



УКРАЇНА

(19) UA (11) 89672 (13) C2

(51) МПК (2009)

C07D 239/46 (2007.01)

C07D 239/42 (2007.01)

C07D 239/52 (2007.01)

C07D 251/42 (2007.01)

C07D 251/46 (2007.01)

C07D 401/12 (2007.01)

C07D 409/12 (2007.01)

A01N 43/54 (2007.01)

A01N 43/66 (2007.01)

A01N 43/68 (2007.01)

A01N 43/70 (2007.01)

A01P 13/00

МІНІСТЕРСТВО ОСВІТИ
І НАУКИ УКРАЇНИДЕРЖАВНИЙ ДЕПАРТАМЕНТ
ІНТЕЛЕКТУАЛЬНОЇ
ВЛАСНОСТІОПИС
ДО ПАТЕНТУ НА ВИНАХІД

(54) ФЕНІЛСУЛЬФОНІЛКАРБАМІДИ

1

(21) а200713279

(22) 19.04.2006

(24) 25.02.2010

(86) РСТ/ЕР2006/003564, 19.04.2006

(31) 05009272.5

(32) 28.04.2005

(33) ЕР

(46) 25.02.2010, Бюл.№ 4, 2010 р.

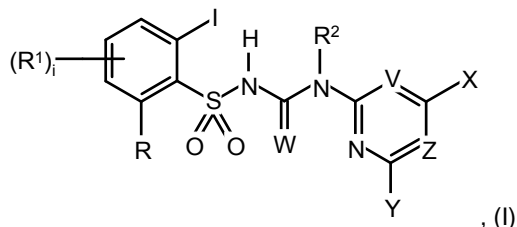
(72) ВАЛЬДРАФФ КРИСТІАН, DE, ДІТРИХ ХАНС-
ЙОРГ, DE, ОРТ ОСВАЛЬД, DE, КЕНЕ ХАЙНЦ, DE,
ХІЛЛЬС МАРТИН, DE, АУЛЕР ТОМАС, DE, МЮЛ-
ЛЕР КЛАУС-ХЕЛЬМУТ, DE, ФОЙХТ ДІТЕР, DE

(73) БАЕР КРОПСАЄНС АГ, DE

(56) ЕР 0084020, А, 20.07.1983

WO 9213845, А, 20.08.1992

WO 9406778, А, 31.03.1994

(57) 1. Фенілсульфонілкарбамід формули (I)
та/або його солі

в якій

R означає (C₁-C₆)алкіл, (C₂-C₆)алкеніл, (C₂-
C₆)алкініл, (C₃-C₆)циклоалкіл, (C₃-C₆)циклоалкеніл,
(C₃-C₆)циклоалкініл, (C₁-C₆)алкілокси, (C₂-
C₆)алкенілокси, (C₂-C₆)алкінілокси, (C₃-
C₆)циклоалкілокси, феніл, фенілокси, F, Br, I, OH,

2

CN, NO₂, NH₂, SF₅, Si((C₁-C₆)алкіл)₃, N((C₁-
C₆)алкіл)₂, NH(C₁-C₆)алкіл, N((C₂-C₆)алкеніл)₂,
NH(C₂-C₆)алкеніл, N((C₂-C₆)алкініл)₂, NH(C₂-
C₆)алкініл, N((C₃-C₆)циклоалкіл)₂, NH(C₃-
C₆)циклоалкіл, N(C₁-C₆)алкіл(C₃-C₆)циклоалкіл,
N(C₁-C₆)алкілC(O)R³, NHC(O)R³, N(C₁-
C₆)алкілS(O)_nR³, NHS(O)_nR³, S(O)_n(C₁-C₄)алкіл,
S(O)_n(C₃-C₆)циклоалкіл, S(O)_n(C₁-C₆)алкеніл,
S(O)_n(C₁-C₆)алкініл, S(O)_nNHR³, S(O)_nN(C₁-C₆)алкіл
R³, OSO₂(C₁-C₆)алкіл, OSO₂(C₃-C₆)циклоалкіл,
OSO₂(C₁-C₆)алкеніл, OSO₂(C₁-C₆)алкініл,
OS(O)_nфеніл, OSO₂N((C₁-C₆)алкіл)₂, OSO₂NH(C₁-
C₆)алкіл, OSO₂N((C₃-C₆)циклоалкіл)₂, OSO₂NH(C₃-
C₆)циклоалкіл, OSO₂N((C₂-C₆)алкеніл)₂,
OSO₂NH(C₂-C₆)алкеніл, OSO₂N((C₂-C₆)алкініл)₂,
OSO₂NH(C₂-C₆)алкініл, OC(O)R³ або гетероциклі,
причому зазначені залишки алкіл, алкеніл, алкініл,
циклоалкіл, циклоалкеніл, циклоалкініл, алкілокси,
алкенілокси, алкінілокси, циклоалкокси, феніл,
фенілокси, гетероциклі є незаміщеними або за-
міщеними 1, 2 або 3 залишками з групи, що вклю-
чає галоген, алкокси, галоалкокси, алкілтіо, гідрок-
си, аміно, нітро, карбокси, ціано, азидо,
алкоксикарбоніл, алкілкарбоніл, форміл, карбамо-
іл, моно- та діалкіламінокарбоніл, заміщений амі-
но, як-от: ациламіно, моно- та діалкіламіно, та ал-
кілсульфініл, галоалкілсульфініл, алкілсульфоніл,
галоалкілсульфоніл та, у випадку циклічних ради-
калів, також включає алкіл, галоалкіл та ненасиче-
ні аліфатичні вуглеводневі залишки, що відпові-
дають вказаним насиченим вуглеводневим
залишкам,
R¹ означає (C₁-C₆)алкіл, (C₁-C₆)галоалкіл, (C₁-
C₆)алкілокси, (C₁-C₆)галоалкокси або галогени,

(13) C2

(11) 89672

(19) UA

I означає 0, 1 або 2,
 n означає 0, 1 або 2,
 R^2 означає H або CH_3 ,
 R^3 означає H, (C_1-C_6) алкіл, (C_2-C_6) алкеніл, (C_2-C_6) алкініл, (C_3-C_6) циклоалкіл, (C_1-C_6) алкілокси, (C_2-C_6) алкенілокси, (C_2-C_6) алкінілокси, (C_3-C_6) циклоалкілокси, феніл, гетероцикліл, CN, $NH(C_1-C_6)$ алкіл, $N((C_1-C_6)алкіл)_2$, причому зазначені залишки алкіл, алкеніл, алкініл, циклоалкіл, алкілокси, алкенілокси, алкінілокси, циклоалкілокси, феніл, гетероцикліл є незаміщеними або заміщеними,
 W означає атом кисню,
 X, Y незалежно один від одного означає (C_1-C_4) алкіл, (C_1-C_4) алкілокси, причому два останні залишки є незаміщеними або заміщеними одним або більше атомами галогенів, або (C_1-C_4) алкілтіо, галоген, $NH(C_1-C_4)$ алкіл або $N((C_1-C_4)алкіл)_2$, та
 V, Z незалежно один від одного означають CH або N.
 2. Фенілсульфонілкарбамід формули (I) та/або його солі за п. 1,
 в якій
 R означає (C_1-C_4) алкіл, (C_2-C_4) алкеніл, (C_2-C_4) алкініл, (C_3-C_6) циклоалкіл, (C_1-C_4) алкілокси, (C_2-C_4) алкенілокси, (C_2-C_4) алкінілокси, (C_3-C_6) циклоалкілокси, феніл, фенілокси, F, Br, I, CN, NO_2 , NH_2 , $N((C_1-C_4)алкіл)_2$, $NH(C_1-C_4)алкіл$, $NH(C_2-C_4)алкеніл$, $NH(C_2-C_4)алкініл$, $NH(C_3-C_6)циклоалкіл$, $N((C_1-C_4)алкіл)_2(C_3-C_6)циклоалкіл$, $S(C_1-C_4)алкіл$, $S(C_2-C_4)алкеніл$, $S(C_2-C_4)алкініл$, $S(C_3-C_6)циклоалкіл$, $S(O)(C_1-C_4)алкіл$, $S(O)(C_1-C_4)алкеніл$, $S(O)(C_2-C_4)алкініл$, $S(O)(C_3-C_6)циклоалкіл$, $SO_2(C_1-C_4)алкіл$, $SO_2(C_2-C_4)алкеніл$, $SO_2(C_3-C_6)циклоалкіл$, $SO_2NH(C_1-C_4)алкіл$, $SO_2N((C_1-C_4)алкіл)_2$, $SO_2NH(C_3-C_6)циклоалкіл$, $OSO(C_1-C_4)алкіл$, $OSO_2NH(C_1-C_4)алкіл$, $OSO_2N((C_1-C_4)алкіл)_2$ або $NHC(O)R^3$, $NHSO_2R^3$, $OC(O)R^3$, в якій R^3 означає H, (C_1-C_4) алкіл, (C_2-C_4) алкеніл, (C_2-C_4) алкініл, $(C_3-C_6)циклоалкіл$, (C_1-C_4) алкілокси, (C_2-C_4) алкенілокси, (C_2-C_4) алкінілокси, $(C_3-C_6)циклоалкілокси$, (C_1-C_4) галоалкіл, $NH(C_1-C_4)алкіл$ або $N((C_1-C_4)алкіл)_2$, причому зазначені залишки алкіл, алкеніл, алкініл, циклоалкіл, алкілокси, алкенілокси, алкінілокси, циклоалкілокси, феніл, фенілокси є незаміщеними або заміщеними 1, 2 або 3 залишками з групи, що включає галоген, алкокси, галоалкокси, алкілтіо, гідрокси, аміно, нітро, карбокси, ціано, азидо, алкоксикарбоніл, алкілкарбоніл, форміл, карбамоїл, моно- та діалкі-

ламінокарбоніл, заміщений аміно, як-от: ациламіно, моно- та діалкіламіно, та алкілсульфініл, галоалкілсульфініл, алкілсульфоніл, галоалкілсульфоніл та, у випадку циклічних радикалів, також включає алкіл, галоалкіл та ненасичені аліфатичні вуглеводневі залишки, що відповідають вказаним насиченим вуглеводневим залишкам,
 R^1 означає галоген, (C_1-C_4) алкіл, (C_1-C_4) алкілокси, (C_1-C_4) галоалкіл, (C_1-C_4) галоалкілокси,
 I означає 0 або 1, переважно 0,
 R^2 означає H або (C_1-C_4) алкіл, такий як метил,
 W означає атом кисню,
 X, Y незалежно один від одного означають (C_1-C_4) алкіл, (C_1-C_4) галоалкіл, (C_1-C_4) алкілокси, (C_1-C_4) галоалкілокси, галоген, (C_1-C_4) алкілтіо, $NH(C_1-C_4)алкіл$, $N((C_1-C_4)алкіл)_2$,
 V означає атом азоту, та
 Z означає CH або N.

