на листі огірків, і контрольне значення визначали за допомогою наведеного нижче рівняння.

$$\text{Контрольне значення (\%)} = \{1 - (C_b \times T_{ai}) / (C_{ai} \times T_b)\} \times 100,$$

в якому:

C_b : число комах у необробленій секції перед обробкою,

C_{ai} : число комах у необробленій секції при спостереженні,

T_b : число комах в обробленій секції перед обробкою,

T_{ai} : число комах в обробленій секції при спостереженні.

У результаті сполука (I- 1 - 6) показала контрольне значення 90 % або більше.

Приклад дослідження 2 - 9

Склад сполуки даного винаходу, одержаний у Довідковому прикладі 3, розбавляли водою так, що концентрація активного інгредієнта ставала 500 частин/мільйон для одержання досліджуваного розчину.

Розсаду огірків, вирощену до стадії першого справжнього листа, видаляли з ґрунту і потім ґрунт промивали від розсади. Кореневу частину розсади огірків занурювали у 5 мл досліджуваного розчину. Через один день після обробки 30 імаго *Aphis gossypii* залишали на поверхні листя огірків. Після 7 днів підраховували число комах, які вижили на листі огірків, і контрольне значення визначали за допомогою наведеного нижче рівняння.

$$\text{Контрольне значення (\%)} = \{1 - (C_b \times T_{ai}) / (C_{ai} \times T_b)\} \times 100,$$

в якому:

C_b : число комах у необробленій секції перед обробкою,

C_{ai} : число комах у необробленій секції при спостереженні,

T_b : число комах в обробленій секції перед обробкою,

T_{ai} : число комах в обробленій секції при спостереженні.

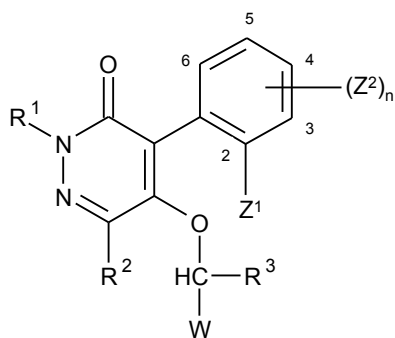
У результаті кожна зі сполук (I- 2 - 1) і (I- 1 - 6) показала контрольне значення 90 % або більше.

Промислова застосовність

Сполука даного винаходу має ефект контролювання бур'янів і ефект контролювання артроподів.

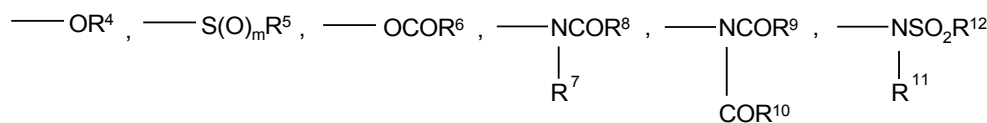
ФОРМУЛА ВИНАХОДУ

1. Сполука піридазинону, представлена формулою (I):



(I)

в якій R^1 являє собою C_{1-6} алкільну групу або $(C_{1-6}$ алкілокси) C_{1-6} алкільну групу,
 R^2 і R^3 є однаковими або різними і являють собою водень або C_{1-6} алкільну групу,
 W являє собою галоген або будь-яку одну з груп, представлених наведеними нижче
 5 формулами:



- в яких R^4 , R^5 , R^7 і R^{11} кожний являє собою C_{1-6} алкільну групу, C_{3-8} циклоалкільну групу,
 10 C_{3-6} алкенільну групу, C_{3-6} алкінільну групу, C_{6-10} арильну групу або $(C_{6-10}$ арил) C_{1-6} алкільну групу,
 R^{12} являє собою C_{1-6} алкільну групу, C_{3-8} циклоалкільну групу, C_{3-6} алкенільну групу, C_{3-6} алкінільну
 групу, C_{6-10} арильну групу або $(C_{6-10}$ арил) C_{1-6} алкільну групу,
 R^6 , R^8 і R^9 кожний являє собою C_{1-6} алкільну групу, C_{3-8} циклоалкільну групу, C_{2-6} алкенільну групу,
 15 C_{2-6} алкінільну групу, C_{6-10} арильну групу, $(C_{6-10}$ арил) C_{1-6} алкільну групу, C_{1-6} алкілоксигрупу,
 C_{3-8} циклоалкілоксигрупу, C_{3-6} алкенілоксигрупу, C_{3-6} алкінілоксигрупу, C_{6-10} арилоксигрупу або
 $(C_{6-10}$ арил) C_{1-6} алкілоксигрупу,
 R^{10} являє собою C_{1-6} алкільну групу, C_{3-8} циклоалкільну групу, C_{2-6} алкенільну групу, C_{2-6} алкінільну
 групу, C_{6-10} арильну групу, $(C_{6-10}$ арил) C_{1-6} алкільну групу, C_{1-6} алкілоксигрупу,
 20 C_{3-8} циклоалкілоксигрупу, C_{3-6} алкенілоксигрупу, C_{3-6} алкінілоксигрупу, C_{6-10} арилоксигрупу або
 $(C_{6-10}$ арил) C_{1-6} алкілоксигрупу,
 або R^9 і R^{10} можуть являти собою разом з карбонільними групами, до яких вони приєднані, і
 атомом азоту, до якого приєднані карбонільні групи, 5- або 6-членну циклічну імідну групу, з
 якою може бути конденсоване бензольне кільце,
 в яких будь-яка група, представлена R^4 , R^5 , R^6 , R^7 , R^8 , R^9 , R^{10} , R^{11} або R^{12} , може бути заміщена
 25 щонайменше одним членом, вибраним з групи, що складається з галогену і C_{1-6} алкілоксигруп,
 C_{3-8} циклоалкільні групи, C_{6-10} арильні групи і арильні частини $(C_{6-10}$ арил) C_{1-6} алкільних груп, які
 представлені R^4 , R^5 , R^6 , R^7 , R^8 , R^9 , R^{10} , R^{11} або R^{12} , можуть бути заміщені щонайменше однією
 C_{1-6} алкільною групою,
 C_{3-8} циклоалкілоксигрупи, C_{6-10} арилоксигрупи і арильні частини $(C_{6-10}$ арил) C_{1-6} алкілоксигруп, які
 30 представлені R^6 , R^8 , R^9 або R^{10} , можуть бути заміщені щонайменше однією C_{1-6} алкільною
 групою,
 m являє собою 0, 1 або 2,
 Z^1 являє собою C_{1-6} алкільну групу,
 Z^2 являє собою C_{1-6} алкільну групу, C_{3-8} циклоалкільну групу, C_{2-6} алкінільну групу,
 35 C_{1-6} галогеноалкільну групу, C_{6-10} арильну групу, 5- або 6-членну гетероарильну групу,
 C_{1-6} алкілоксигрупу, C_{1-6} галогеноалкілоксигрупу, галоген, ціаногрупу або нітрогрупу,
 в яких C_{3-8} циклоалкільна група, C_{6-10} арильна група і 5- або 6-членна гетероарильна група,
 представлена Z^2 , можуть бути заміщені щонайменше одним членом, вибраним з групи, що
 складається з галогену і C_{1-6} алкільних груп,
 40 n являє собою 0, 1, 2, 3 або 4, і, коли n являє собою 2, 3 або 4, кожний Z^2 являє собою те саме
 або відмінне.
 2. Сполука піридазину за п. 1, в якій n являє собою 1, 2 або 3.
 3. Сполука піридазину за п. 1, в якій n являє собою 0; Z^1 являє собою C_{2-6} алкільну групу.
 4. Сполука піридазину за п. 1, в якій n являє собою 1 або 2; Z^2 приєднаний до 4- і/або 6-
 45 положення бензольного кільця.
 5. Сполука піридазину за п. 1, в якій Z^1 являє собою C_{1-3} алкільну групу, Z^2 являє собою
 C_{1-3} алкільну групу, C_{3-6} циклоалкільну групу, C_{2-3} алкінільну групу, C_{1-3} алкілоксигрупу, галоген,

ціаногрупу, нітрогрупу або фенільну групу, яка може бути заміщена щонайменше одним членом, вибраним з групи, що складається з галогену і C_{1-3} алкільних груп.

6. Сполука піридазину за п. 1, в якій Z^1 являє собою C_{1-3} алкільну групу; Z^2 являє собою C_{1-3} алкільну групу.
- 5 7. Сполука піридазину за п. 1, в якій R^1 являє собою C_{1-3} алкільну групу або $(C_{1-3}$ алкілокси) C_{1-3} алкільну групу.
8. Сполука піридазину за п. 1, в якій R^1 являє собою метильну групу.
9. Сполука піридазину за п. 1, в якій R^2 являє собою водень або C_{1-3} алкільну групу.
- 10 10. Сполука піридазину за п. 1, в якій R^2 являє собою водень або метильну групу.
11. Сполука піридазину за п. 1, в якій R^3 являє собою водень.
12. Сполука піридазину за п. 1, в якій W являє собою галоген, C_{1-3} алкілоксигрупу, $(C_{6-10}$ арил) C_{1-3} алкілоксигрупу, C_{1-3} алкілтіогрупу, C_{1-3} алкілсульфінільну групу, C_{1-3} алкілсульфонільну групу або $N-(C_{6-10}$ арил)- $N-(C_{1-3}$ алкілоксикарбоніл)аміногрупу.
13. Сполука піридазину за п. 1, в якій W являє собою C_{1-3} алкілоксигрупу або C_{1-3} алкілтіогрупу.
- 15 14. Гербіцидна композиція, що містить сполуку піридазину за п. 1 та інертний носій.
15. Спосіб контролювання бур'янів, за яким застосовують ефективну кількість сполуки піридазину за п. 1 до бур'янів або ґрунту, в якому бур'яни ростуть.
16. Застосування сполуки піридазину за п. 1 для контролювання бур'янів.
17. Спосіб контролювання артроподів, за яким застосовують ефективну кількість сполуки піридазину за п. 1 до артроподів або середовищ проживання артроподів.
- 20 18. Застосування сполуки піридазину за п. 1 для контролювання артроподів.

Комп'ютерна верстка А. Крижанівський

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

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