3. Фенілсульфонілкарбамід формули (I) та/або його солі за п. 1 або 2,

в якій

R означає CH_3 , CH_2CH_3 , $(CH_2)_2CH_3$, $CH(CH_3)_2$, $C(CH_3)_3$, $CH \equiv CH_2$, $C \equiv CH$, $CH_2CH \equiv CH_2$, $CH_2C \equiv CH$, циклопропіл, феніл, F, Br, I, CN, NO_2 , NH_2 , CH_2OCH_3 , CF_3 , CHF_2 , $NHCH_3$, $N(CH_3)_2$, NH -циклопропіл, $N(CH_3)$ -циклопропіл, $NHC(O)H$, $NHC(O)CH_3$, $NHC(O)OCH_3$, $NHSO_2CH_3$, $NHSO_2CF_3$, $NHSO_2CHF_2$, OCH_3 , OCH_2CH_3 , $O(CH_2)_2CH_3$, $OCH(CH_3)_2$, $O(CH_2)_3CH_3$, $OCH_2CH(CH_3)_2$, $OCH(CH_3)CH_2CH_3$, $OC(CH_3)_3$, $OCH \equiv CH_2$, $OC \equiv CH$, $OCH_2CH=CH_2$, $OCH_2C \equiv CH$, O-циклопропіл, OCH_2 -циклопропіл, $O(CH_2)_2Cl$, $O(CH_2)_3Cl$, OCH_2OCH_3 , O-феніл, OCH_2 -феніл, OCF_3 , $OCHF_2$, OCH_2F , OCH_2CF_3 , OCH_2CHF_2 , $OCH(CH_3)CF_3$, $OCH_2CF_2CF_3$, SCH_3 , SCH_2CH_3 , $S(O)CH_3$, $S(O)CH_2CH_3$, SO_2CH_3 , $SO_2CH_2CH_3$, SO_2NHCH_3 , $SO_2N(CH_3)_2$, SO_2NHCF_3 , SO_2NHCHF_2 , OSO_2CH_3 , OSO_2CF_3 , OSO_2CHF_2 , $OSO_2N(CH_3)_2$, OSO_2NHCF_3 , OSO_2NHCHF_2 , $OC(O)H$, $OC(O)CH_3$, $OC(O)OCH_3$, $OC(O)N(CH_3)_2$,

I означає 0,

R^2 означає H,

W означає кисень,

X, Y незалежно один від одного означають CH_3 , CH_2CH_3 , CF_3 , CHF_2 , CH_2CF_3 , CH_2CHF_2 , OCH_3 , OCH_2CH_3 , OCF_3 , $OCHF_2$, OCH_2CF_3 , OCH_2CHF_2 , F, Cl, Br, I, SCH_3 , $NHCH_3$, $N(CH_3)_2$, переважно CH_3 , OCH_3 , OCH_2CH_3 , Cl, $N(CH_3)_2$,

V означає N, та

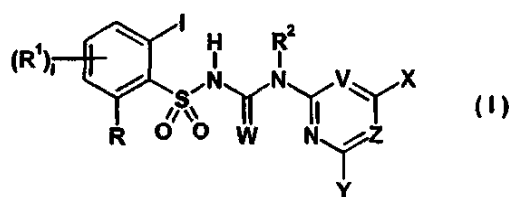
Z означає CH або N.

Відомо, що заміщені фенілсульфонілкарбамиди можуть виявляти гербіцидні властивості. Причому, мова йде, наприклад, про похідні фенілу, однократно чи багаторазово заміщені (наприклад, US 4127405, WO 9209608, BE 853374, WO 9213845, EP 84020, WO 9406778, WO 02072560, US 4169719).

Таким чином, фенілсульфонілкарбамиди із загальним зразком заміщення 1,2,3 виявляють гербіцидні властивості (наприклад, WO 9732861, WO 02062768).

Нещодавно несподівано було виявлено спеціальні йод-заміщені фенілсульфонілкарбамиди, які, зокрема, дуже придатні до застосування як гербіциди або регулятори росту рослин.

Таким чином, предметом даного винаходу є сполуки із загальною формулою (I) та/або їхні солі,



де

R означає вуглеводневий залишок або вуглеводневий залишок, представлений переважно залишком з групи, яку складають алкіл, алкеніл, алкініл, циклоалкіл, циклоалкеніл, циклоалкініл, алкокси, алкенілокси, алкінілокси, циклоалкілокси, циклоалкенілокси, арил або арилокси, незаміщені або заміщені, включаючи замісники, що містять від 1 до 30 атомів вуглецю, переважно 1 до 20 атомів вуглецю, або заміщений чи незаміщений R гетероциклічний залишок або гетероциклілоксильний залишок,

або R означає залишок $OC(O)R^3$, $S(O)_nR^3$, $OS(O)_nR^3$, F, Br, I, OH, CN, NO_2 , NH_2 , SF_5 , NR^4R^5 або $Si(R^6)_3$, причому n дорівнює 0, 1 або 2,

R^1 незалежно один від одного означають галоген, OH, SH, азотовмісний залишок, що не містить вуглецю, або вуглецевий залишок, що містить від 1 до 30 атомів вуглецю, переважно від 1 до 20 атомів вуглецю,

I означає 0, 1, 2 або 3, переважно 0, 1 або 2, особливо переважно 0 або 1, зазвичай переважно 0,

R^2 означає атом водню або незаміщений або заміщений вуглеводневий залишок, що є незаміщеним або заміщеним і включає замісники, що містять від 1 до 20 атомів вуглецю, переважно від 1 до 10 атомів вуглецю, наприклад, незаміщений або заміщений (C_1-C_4) -алкіл, переважно H або CH_3 ,

R^3 означає вуглеводневий залишок або вуглеводнево-оксильний залишок, переважно залишок з групи, яку складають алкіл, алкеніл, алкініл, циклоалкіл, циклоалкеніл, циклоалкініл, алкокси, алкенілокси, алкінілокси, циклоалкілокси, циклоалкенілокси, арил або арилокси, що є незаміщеними або заміщеними і включають замісники, що містять від 1 до 30 атомів вуглецю, переважно від 1 до 20 атомів вуглецю, або R^3 означає гетероциклічний залишок або гетероциклілоксильний залишок, що є незаміщеним або заміщеним, або R^3 означає атом водню, CN або NR^4R^5 ,

R^4 означає групу формули R^0-Q^0 , де

R^0 означає атом водню, ацильний залишок, вуглеводневий залишок або гетероциклічний залишок, причому кожен з двох останніх залишків є незаміщеним або заміщеним та включає замісники, що містять від 1 до 30 атомів вуглецю, переважно від 1 до 20 атомів вуглецю, та

Q^0 означає простий зв'язок або двовалентну групу формули -O- або -N($R^{\#}$)-, причому $R^{\#}$ означає атом водню, ацильний залишок або вуглеводневий залишок, та причому останній названий залишок є незаміщеним або заміщеним та включає замісники, що містять від 1 до 30 атомів вуглецю, переважно включає від 1 до 20 атомів вуглецю, або R^0 та $R^{\#}$ один з одним утворюють гетероциклічне кільце, що містить азот,

R^5 означає атом водню, ацильний залишок, вуглеводневий залишок або гетероциклічний залишок, причому кожен з двох останніх залишків є незаміщеним або заміщеним та включає замісники, що містять від 1 до 30 атомів вуглецю, переважно представлені від 1 до 20 атомів вуглецю, або R^4 та R^5 один з одним утворюють гетероциклічне кільце, що містить азот,

R^6 означає незаміщений або заміщений вуглеводневий залишок, який має замісники, що містять від 1 до 30 атомів вуглецю, переважно містять від 1 до 20 атомів вуглецю, переважно (C_1-C_4) алкіл або (C_6-C_{10}) арил,

W означає атом кисню або атом сірки,

X, Y незалежно один від одного означають атом водню, галоген, (C_1-C_6) алкіл, (C_1-C_6) алкокси або (C_1-C_6) алкілтіо, причому кожен з останніх 3 залишків є незаміщеним або заміщеним одним або кількома залишками з групи, що включає галогени, (C_1-C_4) алкокси, та (C_1-C_4) алкілтіо, або моно- або ді- $[(C_1-C_6)$ алкіл] аміно, (C_2-C_6) алкеніл, (C_2-C_6) алкініл, (C_3-C_6) алкенілокси або (C_3-C_6) алкінілокси, та

V, Z означають незалежно один від одного CH або N.

Сполуки формули (I) можуть утворювати солі, наприклад ті, в яких водень -SO₂-NH-групи заміщується придатним для сільського господарства катіоном. Це, наприклад, солі металів, зокрема, солі лужних або лужноземельних металів, зокрема, солі натрію та калію, або також солі амонію або солі з органічними амінами. Таким чином, утворення солей може відбуватися шляхом приєднання кислоти до основних груп, як наприклад, аміно та алкіламіно. Придатними для цього є сильні неорганічні та органічні кислоти, наприклад, HCl, HBr, H₂SO₄ або HNO₃.

Вуглецеві залишки - це органічні залишки, що містять щонайменше один атом вуглецю, переважно містять від 1 до 30 атомів вуглецю, особливо переважно від 1 до 20 атомів вуглецю та, крім того, щонайменше один або більше атомів інших елементів періодичної системи, наприклад, таких елементів, як H, Si, N, P, O, S, F, Cl, Br або J. Прикладом вуглеводневих залишків є незаміщені або заміщені вуглеводневі залишки, які можуть бути приєднані до основного скелету безпосередньо або через гетероатом, як-от: N, S, P або O, незаміщені або заміщені гетероциклічні залишки, які можуть бути приєднані до основного скелету безпосередньо або через гетероатом, як-от: N, S, P або O, вуглецеві ацильні залишки або ціано.

У формулі (I) та всіх наступних формулах вуглецеві залишки, такі як алкіл, алкокси, галоалкіл, галоалкокси, алкіламіно та алкілтіо так само, як і відповідні ненасичені та/або заміщені залишки у вуглецевому скелеті можуть бути відповідно розгалужені або нерозгалужені. Якщо спеціально не вказано, у цих залишках переважають нижчі вуглецеві скелети, наприклад, що містять від 1 до 6 атомів вуглецю або, відповідно для ненасичених груп, від 2 до 6 атомів вуглецю. Алкільні залишки, також у комбінованому значенні, як-от: алкокси, галоалкіл і т.д., означають, наприклад, метил, етил, n- або i-пропіл, n-, i-, t- або 2-бутил, пентил, гексил, такий як n-гексил, i-гексил та 1,3-

диметилбутил, гептил, такий як н-гептил, 1-метилгексил та 1,4-диметилпентил; алкенільні та алкінільні залишки мають значення відповідних алкільних можливих ненасичених залишків; алкеніл означає, наприклад, аліл, 1-метилпроп-2-ен-1-іл, 2-метил-проп-2-ен-1-іл, бут-2-ен-1-іл, бут-3-ен-1-іл, 1-метил-бут-3-ен-1-іл та 1-метил-бут-2-ен-1-іл; алкініл означає, наприклад, пропаргіл, бут-2-ін-1-іл, бут-3-ін-1-іл, 1-метил-бут-3-ін-1-іл.

Алкеніл у формі (C_3-C_4) алкенілу, (C_3-C_5) алкенілу, (C_3-C_6) алкенілу, (C_3-C_8) алкенілу або (C_3-C_{12}) алкенілу означає переважно алкенільний залишок, що містить від 3 до 4, від 3 до 5, від 3 до 6, від 3 до 8, від 3 до 12 атомів вуглецю, відповідно, причому подвійний зв'язок знаходиться не біля атому вуглецю, який пов'язаний з іншою частиною молекули сполуки (I) ("іл"-положення). Те ж стосується (C_3-C_4) алкінілу і т.д., (C_3-C_4) алкенілокси і т.д. та (C_3-C_4) алкінілокси і т.д.

Циклоалкіл означає карбоциклічні насичені циклічні системи, що містять переважно 3-8 атомів вуглецю, наприклад, циклопропіл, циклобутил, циклопентил або циклогексил.

Азотовмісні залишки, що не містять вуглецю, означають залишки, які містять переважно від 1 до 10 атомів азоту, особливо переважно 1 або 2 атоми азоту та, крім того, переважно один або більше атомів вуглецю та один або більше атомів одного з кількох відмінних від вуглецю елементів періодичної системи, як-от: H, O або S. Прикладами азотовмісних залишків, що не містять вуглецю, є NH_2 , NO_2 , $NHON$, NO , $NH-NH_2$ або N_3 .

Галогени означають, наприклад, фтор, хлор, бром або йод. Галоалкіл, -алкеніл та -алкініл означають частково або повністю заміщені галогенами, переважно фтором, хлором та/або бромом, зокрема, фтором або хлором, алкіл, алкеніл, алкініл, відповідно, наприклад, CF_3 , CHF_2 , CH_2F , CF_3CF_2 , CH_2FCHCl , CCl_3 , $CHCl_2$, CH_2CH_2Cl ; галоалкокси - це, наприклад, OCF_3 , $OCHF_2$, OCH_2F , CF_3CF_2 , OCH_2CF_3 та OCH_2CH_2Cl ; те ж стосується галоалкенілу та інших залишків, заміщених галогенами.

Вуглеводневий залишок означає нерозгалужений, розгалужений або циклічний та насичений або ненасичений аліфатичний або ароматичний вуглеводневий залишок, наприклад, алкіл, алкеніл, алкініл, циклоалкіл, циклоалкеніл або арил; причому арил означає моно-, бі- або поліциклічну ароматичну систему, наприклад, феніл, нафтил, тетрагідронафтил, інденіл, інданіл, пенталеніл, фтореніл та подібні, переважно феніл; переважно вуглеводневий залишок означає алкіл, алкеніл або алкініл, що містять до 12 атомів вуглецю, або циклоалкіл, що містить 3, 4, 5, 6 або 7 кільцевих атомів або феніл.

Гетероциклічний залишок або кільце (гетероциклі) може бути насиченим, ненасиченим або гетероароматичним та незаміщеним або заміщеним; він переважно містить один або більше гетероатомів в кільці, переважно з групи N, O та S; переважно це аліфатичний гетероциклічний залишок, що містить від 3 до 7 кільцевих атомів, або гетероароматичний залишок, що містить 5 або 6 кільцевих атомів та містить 1, 2 або 3 гетероатоми. Гетероциклічний залишок може означати, наприклад, гетероароматичний залишок або кільце (ге-

тероарил), як наприклад, моно-, бі- або поліциклічна ароматична система, у якій щонайменше 1 кільце містить один або більше гетероатомів, наприклад, піридил, піримідиніл, піридазиніл, піразиніл, триазиніл, тієніл, тіазоліл, оксазоліл, фурил, піроліл, піразоліл та імідазоліл, або частково або повністю гідрований залишок, як-от: оксираніл, оксетаніл, піролідил, піперидил, піпіразиніл, діоксоланіл, морфолініл, тетрагідрофурил. Як замісники для заміщених гетероциклічних залишків використовуються нижчезазначені замісники, додатково також оксо. Оксогрупи можуть також виступати у гетерокільцевих атомах, що можуть мати різні ступені окиснення, наприклад, при N та S.

Заміщені залишки, такі як заміщені вуглеводневі залишки, наприклад, заміщений алкіл, алкеніл, алкініл, арил, феніл та бензил, або заміщений гетероциклі або гетероарил, означають, наприклад, один заміщений залишок, який походить від незаміщеного основного скелету, причому замісники, наприклад, один або більше, переважно означають 1, 2 або 3 залишки з групи галогенів, алкокси, галоалкокси, алкілтіо, гідрокси, аміно, нітро, карбокси, ціано, азидо, алкоксикарбоніл, алкілкарбоніл, форміл, карбамоїл, моно- та діалкіламінокарбоніл, заміщений аміно, як-от: ациламіно, моно- та діалкіламіно, та алкілсульфініл, галоалкілсульфініл, алкілсульфоніл, галоалкілсульфоніл та, у деяких випадках означає циклічні залишки, також алкіл та гало алкіл рівно, як і зазначені насичені залишки, що містять вуглеводи, відповідних ненасичених аліфатичних залишків, як-от: алкеніл, алкініл, алкенілокси, алкінілокси і т.д. Під залишками, що містять атоми вуглецю, розуміють ті, котрі містять від 1 до 4 атомів вуглецю, зокрема, переважно 1 або 2 атоми вуглецю. Переважно, як правило, замісники вибирають з групи, що включає, галоген, наприклад, фтор та хлор, (C_1-C_4) алкіл, переважно метил або етил, (C_1-C_4) галоалкіл, переважно трифторметил, (C_1-C_4) алкокси, переважно метокси або етокси, (C_1-C_4) галоалкокси, нітро та ціано. Особлива перевага надається при цьому метилу, метокси та хлору.

Необов'язково заміщений феніл означає переважно феніл, що є незаміщеним або один або декілька разів, переважно до трьох разів заміщений однаковими або різними залишками з групи, що включає галогени, (C_1-C_4) алкіл, (C_1-C_4) алкокси, (C_1-C_4) галоалкіл, (C_1-C_4) галоалкокси та нітро, наприклад, о-, м- та п-толіл, диметилфеніл, 2-, 3- та 4-хлорфеніл, 2-, 3- та 4-трифтор- та -трихлорфеніл, 2,4-, 3,5-, 2,5-та 2,3-дихлорфеніл, о-, м- та п-метоксифеніл.

Моно- або дизаміщений аміно означає хімічно стабільний залишок з групи заміщених амінозалишків, які, наприклад, є N-заміщеними одним або двома однаковими або різними залишками з групи, що включає алкіл, алкокси, ацил та арил; переважно моноалкіламіно, діалкіламіно, ациламіно, ариламін, N-алкіл-N-ариламіно, так як і N-гетероциклен; причому, переважно означають алкільні залишки, що містять від 1 до 4 атомів вуглецю; арил переважно означає феніл або заміщений феніл; причому для ацилу застосовується вищеза-

значене визначення, переважно форміл, (C₁-C₄)алкілкарбоніл або (C₁-C₄)алкілсульфоніл. Те ж саме застосовується для заміщених гідроксилами-но або гідразино.

Ацильний залишок означає залишок органічної кислоти, який формально утворюється через відокремлення однієї OH-групи від органічної кислоти, наприклад, залишок карбонової кислоти та залишки похідних від неї кислот, таких як: тіокарбонова кислота, необов'язково N-заміщена імінокарбонова кислота або залишки моноестеру вугільної кислоти, необов'язково N-заміщена карбамінова кислота, сульфенова кислота, сульфінорова кислота, фосфенова кислота, фосфінова кислота.

Ацильний залишок означає переважно форміл або аліфатичний ацил з групи CO-R^x, CS-R^x, CO-OR^x, CS-OR^x, CS-SR^x, SOR^y або SO₂R^y, причому R^x та R^y кожного разу означають C₁-C₁₀-вуглеводневий залишок, що є незаміщеним або заміщеним, або амінокарбоніл або аміноссульфоніл, причому два останні залишки незаміщені, N-монозаміщені або N,N-дизаміщені. Ацил означає наприклад, форміл, галогеналкілкарбоніл, алкілкарбоніл, як-от: (C₁-C₄)алкілкарбоніл, фенілкарбоніл, причому фенільне кільце може бути заміщене, наприклад, так як зазначалося вище для фенілу, або алкілоксикарбоніл, фенілоксикарбоніл, бензілоксикарбоніл, алкілсульфоніл, алкілсульфініл, N-алкіл-1-іміноалкіл та інші залишки органічних кислот.

Предметом цього винаходу є також всі стереоізомери, які охоплюються формулою (I), та їхні суміші. Такі сполуки формули (I) містять один або більше асиметричних атомів вуглецю або також подвійний зв'язок, який не вказується окремо у загальній формулі (I). Енантіомери, діастереомери, Z- та E-ізомери, які через свою специфічну просторову форму визначені як стереоізомери, всі охоплюються формулою (I) та можуть бути отримані звичайним способом із сумішей стереоізомерів або також шляхом стереоселективних реакцій в поєднанні із застосуванням стереохімічно чистих вихідних матеріалів.

Вищезазначені приклади для залишків або області значень залишків, що підпадають під загальні поняття "алкіл", "ацил", "заміщені залишки" і т.д., не є вичерпними. Загальні поняття також охоплюють наступні нижчезазначені визначення для областей значень залишків у групах переважних сполук, зокрема, області значень залишків, які охоплюють специфічні залишки з таблиці прикладів.

Переважно згідно з винаходом сполуки формули (I) або їхні солі є такі, в яких

R означає (C₁-C₆)алкіл, (C₂-C₆)алкеніл, (C₂-C₆)алкініл, (C₃-C₆)циклоалкіл, (C₃-C₆)циклоалкеніл, (C₃-C₆)циклоалкініл, (C₁-C₆)алкілокси, (C₂-C₆)алкенілокси, (C₂-C₆)алкінілокси, (C₃-C₆)циклоалкілокси, феніл, фенілокси, F, Br, I, OH, CN, NO₂, NH₂, SF₅, Si((C₁-C₆)алкіл)₃, N((C₁-C₆)алкіл)₂, NH(C₁-C₆)алкіл, N((C₂-C₆)алкеніл)₂, NH(C₂-C₆)алкеніл, N((C₂-C₆)алкініл)₂, NH(C₂-C₆)алкініл, N((C₃-C₆)циклоалкіл)₂, NH(C₃-C₆)циклоалкіл, N(C₁-C₆)алкіл(C₃-C₆)циклоалкіл, N(C₁-C₆)алкілC(O)R³, NHC(O)R³, N(C₁-C₆)алкілS(O)_nR³, NHS(O)_nR³, S(O)_n(C₁-C₄)алкіл,

S(O)_n(C₃-C₆)циклоалкіл, S(O)_n(C₁-C₆)алкеніл, S(O)_n(C₁-C₆)алкініл, S(O)_nNHR³, S(O)_nN(C₁-C₆)алкіл R³, OSO₂(C₁-C₆)алкіл, OSO₂(C₃-C₆)циклоалкіл, OSO₂(C₁-C₆)алкеніл, OSO₂(C₁-C₆)алкініл, OS(O)_nфеніл, OSO₂N((C₁-C₆)алкіл)₂, OSO₂NH(C₁-C₆)алкіл, OSO₂N((C₃-C₆)циклоалкіл)₂, OSO₂NH(C₃-C₆)циклоалкіл, OSO₂N((C₂-C₆)алкеніл)₂, OSO₂NH(C₂-C₆)алкеніл, OSO₂N((C₂-C₆)алкініл)₂, OSO₂NH(C₂-C₆)алкініл, OC(O)R³ або гетероцикліл, причому зазначені залишки алкілу, алкенілу, алкінілу, циклоалкілу, циклоалкенілу, циклоалкінілу, алкілокси, алкенілокси, алкінілокси, циклоалкокси, фенілу, фенілокси, гетероциклілу є незаміщеними або заміщеними, наприклад, можуть бути заміщеними одним або більше залишками з групи, що включає галогени, CN, (C₁-C₆)алкіл, (C₂-C₆)алкеніл, (C₂-C₆)алкініл, (C₁-C₆)алкокси, (C₃-C₆)циклоалкіл, феніл, фенілокси, гетероциклілокси, причому два останні залишки можуть бути однократно або багатократно заміщені залишками з групи, що включає галогени, CN, метил, метокси, трифторметил, трифторметокси,

R¹ незалежно один від одного означають (C₁-C₆)алкіл, (C₁-C₆)галоалкіл, (C₁-C₆)алкілокси, (C₁-C₆)галоалкокси або галоген,

I означає 0, 1 або 2, переважно 0 або 1, особливо переважно 0,

n означає 0, 1 або 2,

R² означає H або CH₃,

R³ означає H, (C₁-C₆)алкіл, (C₂-C₆)алкеніл, (C₂-C₆)алкініл, (C₃-C₆)циклоалкіл, (C₁-C₆)алкілокси, (C₂-C₆)алкенілокси, (C₂-C₆)алкінілокси, (C₃-C₆)циклоалкілокси, феніл, гетероцикліл, CN, NH(C₁-C₆)алкіл, N((C₁-C₆)алкіл)₂, причому зазначені залишки алкіл, алкеніл, алкініл, циклоалкіл, алкілокси, алкенілокси, алкінілокси, циклоалкілокси, феніл, гетероцикліл є незаміщеними або заміщеними, наприклад, одним або більше залишками з групи, що включає галоген, CN, (C₁-C₆)алкіл, (C₁-C₆)алкеніл, (C₁-C₆)алкініл, (C₁-C₆)алкілокси,

W означає атом кисню,

X, Y незалежно один від одного означають (C₁-C₄)алкіл, (C₁-C₄)алкілокси, причому кожен з двох останніх зазначених залишків є незаміщеним або заміщеним одним або кількома атомами галогенів, або (C₁-C₄)алкілтіо, галоген або NH(C₁-C₄)алкіл або N((C₁-C₄)алкіл)₂, та

V, Z незалежно один від одного означають CN або N.

Особливо переважно сполуки формули (I) та/або їхні солі є такими, в яких

R означає (C₁-C₄)алкіл, (C₂-C₄)алкеніл, (C₂-C₄)алкініл, (C₃-C₆)циклоалкіл, (C₁-C₄)алкілокси, (C₂-C₄)алкенілокси, (C₂-C₄)алкінілокси, (C₃-C₆)циклоалкілокси, феніл, фенілокси, F, Br, I, CN, NO₂, NH₂, N((C₁-C₄)алкіл)₂, NH(C₁-C₄)алкіл, NH(C₂-C₄)алкеніл, NH(C₂-C₄)алкініл, NH(C₃-C₆)циклоалкіл, N(C₁-C₄)алкіл(C₃-C₆)циклоалкіл, S(C₁-C₄)алкіл, S(C₂-C₄)алкеніл, S(C₂-C₄)алкініл, S(C₃-C₆)циклоалкіл, S(O)(C₁-C₄)алкіл, S(O)(C₁-C₄)алкеніл, S(O)(C₂-C₄)алкініл, S(O)(C₃-C₆)циклоалкіл, SO₂(C₁-C₄)алкіл, SO₂(C₂-C₄)алкеніл, SO₂(C₂-C₄)алкініл, SO₂(C₃-C₆)циклоалкіл, SO₂NH(C₁-C₄)алкіл, SO₂N((C₁-C₄)алкіл)₂, SO₂NH(C₃-C₆)циклоалкіл, OSO₂(C₁-C₄)алкіл, OSO₂NH(C₁-C₄)алкіл, OSO₂N((C₁-C₄)алкіл)₂ або

NHC(O)R^3 , NHO_2R^3 , OC(O)R^3 , де R^3 означає Н, (C₁-C₄)алкіл, (C₂-C₄)алкеніл, (C₂-C₄)алкініл, (C₃-C₆)циклоалкіл, (C₁-C₄)алкілокси, (C₂-C₄)алкенілокси, (C₂-C₄)алкінілокси, (C₃-C₆)циклоалкілокси, (C₁-C₄)галоалкіл, $\text{NH(C}_1\text{-C}_4\text{)алкіл}$ або $\text{N((C}_1\text{-C}_4\text{)алкіл)}_2$, причому зазначені залишки алкіл, алкеніл, алкініл, циклоалкіл, алкілокси, алкенілокси, алкінілокси, циклоалкілокси, феніл, фенілокси є незаміщеними або заміщеними, наприклад, одним або більше залишками, переважно одним, двома або трьома залишками, з групи, що включає галоген (F, Cl, Br, I), (C₁-C₄)алкіл, (C₁-C₄)алкілокси, (C₁-C₄)галоалкіл, (C₁-C₄)галоалкілокси, (C₃-C₆)циклоалкіл, R^1 означає галоген (F, Cl, Br, I), (C₁-C₄)алкіл, (C₁-C₄)алкілокси, (C₁-C₄)галоалкіл, (C₁-C₄)галоалкілокси,

I означає 0 або 1, переважно 0,

R^2 означає Н або (C₁-C₄)алкіл так, як метил,

W означає атом кисню,

X, Y незалежно один від одного означають (C₁-C₄)алкіл, (C₁-C₄)галоалкіл, (C₁-C₄)алкілокси, (C₁-C₄)галоалкілокси, галогени (F, Cl, Br, I), (C₁-C₄)алкілтіо, $\text{NH(C}_1\text{-C}_4\text{)алкіл}$, $\text{N((C}_1\text{-C}_4\text{)алкіл)}_2$,

V означає атом азоту, та

Z означає СН або N.

Зокрема особливо переважно згідно з винаходом сполуки формули (I) або їхні солі є такими, де

R означає CH_3 , CH_2CH_3 , $(\text{CH}_2)_2\text{CH}_3$, $\text{CH}(\text{CH}_3)_2$, $\text{C}(\text{CH}_3)_3$, $\text{CH}=\text{CH}_2$, $\text{C}\equiv\text{CH}$, $\text{CH}_2\text{CH}=\text{CH}_2$, $\text{CH}_2\equiv\text{CH}$, циклопропіл, феніл, F, Br, I, CN, NO_2 , NH_2 , CH_2OCH_3 , CF_3 , CHF_2 , NHCH_3 , $\text{N}(\text{CH}_3)_2$, NH -циклопропіл, $\text{N}(\text{CH}_3)$ -циклопропіл, NHC(O)H , NHC(O)CH_3 , NHC(O)OCH_3 , NHSO_2CH_3 , NHSO_2CF_3 , $\text{NHSO}_2\text{CHF}_2$, OCH_3 , OCH_2CH_3 , $\text{O}(\text{CH}_2)_2\text{CH}_3$, $\text{OCH}(\text{CH}_3)_2$, $\text{O}(\text{CH}_2)_3\text{CH}_3$, $\text{OCH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)_2$, $\text{OCH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{CH}_3$, $\text{OC}(\text{CH}_3)_3$, $\text{OCH}=\text{CH}_2$, $\text{OC}\equiv\text{CH}$, $\text{OCH}_2\text{CH}=\text{CH}_2$, $\text{OCH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$, O-циклопропіл, OCH_2 -циклопропіл, $\text{O}(\text{CH}_2)_2\text{Cl}$, $\text{O}(\text{CH}_2)_3\text{Cl}$, OCH_2OCH_3 , O-феніл, OCH_2 -феніл, OCF_3 , OCHF_2 , OCH_2F , OCH_2CF_3 , OCH_2CHF_2 , $\text{OCH}(\text{CH}_3)\text{CF}_3$, $\text{OCH}_2\text{CF}_2\text{CF}_3$, SCH_3 , SCH_2CH_3 , $\text{S}(\text{O})\text{CH}_3$, $\text{S}(\text{O})\text{CH}_2\text{CH}_3$, SO_2CH_3 , $\text{SO}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$, SO_2NHCH_3 , $\text{SO}_2\text{N}(\text{CH}_3)_2$, SO_2NHCF_3 , $\text{SO}_2\text{NHCHF}_2$, OSO_2CH_3 , OSO_2CF_3 , OSO_2CHF_2 , $\text{OSO}_2\text{N}(\text{CH}_3)_2$, $\text{OSO}_2\text{NHCF}_3$, $\text{OSO}_2\text{NHCHF}_2$, OC(O)H , OC(O)CH_3 , OC(O)OCH_3 , $\text{OC(O)N}(\text{CH}_3)_2$,

I означає 0,

R^2 означає Н,

W означає кисень,

X, Y незалежно один від одного означають CH_3 , CH_2CH_3 , CF_3 , CHF_2 , CH_2CF_3 , CH_2CHF_2 , OCH_3 , OCH_2CH_3 , OCF_3 , OCHF_2 , OCH_2CF_3 , OCH_2CHF_2 , F, Cl, Br, I, SCH_3 , NHCH_3 , $\text{N}(\text{CH}_3)_2$, переважно CH_3 , OCH_3 , OCH_2CH_3 , Cl, $\text{N}(\text{CH}_3)_2$,

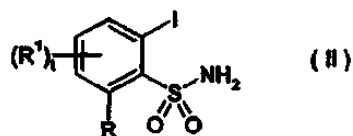
V означає N, та

Z означає СН або N.

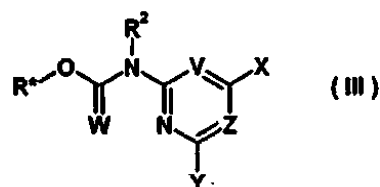
Особлива перевага згідно з винаходом надається сполукам формули (I) та їх солям, які переважно мають комбінації залишків вищезазначених сполук, а також тим, які містять один або кілька залишків із зазначених у Таблиці 1 цього опису. Те ж саме переважно застосовується до сполук формули (I), у яких V означає N.

Предметом даного винаходу є також спосіб одержання сполук згідно з винаходом загальної формули (I) та/або їхніх солей, згідно з яким

а) сполуку формули (II)

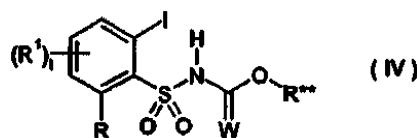


піддають взаємодії із гетероциклічним (тіо)карбаматом формули (III),



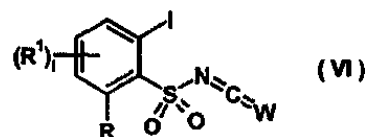
в якій R^* означає заміщений або незаміщений C₁-C₂₀-вуглеводневий залишок, такий як арил або алкіл, переважно необов'язково заміщений феніл або необов'язково заміщений (C₁-C₄)алкіл, або

b) сульфоніл(тіо)карбамат формули (IV),



де R^{**} означає заміщений або незаміщений C₁-C₂₀-вуглеводневий залишок, наприклад, арил або алкіл, переважно необов'язково заміщений феніл або необов'язково заміщений (C₁-C₄)алкіл,

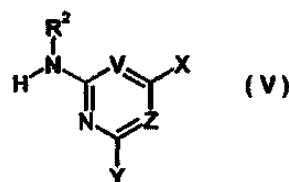
піддають взаємодії з аміногетероциклом формули (V)



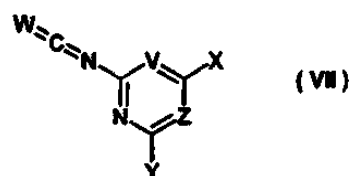
або

c) сульфонілізоціанат формули (VI)

піддають взаємодії з аміногетероциклом формули (V), або



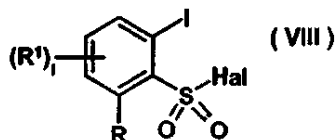
d) сульфонамід формули (II) піддають взаємодії з ізо(тіо)ціанатом формули (VII)



в присутності основи, або

е) аміногетероцикл формули (V) спочатку каталізують в присутності основи та піддають взаємодії з естером вугільної кислоти, наприклад, дифеніл карбонатом, та утворений проміжний продукт піддають взаємодії із сульфонамідом формули (II) (див. варіант а), або

ф) галогенід сульфенової кислоти формули (VIII),



в якій Hal означає атом галогену, переважно хлор,

піддають взаємодії із (тіо)ціанатом, наприклад метал(тіо)ціанатом, зокрема (тіо)ціанатом лужних металів, як-от: (тіо)ціанат натрію, з одержанням ізо(тіо)ціанату формули (VI) або сольватизованого (стабілізованого) його похідного, і потім піддають взаємодії з аміногетероциклом формули (V),

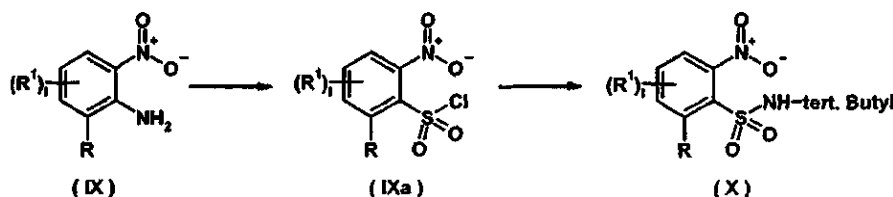
причому у формулах (II)-(VIII) залишки, групи відповідно індексів R, R¹, R², V, W, X, Y, Z та I визначаються як у формулі (I), і також їх переважні значення є такими ж як і у формулі (I).

Реакція обміну сполук формул (II) та (III) відповідає варіантам а) здійснюють переважно в присутності основного каталізатора в інертному органічному розчиннику, як наприклад, дихлорметан, ацетонітрил, діоксан або ТГФ при температурі від 0°C до температури кипіння розчинника, переважно при кімнатній температурі. Причому, як основи застосовують, наприклад органічні амінооснови, як-от: 1,8-діазабіцикло[5.4.0]ундец-7-ен (DBU), трет-бутоксиди лужних металів, як наприклад, NaO-трет-C₄H₉, або гідроксиди лужних металів, як наприклад, NaOH, зокрема при R* означає (заміщ.) феніл (порівн. EP-A-44807), або триалкілалюміній як-от: триметилалюміній або триетилалюміній, останній, зокрема, при R* означає алкіл (порівн. EP-A-166516). Причому, відповідні основи застосовуються, наприклад в межах від 1 до 3 моль еквівалентів, щодо сполук формули (II).

Сульфонаміди формули (II), сполуки формул (IV), (VI) та (VIII), а також наступні описані сполуки формули (XIV) є новими сполуками, які так само, як і їх одержання та застосування для використання сполук формули (I) та/або їх солей є предметом даного винаходу. Для сполук формул (II), (IV), (VI), (VIII) та (XIV) застосовуються ті ж залишки R та R¹ так само, як і індекс I та переважні межі, які вказані для сполук формули (I).

Сполуки формули (II) можна, наприклад, отримати, як показано на наступних схемах 1-8.

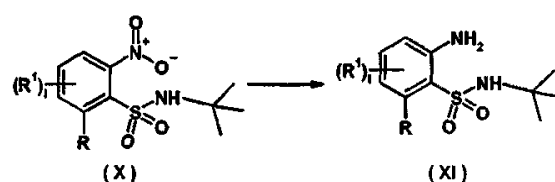
Схема 1



Виходячи із комерційно доступних сполук формули (IX), сполуки формули (IXa) можна отримати, наприклад, шляхом діазотування аміногрупи нітритом лужних металів, наприклад, нітритом натрію, в присутності соляної кислоти при температурі від -10°C до 10°C та шляхом наступного обміну діазогрупи, наприклад, із діоксидом сірки в присутності розчинників, таких як, наприклад, дихлорметан, 1,2-дихлоретан або оцтова кислота, та в присутності каталізаторів, як наприклад, хлорид міді(I) та/або хлорид міді(II), при температурі від -10°C до 50°C (порівн. Meerwein, Chem. Ber. 1957, 90, 841) (схема 1).

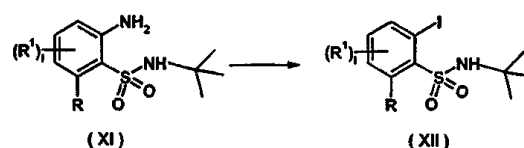
Шляхом обробки сульфохлоридів формули (IXa) трет-бутиламіном можна отримати сульфонаміди формули (X). Утворення сульфонаміду проходить, наприклад в інертних розчинниках, як наприклад, дихлорметан, тетрагідрофуран (ТГФ), діоксан, толуол або диметилформамід (ДМФ) при температурі від -70°C до температури кипіння застосовуваних розчинників, переважно при 25°C. Причому, переважно застосовується кількість аміну від 1,5 до 2,5 еквівалентів відносно застосованого сульфохлориду.

Схема 2



Відновлення сполук азоту (X) до амінів формули (XI) здійснюється аналогічно до відомих методів (порівн. із Houben-Weyl, „Methoden der organischen Chemie“, 4. Aufl. Bd. XI/1 S. 360 ff., Thieme Verlag Stuttgart, 1957) (схема 2).

Схема 3



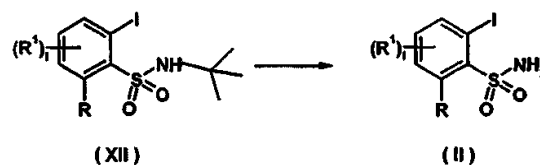
Сполуки формули (XI) за звичайних умов для реакції діазотування можна діазотувати і далі перетворювати у сполуки формули (XII). Наприклад,

діазотування відбувається в присутності кислоти H^+X^- , причому X^- переважно означає Cl^- , I^- або HSO_4^- , у водному розчині, у разі необхідності при застосуванні, за умовами реакції, інертних органічних розчинників, що містять нітрит. Наприклад, діазотування можна здійснювати нітритом лужного металу, таким як, наприклад, $NaNO_2$ (нітрит натрію) в кількості нітриту від 1,0 до 1,2 моль, переважно 1,01-1,05 моль, на моль сполуки формули (XI). Як кислоти застосовують мінеральні кислоти або сильні органічні кислоти, переважно соляну кислоту або сірчану кислоту. Розчинником є вода або суміш води та одного із зазначених за умовами реакції інертних органічних розчинників. Температура реакції становить, як правило, від $-5^\circ C$ до $50^\circ C$, переважно від $10^\circ C$ до $20^\circ C$ (Схема 3).

Реакція обміну отриманих солей діазонію та ариліодидів формули (XII) відбувається, як правило, без виділення та проходить у тому самому водному або водно-органічному розчиннику або сумішах розчинників, що й діазотування. При реакції обміну діазонієва група заміщується на атоми йоду, або на аніони солей діазонію (коли в кислотах $X=I^-$) або (у випадку, коли X^- не є I^-) через реакцію приєднання йодиду, алкаліметалйодиду, переважно натріййодиду або каліййодиду. Причому, кількість йодиду становить, наприклад від 1.1 до 1,5 моль йодиду на моль початкових/вихідних застосовуваних сполук формули (XI). Причому, температура реакції становить в загальному від $10^\circ C$ до $40^\circ C$, переважно від $15^\circ C$ до $30^\circ C$ (порівн.

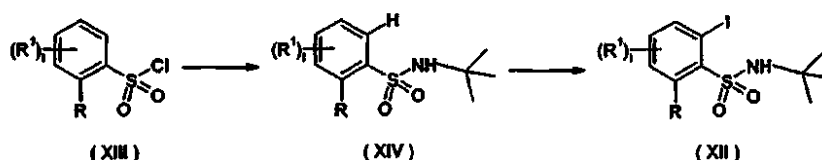
тут наприклад, DE 19625831 та Bioorg. Med. Chem. 2004, 12, 2079) (Схема 3).

Схема 4



Відщеплення трет-бутил-захисної групи у сполуках формули (XII) з одержанням сульфонамідів формули (II) відбувається, наприклад, шляхом обробки сильною кислотою (див. WO 89/10921). Під сильними кислотами розуміють, наприклад, мінеральні кислоти, як H_2SO_4 або HCl , або сильні органічні кислоти, як трифтороцтова кислота. Реакція відбувається, наприклад, при температурі від $-20^\circ C$ до відповідної температури кипіння реакційної суміші зі зворотнім холодильником, переважно при від $0^\circ C$ до $40^\circ C$. Реакція обміну може відбуватися в масі або також в інертному розчиннику, такому як, наприклад, дихлорметан або трихлорметан (схема 4). Окремі сульфонаміди формули (II) відомі. Сполука, в якій $R=F-(CH_2)_2-O-$ та $R=F-(CH_2)_3-O-$ відома із WO 02/072560, із $R=NH_2-$ з WO 93/21170, із $R=C_2H_5-O-CO-CO-NH-$ з W093/21171, та із $R=I$ з HU 44481. Хлорид сульфонові кислоти формули (VIII), в якій $Hal=Cl$, $R=CF_3$ та $I=O$, відомий із Tetrahedron Lett. 1996, 37, 3639.

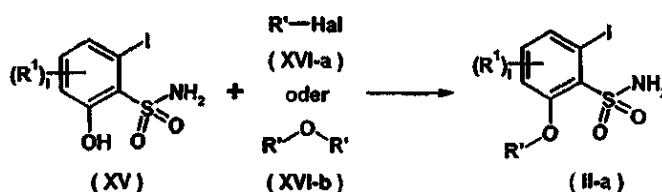
Схема 5



Заміщені трет-бутиламіносульфонільні сполуки формули (XII) також можуть бути отримані шляхом металізації сполук формули (XIV), які одержані внаслідок взаємодії комерційно доступних сульфохлоридів формули (XIII) із трет-бутиламіном (див. схему 1), (сульфохлориди формули (XIII) можуть також бути отримані шляхом діазотування відповідних аміносполук та наступного сульфохлорування як на схемі 1), із металорганічною сполукою, як наприклад, алкіл- або ариллітій, переважно n- або втор-бутиллітій в гексані, в разі потреби в присутності іншого інертного розба-

вника, такого як, наприклад, тетрагідрофуран, та в атмосфері інертного газу, наприклад, в атмосфері аргону або азоту, при температурі від $-70^\circ C$ до $20^\circ C$ - тобто атом водню, наявний в сполуці формули (XIV) в орто-положенні до SO_2NH -трет-бутильної групи заміщується атомом металу - та потім шляхом взаємодії у такому ж середовищі реакції із йодом при температурі від $-100^\circ C$ до $40^\circ C$, переважно від $-70^\circ C$ до $20^\circ C$ - тобто атом металу заміщується йодом (схема 5) (див. тут також: V. Snieckus та ін., J. Org. Chem. 2001, 66, 3662 та Synlett 2000, (9), 1294).

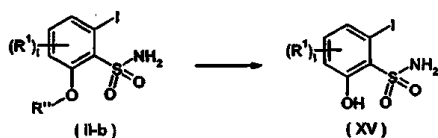
Схема 6



Спеціальні сульфонаміди загальних формул (II-a), в яких R'=вуглеводневий залишок, такий як алкіл, гетероциклічний залишок, CO-R³ або S(O)_n-R³, можуть утворюватися шляхом реакції гідроксибензолсульфонамідів формули (XV) із сполуками загальних формул (XVI-a або XVI-b), причому можуть бути застосовані один або декілька допоміжних засобів реакції. При цьому застосовані у цій реакції сполуки формули (XVI-a) означають залишок R', наприклад, для вуглеводневого залишку як алкіл, гетероциклічний залишок, CO-R³ або S(O)_n-R³, та Hal означають галоген, причому алкіл, галоген, n та R³ мають такі ж значення як у формулі (I). При цьому, сполуки формули (XVI-b) можуть означати R', зокрема CO-R³ або S(O)_n-R³. Як допоміжні засоби для реакції застосовуються, в основному, звичайні неорганічні або органічні основи або акцептори кислоти. До них переважно належать сполуки лужних- або лужно-земельних металів, як наприклад, -ацетати, -аміди, -карбонати, -гідрогенкарбонати, -гідриди, -гідроксиди, - або алканоат -, особливо карбонат калію, карбонат цезію, гідроксид літію, гідроксид натрію та етанолат натрію - а також інші основні органічні сполуки азоту, як наприклад, триетиламін, етил-діізопропіламін, алкілзаміщені піридини, 1,4-діазабіцикло[2.2.2]октан (DABCO), 1,5-діазабіцикло[4.3.0]нон-5-ен (DBN) або 1,8-діазабіцикло[5.4.0]ундец-7ен (DBU).

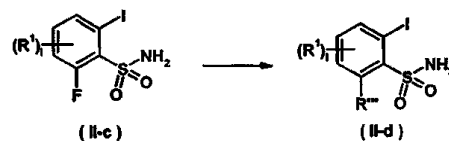
Як розчинник поряд з водою використовуються всі інертні органічні розчинники. Зокрема, тут мова йде про бензол, толуол, ксилол, дихлорметан, хлороформ, діетиловий етер, діоксан, тетрагідрофуран, ацетон, ацетонітрил, N,N-диметилформамід, N-метилпіролідон або естер оцтової кислоти. Температура реакції варіюється в межах від 0°C до температури кипіння розчинника, переважно від 10°C до 120°C (Схема 6) (порівн. також WO 02/072560).

Схема 7



Гідроксибензолсульфонаміди формули (XV) можуть, наприклад, бути отримані з орто-алкоксизаміщених бензолсульфонамідів загальної формули (II-b) (отриманих, наприклад, шляхом реакції за схемами 1-6), причому R'' зокрема може означати (C₁-C₄)алкіл. До того ж, алкокси-сполуки формули (II-b) можуть бути отримані в інертному розчиннику, такому як дихлорметан, дихлоретан або хлороформ, переважно дихлорметан або дихлоретан, з кислот Льюїса, переважно тригалогенідів бору, таких як BBr₃. Температура реакції звичай становить від -30°C до температури кипіння розчинника, переважно від 0°C до 40°C (Схема 7) (див. наприклад, EP044807 та WO 97/03056).

Схема 8



Бензолсульфонаміди загальної формули (II-d) можуть бути отримані шляхом заміни атомів фтору в орто-фторбензолсульфонаміді загальної формули (II-c) (отриманого, наприклад, шляхом реакції за схемами 1-6) на R''' шляхом реакції з нуклеофілами загальної формули R'''. R''' може, зокрема, означати алкокси, циклоалкокси, алкенілокси, алкінілокси, арилокси, гетероциклілокси, алкілтію, алкенілтію, алкінілтію, арилтію, гетероциклілтію, N(Алкіл)₂, NНАлкіл, N(Алкеніл)₂, NНАлкеніл, N(Алкініл)₂, NНАлкініл, NНАрил, NНГетероцикліл, NH₂, причому всі зазначені залишки (до останніх названих) можуть бути заміщеними або незаміщеними. В цій реакції може також застосовуватися один або кілька допоміжних засобів, таких як звичайні неорганічні або органічні основи або акцептори кислоти. До них відносяться переважно сполуки лужних або лужноземельних металів, такі як, наприклад, -ацетати, -аміди, -карбонати, -гідрокарбонати, -гідриди, -гідроксиди, або -алканоати, зокрема карбонат калію, карбонат цезію, гідроксид літію, гідроксид натрію та метанолат натрію і, передусім, гідрид натрію - а також органічні основні сполуки азоту, як наприклад триетиламін, етил-діізопропіламін, алкілзаміщений піридин, 1,4-діазабіцикло[2.2.2]октан (DABCO), 1,5-діазабіцикло[4.3.0]нон-5-ен (DBN) або 1,8-діазабіцикло[5.4.0]ундек-7ен (DBU). Як розчинники поряд з водою застосовуються всі інертні органічні розчинники. Зокрема до них належать бензол, толуол, ксилол, дихлорметан, хлороформ, діетиловий етер, діоксан, тетрагідрофуран, ацетон, ацетонітрил, N,N-диметилформамід, N-метилпіролідон або естер оцтової кислоти, зокрема, переважно - діетиловий етер, діоксан та тетрагідрофуран. Температура реакції становить загалом від -20°C до температури кипіння використовуваних розчинників, зокрема від 0°C до температури кипіння використаного розчинника зі зворотнім холодильником.

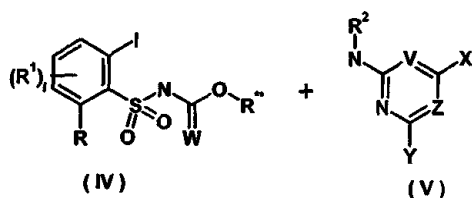
Поряд з чисто термічним протіканням реакції прискорення реакції відбувається також внаслідок використання мікрохвильової енергії. Для цього можуть бути застосовані комерційно доступні мікрохвильові апарати, виготовлені для хімічних цілей. При цьому, реакції проходять загалом при температурі від 20°C до 200°C, переважно від 40°C до 170°C і при енергетичній потужності від 20 до 200Ват, переважно від 50 до 180Ват, причому час реакції становить від 2хв до 60хв, переважно тривалість складає від 5хв до 45хв.

Бензолсульфонаміди загальної формули (II-d), в яких R''' означає алкілтію, алкенілтію, алкінілтію, арилтію або гетероциклілтію можуть перетворюватися на відповідні сульфоксиди або сульфони, аналогічно до відомої з літератури обробки окисниками, переважно такими як метакхлорпербен-

зойнаа кислота, пероксид водню, метаперіодат натрію або озон (порівн., наприклад з.B. "Reactions of Organosulfur Compounds"; Academic Press, new York, 1978, S. 16).

Сульфоніл(тіо)карбамати загальної формули (IV) отримують аналогічно до відомих реакцій (порівн. EP-A-120814). Можна, наприклад, також перетворити сульфонілізо(тіо)ціанат формули (VI) шляхом реакції в інертних розчинниках, переважно діетиловому етері або дихлорметані, з фенолом у (тіо)карбамати формули (IV). Аміногетероцикли формули (V) є відомими, частково комерційно доступними синтетичними хімічними сполуками. Взаємодія сульфоніл(тіо)карбаматів формули (IV) з аміногетероциклами формули (V) проходить у відомий спосіб (порівн., наприклад, WO 2003091228) (Схема 9).

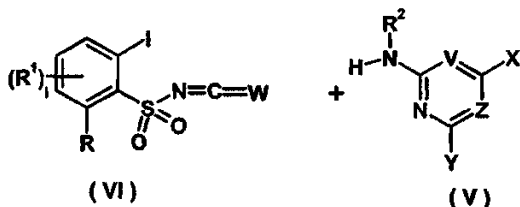
Схема 9



Сульфонілізо(тіо)ціанати загальної формули (VI) можна отримати відомим способом із сульфонамідів загальної формули (II) згідно з винаходом (порівн., DE 3208189, EP 23422, EP 64322, EP 44807, EP 216504). Арисульфонілізо(тіо)ціанати формули (VI) можна отримати при заміщенні арилсульфонамідів загальної формули (II) фосгенами відповідно, тіофосгеном, необов'язково в присутності алкілізоціанатів, як наприклад, бутилізоціанат, необов'язково в присутності допоміжних засобів реакції, як наприклад, діазабіцикло[2.2.2]октан, та в присутності розбавників, таких як, толуол, ксилол або хлорбензол, при температурі від 80°C до 150°C, а після закінчення реакції леткі компоненти переганяють під зменшеним тиском.

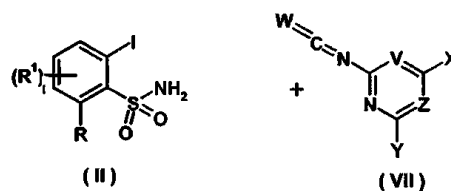
Взаємодія арилсульфонілізо(тіо)ціанатів загальної формули (VI) з аміногетероциклами формули (V) проходить у відомий спосіб (порівн., WO 2003 091228) (Схема 10).

Схема 10



Ізо(тіо)ціанати загальної формули (VII) можна отримати, наприклад, із аміногетероциклів типу (V) шляхом обробки оксалілхлоридом або (тіо)фосфеном (аналогічно до Angew. Chem. 1971, 83, S. 407; EP 388873). Взаємодія ізо(тіо)ціанатів типу (VII) із сульфонамідами загальної формули (II) проходить, наприклад, аналогічно до варіанту с) (Схема 11).

Схема 11



Галогеніди сульфонової кислоти формули (VIII) можуть бути отримані шляхом різних відомих з літератури методів, наприклад, i) окисним хлорванням тіоетеру (Recl. Trav. Chim. Pays-Bas 1982, 101, 91; ii) діазотуванням ароматичних амінів нітритом натрію у соляній кислоті, та подальшою взаємодією отриманої солі діазонію із діоксидом сірки та хлоридом міді (J. Org. Chem. 1960, 1824); iii) гетероатом-регульованим лініюванням та подальшим сульфуванням (EP 73562; Org. React. 1979, 26, 1); iv) перегрупуванням Ньюмана та наступним окисним хлоруванням (US 5157119); v) взаємодією із амідами сульфонової кислоти типу (II) із тіснільхлоридом (Bull. Kor. Chem. Soc. 1994, 15, 323). Сполука формули (VIII), в якій R означає I, відома із FR 2649698. У випадку застосування варіанту f) для синтезу сполук формули (I) реакційну суміш, отримана шляхом взаємодії галогенідів сульфонової кислоти (VIII) із (тіо)ціанатом, безпосередньо використовують для реакції з аміногетероциклом формули (V) (порівн. WO 2003 091228 і US 5550238).

Солі сполук формули (I) отримують переважно в інертних полярних розчинниках, таких як, наприклад, вода, метанол або ацетон при температурі від 0°C до 100°C. Придатними основами для отримання солей згідно з винаходом є, наприклад, карбонати лужних металів, такі як, карбонат калію, гідроксиди лужних та лужноземельних металів, наприклад, NaOH або KOH, або алкоголяти лужних металів, такі як метанолат натрію або трет-бутилат натрію, або аміак або етаноламін.

Під вказаними «інертними розчинниками» для вищезазначених способів проведення реакції розуміють розчинники, які у відповідних умовах реакції залишаються інертними, проте не вони не повинні бути інертними при всіх умовах реакції.

Колекції сполук формули (I) та/або їх солей, які синтезуються шляхом вищезазначених реакцій, можуть також бути отримані паралельно, причому це може відбуватися вручну, частково автоматично або повністю автоматично. Причому, наприклад, можливо автоматизувати протікання реакції, переробку або очистку продуктів, відповідні етапи. В цілому, тут і далі під способом протікання реакції розуміють такий, який описаний S.H. DeWitt в "Annual Reports in Combinatorial Chemistry and Molecular Diversity: Automated Synthesis", Band 1, Verlag Escom 1997, s. 69-77.

Для протікання синтезу із мікрохвильовою підтримкою можна застосовувати мікрохвильовий апарат, наприклад, модель "Discover" фірми CEM GmbH Mikrowellen-Analysentechnik, Carl-Friedrich-Gauß-Str. 9, 47475 Kamp-Lintfort.

Для паралельного протікання реакції, переробки може бути застосовано ряд комерційно досту-

пних апаратів, таких як, наприклад, запропонованих фірмами Stern Corporation, Woodroffe road, Tollesbury, Essex, England, H+P Labortechnik GmbH, Bruckmannring 28, 85764 Oberschleißheim, Німеччина або фірмами Radleys, Shirehill, Saffron Waiden, Essex, CB 11 3AZ, Англія. Для паралельної очистки сполук загальної формули (I) та їх солей, відповідно, при отриманні належних проміжних продуктів застосовуються інші хроматографічні апарати, наприклад фірм ISCO, Inc., 4700 Superior Street, Lincoln, NE 68504, США.

Готові апарати приводять до модульного способу протікання реакції, при якій кожен крок є автоматизованим, проте між кроками повинні проводитися дії вручну. Цього можна уникнути, якщо застосовувати частково або повністю інтегровані автоматизовані системи, у яких кожен автоматичний модуль, наприклад, обслуговується роботом. Такими автоматичними системами, наприклад, є системи фірм Zymark Corporation, Zymark Center, Hopkinton, MA 01748, USA.

Поряд з описаними тут методами сполуки загальної формули (I) та їхні солі можуть бути повністю або частково одержані твердофазними методами. Окремі або всі проміжні етапи синтезу або синтез, узгоджений з відповідними методами роботи, здійснюються з використанням синтетичної смоли. Твердофазні методи синтезу достатньо описані у фаховій літературі, наприклад, Barry A. Bunin у "The Combinatorial Index", Verlag Academic Press, 1998.

Застосування твердофазних методів синтезу допускає існування ряду відомих у літературі протоколів, які здійснюються у ручному або автоматизованому режимі. Наприклад, так званий «метод чайного пакетика» (Houghten, US 4,631,211; Houghten та ін., Proc. Natl. Acad. Sci., 1985, 82, 5131-5135) може бути частково автоматизованим з використанням продуктів фірми IRORI, 11149 North Torrey Pines Road, La Jolla, CA 92037, США. Автоматизація твердофазних методів паралельного синтезу вдається, наприклад, при застосуванні апаратів фірми Argonaut Technologies, Inc., 887 Industrial Road, San Carlos, CA 94070, США або MultiSynTech GmbH, Wullener Feld 4, 58454 Witten, Німеччина.

Отримані згідно із описаним тут способом сполуки формули (I) та їх солі представлені як колекції речовин, так звані бібліотеки. Предметом даного винаходу є також бібліотеки, які містять щонайменше дві сполуки формули (I) та їх солі.

Згідно з винаходом сполуки формули (I) та/або їхні солі, далі названі як «сполуки згідно з формулою», мають гербіцидну дію проти широкого спектру одно- та дводольних шкідливих рослин, що відіграють важливу роль у сільському господарстві. Також активна речовина добре діє проти багаторічних рослин, з якими важко боротися, які виростають із ризом, кореневищ або інших багаторічних частин рослин, з якими важко боротися.

Тому предметом даного винаходу є також спосіб боротьби з небажаними рослинами та регулювання росту рослин, причому, наносять одну або кілька сполук згідно з винаходом на рослини (наприклад, одно- або дводольні бур'яни або небажа-

ні культурні рослини), насіння (наприклад, зерна, насіння або вегетативні органи розмноження, такі як бульба або росток із бруньками) або поверхню, на якій ростуть рослини (наприклад, посівна площа). При цьому, сполуки згідно з винаходом можуть бути застосовані до, під час або після посіву (перед посівом, до появи сходів або після появи сходів). У деяких випадках як приклади названі декілька представників одно- та дводольних бур'янів, які можуть контролюватися речовинами згідно з винаходом, не обмежуючи обсяг охорони винаходу певними видами.

До однодольних бур'янів, наприклад, належать *Apera spica venti*, види *Avena*, види *Alopecurus*, види *Bracharia*, види *Digitaria*, види *Lolium*, види *Echinochloa*, види *Panicum*, види *Phalaris*, види *Poa* spp., види *Setaria*, а також види *Bromus*, такі як *Bromus catharticus*, *Bromus secalinus*, *Bromus erectus*, *Bromus tectorum* та *Bromus japonicus* та *Cyperus*arten з групи одnorічних, а з групи багаторічних видів - *Agropyron*, *Cynodon*, *Imperata*, так як і сорго, а також інші багаторічні види *Cyperus*.

Серед дводольних рослин дія речовини згідно з винаходом поширюється на наступні види таких одnorічних - види *Abutilon*, види *Amaranthus*, види *Chenopodium*, види *Chrysanthemum*, види *Galium*, такі як *Galium aparine*, види *Ipomoea*, види *Kochia*, види *Lamium*, види *Matricaria*, види *Pharbitis*, види *Polygonum*, види *Sida*, види *Sinapis*, види *Solarium*, види *Stellaria*, види *Veronica* та види *Viola*, види *Xanthium*, та багаторічних бур'янів - *Convolvulus*, *Cirsium*, *Rumex*, *Artemisia*.

У випадку специфічних умов вирощування культурних рослин, наприклад рису, речовини згідно з винаходом також проявляють чудову дію для боротьби із наступними рослинами - *Echinochloa*, *Sagittaria*, *Alisma*, *Eleocharis*, *Scirpus* і *Cyperus*.

Якщо сполуки згідно з винаходом перед проростанням наносять на поверхню землі, то вдається повністю запобігти появі сходів бур'янів або бур'яни виростають до стадії появи зародкового листка, а потім їх ріст зупиняється і зрештою вино повністю відмирають через три-чотири тижні.

При нанесенні діючої речовини на зелені частини рослин після того, як вони зійшли, наступає також дуже швидка помітна зупинка росту, і бур'яни або залишаються на такій же стадії росту, як в момент застосування речовини, або гинуть через певний час, так як при цьому способі конкуренція між культурними рослинами та шкідливих бур'янами ліквідується.

Крім того, що сполуки згідно з винаходом виявляють чудову гербіцидну активність проти одно- та дводольних бур'янів, культурні рослини господарського значення, такі як, наприклад, дводольні культури, наприклад, соя, бавовник, рапс, цукровий буряк, або зернові культури, такі як, пшениця, ячмінь, жито, кукурудза та рис, зокрема кукурудза і пшениця, можуть мати лише незначні ушкодження або взагалі залишатися неушкодженими. Саме тому дані сполуки є придатними для селективної боротьби з небажаним ростом рослин в культурах рослинах, таких як важливі сільськогосподарські рослини або декоративні рослини.

Крім того, сполуки згідно з винаходом виявляють чудову властивість регулювання росту культурних рослин. Вони регулюють обмін речовин у рослинах і при цьому можуть бути застосовані для цілеспрямованого впливу на вміст речовин у рослинах і для полегшення збору врожаю, як наприклад, шляхом десикації та уповільнення росту. Крім того, вони придатні також для загального регулювання та інгібування небажаного вегетативного росту, при цьому, без знищення рослини. Інгібування вегетативного росту відіграє велику роль для багатьох одно- або дводольних культур, оскільки через це зменшується або повністю усувається здатність до зберігання.

Виходячи із гербіцидних властивостей та властивості регулювати ріст, активна речовина також може бути застосована для боротьби із шкідливими рослинами в культурах відомих або генетично змінених рослин, що будуть створені. Трансгенні рослини характеризуються, як правило, особливими корисними властивостями, наприклад, резистентністю до певних пестицидів, перед усім визначених гербіцидів, резистентністю проти захворювань рослин або збудників хвороб рослин, як і до певних комах або мікроорганізмів, таких як гриби, бактерії або віруси. Інші особливі властивості стосуються, наприклад, кількості та якості зібраного врожаю, стійкості при зберіганні, складу і спеціального вмісту. Таким чином, відомі трансгенні рослини мають підвищений вміст крохмалю або змінену якість крохмалю або інший вміст жирних кислот у продуктах врожаю.

Переважаю застосування сполуки згідно з винаходом для важливих сільськогосподарських трансгенних культур, корисних та декоративних рослин, наприклад, для злакових, таких як пшениця, ячмінь, жито, овес, просо, рис, маніок та кукурудза або також інші культури, такі як цукровий буряк, бавовник, соя, рапс, картопля, помідори, горох та інші сорти овочів.

Переважаю сполуки згідно з винаходом можуть застосовуватися як гербіциди для корисних культурних рослин, які є стійкими до фітотоксичної дії гербіцидів або їм була надана стійкість за допомогою методів генної інженерії.

Традиційний спосіб отримання нових рослин, які в порівнянні до отриманих тепер рослин виявляють модифіковані властивості, зберігаються, наприклад, при класичному методі вирощування і одержанні мутантів. Альтернативно нові рослини зі зміненими властивостями можуть бути одержані за допомогою методу генної інженерії (див., наприклад, EP-A-0221044 та EP-A-0131624). Описано, наприклад, у багатьох випадках

- генно-технічно змінені культурні рослини з метою модифікації синтетичної сили у рослинах (наприклад, WO 92/11376, WO 92/14827 та WO 91/19806),

- трансгенні культурні рослини, які є резистентними до певних гербіцидів типу Глүфосинату (порівн. наприклад, EP-A-0242236, EP-A-242246) або Гліфосату (WO 92/00377) або сульфонілкарбамідів (EP-A-0257993, US-A-5013659),

- трансгенні культурні рослини, наприклад, бавовник, із властивістю виробляти бацили турінгєнсис-токсинів (Bt-токсини), які роблять рослини ре-

зистентними до певних шкідників (EP-A-0142924 та EP-A-0193259),

- трансгенні культурні рослини з модифікованими композиціями жирних кислот (WO 91/13972).

Багаточисленні молекулярно-біологічні техніки, за допомогою яких можна отримати нові трансгенні рослини зі зміненими властивостями, в принципі, відомі (див., наприклад, Sambrook та ін., 1989, Molecular Cloning, A Laboratory Manual, вид. 2, Cold Spring Harbor Laboratory Press, Cold Spring Harbor, NY; або Winnacker "Gene und Klone", VCH Weinheim 2. Auflage 1996; або Christou, "Trends in Plant Science" 1 (1996) 423-431).

Для подібних операцій генної інженерії можуть застосовуватися молекули нуклеїнової кислоти у плазміді, що дозволяє мутагенез або послідовну зміну шляхом рекомбінації ДНК-послідовностей. За допомогою вищезазначених стандартних процесів можна, наприклад, проводити катіонний обмін, видаляти послідовність або додавати природні або синтетичні послідовності. Для сполук фрагменти ДНК можуть змішуватися із фрагментами адаптерів або лінкерів.

Отримання клітин рослин зі зменшеною активністю генних продуктів можна, наприклад, досягнути шляхом експресії щонайменше відповідних антимислових-РНК, смислових-РНК для отримання ефекту спільного придушення або шляхом експресії щонайменше відповідних сконструйованих рибосомів, які розщеплюють специфічні транскрипти вищезазначених продуктів генної інженерії.

Для цього застосовуються молекули ДНК, які повністю охоплюють кодовану послідовність генних продуктів, включаючи можливі наявні бокові послідовності, а також молекули ДНК, які охоплюють лише частину кодованої послідовності, причому ці частини повинні бути достатньо довгими, для того, щоб викликати у клітинах анти смисловий ефект. Також можливим є застосування ДНК-послідовностей, які виявляють високу ступінь гомологічності до кодованих послідовностей продуктів генної інженерії, однак вони не є повністю ідентичними з ними.

При експресії молекул нуклеїнової кислоти в рослинах синтетичні протеїни можуть знаходитися у будь-якій частині клітин рослин. Проте для досягнення локалізації у певній конкретній частині, кодований регіон може, наприклад, бути зв'язаний із ДНК-послідовностями, які забезпечують локалізацію у визначеній частині. Такі послідовності відомі спеціалістам (див., наприклад, Braun та ін., EMBO J. 11. (1992), 3219-3227; Wolter та ін., Proc. Natl. Acad. Sei. USA 85 (1988), 846-850; Sonnewald та ін., Plant J. 1 (1991), 95-106).

Клітини трансгенних рослин можуть бути регеровані у всіх рослинах відповідно до відомих методик. У випадку трансгенних рослин це може бути принциповим для застосування до рослин будь-якого виду, тобто також до однодольних та дводольних рослин.

Таким чином отримують трансгенні рослини, які виявляють змінені властивості внаслідок надекспресії, придушення або інгібування гомологічних (=природних) генів або послідовностей генів або експресії гетерологічних (=чужорідних) генів або послідовностей генів.

Переважно сполуки згідно з винаходом можуть бути застосовані до трансгенних культур, які є резистентними до гербіцидів з групи, що включає сульфонілкарбаміди, глүфосинат-амоній або гліфосат-ізопропіламоній, та аналогічних активних речовин.

При застосуванні сполук згідно з винаходом для трансгенних культур поряд із діями, що спостерігаються в інших культурах при боротьбі зі шкідливими рослинами, тут часто виникають дії, які є специфічними для застосування у відповідній трансгенній культурі, наприклад, змінений або специфічно розширений спектр бур'янів, проти яких можна боротися, змінені кількості застосування, які можуть бути використані для обробки, переважно хороша здатність до комбінування із гербіцидами, до яких трансгенні культури є стійкими, так само як і вплив на ріст та урожайність трансгенних культур.

Таким чином предметом даного винаходу є також застосування сполук згідно з винаходом як гербіцидів для боротьби зі шкідливими рослинами серед трансгенних і не трансгенних культур.

Сполуки згідно з винаходом можуть бути застосовані у формі змочуваного порошку, емульгованих концентратів, розпилювальних розчинів, засобів для запилення або гранулятів у звичайних препаративних формах. Тому предметом даного винаходу є також гербіцидні засоби та засоби регулювання росту рослин, які містять сполуки згідно з винаходом.

Сполуки згідно з винаходом можуть бути одержані різними способами, залежно від заданих біологічних та/або фізико-хімічних параметрів. Придатними формами композицій є такі: змочувані порошки (WP), порошки, розчинні у воді (SP), розчинні у воді концентрати, здатні до емульгування концентрати (EC), емульсії (EW), такі як емульсії типу вода-у-маслі та масло-у-воді, розпилювальні розчини, суспензійні концентрати (SC), дисперсії на масляній або водній основі, розчини, що піддаються змішуванню з маслом, капсульовані суспензії (CS), засоби для запилення (DP), протруювальні засоби, грануляти для розсипання та нанесення на ґрунт, грануляти (GR) у формі мікрогранулятів, розпилюваних гранулятів, гранулятів для нанесення та адсорбційних гранулятів, здатні до диспергування у воді грануляти (WG), розчинні у воді грануляти (SG), УФ-композиції, мікрокапсули та воски. Ці окремі типи композицій в принципі відомі та описані, наприклад, у: Winnacker-Küchler, "Chemische Technologie", Band 7, C. Hanser Verlag München, 4. Aufl. 1986; Wade van Valkenburg, "Pesticide Formulations", Marcel Dekker, N.Y., 1973; K. Martens, "Spray Drying" Handbook, 3-є вид. 1979, G. Goodwin Ltd. London.

Необхідні допоміжні речовини для створення композицій, зокрема, інертні матеріали, поверхнево-активні речовини, розчинники та інші добавки є відомі і були описані у: Watkins, "Handbook of Insecticide Dust Diluents and Carriers", 2-е вид., Darland Books, Caldwell N.J., H.v. Olphen, "Introduction to Clay Colloid Chemistry"; 2-е вид., J. Wiley & Sons, N.Y.; C. Marsden, "Solvents Guide"; 2-е вид., Interscience, N.Y. 1963; McCutcheon's "Detergents and Emulsifiers Annual", MC Publ. Corp.,

Ridgewood N.J.; Sisley and Wood, "Encyclopedia of Surface Active Agents", Chem. Publ. Co. Inc., N.Y. 1964; Schönfeldt, "Grenzflächenaktive Äthylenoxidaddukte", Wiss. Verlagsgesell., Stuttgart 1976; Winnacker-Küchler, "Chemische Technologie", Band 7, C Hanser Verlag München, 4. Aufl. 1986.

На основі цих композицій одержують також комбінації з іншими пестицидно-активними речовинами, такими як, наприклад, інсектициди, акарициди, гербіциди, фунгіциди, а також з саференами, добривами та/або регуляторами росту, наприклад, у формі готової композиції або суміші в резервуарі.

Змочуваний порошок - це рівномірно диспергований у воді препарат, який поряд з діючою речовиною, крім розбавників або інертних речовин, містить ще поверхнево-активні речовини іонного та/або неіонного виду (змочувач, диспергатор), наприклад, поліоксиетильовані алкілфеноли, поліоксиетильовані жирні спирти, поліоксиетильовані жирні аміни, сульфати полігліколевих етерів жирних спиртів, алкансульфонати, алкілбензолсульфонати, лігнінсульфоновокислий натрій, 2,2'-динафтилметан-6,6'-дисульфоновокислий натрій, дибутилнафталінсульфоновокислий натрій, або також олеїлметилтауриновокислий натрій. Для виготовлення змочуваного порошку гербіцидно-активні речовини подрібнюють, наприклад, у звичайних апаратах, таких як молоткові млини, компресорні млини та повітряні млини та одночасно або після того змішують із допоміжними засобами для суміші.

Емульговані концентрати отримують шляхом розчинення діючих речовин в органічних розчинниках, як наприклад, бутанол, циклогексанон, диметилформамід, ксилол або також висококиплячі ароматичні сполуки або вуглеводні, або сумішах органічного розчинника з однією або декількома поверхнево-активними речовинами іонного та/або неіонного виду (емульгаторів). Як емульгатори застосовуються, наприклад: кальцієві солі алкіларилсульфонові кислоти, такі як Са-додецилбензолсульфонат, або неіонні емульгатори, такі як полігліколевий естер жирної кислоти, алкіларилполігліколевий етер, полігліколевий етер жирного спирту, продукти конденсації пропіленоксиду-етиленоксиду, алкіловий поліетер, сорбітановий естер, як, наприклад, сорбітановий естер жирної кислоти або поліоксиетиленсорбітановий естер, такий як, наприклад, поліоксиетиленсорбітановий естер жирної кислоти.

Засіб для розпилювання одержують внаслідок змішування діючих речовин з дуже подрібненими твердими речовинами, наприклад, тальком, природною глиною, як наприклад, каолін, бентоніт та пірофіліт, або діатомова земля.

Концентрат суспензії може бути на водній або масляній основі. Концентрати можуть бути одержані, наприклад, через комерційно доступні засоби шляхом вологого подрібнення у гранульних млинах та при необхідності додавання поверхнево-активних речовин, як, наприклад, було описано вище у випадку інших композицій.

Емульсії, наприклад, водно-масляні емульсії (EW), одержують, наприклад, за допомогою мішалок, колоїдних млинів та/або статичних міксерів із

застосуванням водних органічних розчинників та при необхідності поверхнево-активних речовин, як, наприклад, було описано вище у випадку інших композицій.

Гранулят може бути одержаний або шляхом напilenня діючих речовин на гранульовані інертні матеріали, здатні до адсорбції, або шляхом нанесення концентратів діючої речовини на клейкі речовини, наприклад, полівініловий спирт, поліакриловокислий натрій або також мінеральні масла, на поверхню речовини-носія, як-от: пісок, каолініти або гранульований інертний матеріал. Також придатні діючі речовини можуть бути гранульовані шляхом виготовлення гранульованих засобів для удобрення звичайним способом - бажано в суміші з засобами для удобрення.

Здатний до диспергування у воді гранулят як правило виготовляється у звичайний спосіб, такий як розпилювальна сушка, гранулювання у псевдозріджувальному шарі, тарілчасте гранулювання, змішування високошвидкісними міксерами, та екструзією без твердих інертних матеріалів.

Для виготовлення грануляту шляхом тарілчастого гранулювання, псевдозріджуваного грануляту, екструзійного грануляту та розсипчастого грануляту див., наприклад, спосіб у "Spray-Drying Handbook" 3-є вид., 1979, G. Goodwin Ltd., London; J.E. Browning, "Agglomeration", Chemical and Engineering 1967, стор. 147; "Perry's Chemical Engineer's Handbook", 5-є вид., McGraw-Hill, New York 1973, с. 8-57.

Для подальших деталей одержання засобів для охорони рослин див., наприклад, G.C. Klingman, "Weed Control as a Science", John Wiley and Sons, Inc., New York, 1961, стор. 81-96 та J.D. Freyer, S.A. Evans, "Weed Control Handbook", 5-є вид., Blackwell Scientific Publications, Oxford, 1968, стор. 101-103.

Агрохімічні композиції містять, як правило, від 0,1 до 99мас.%, зокрема, від 0,1 до 95мас.%, сполуки згідно з винаходом. У змочувальних порошках концентрація діючої речовини становить, наприклад, приблизно від 10 до 90мас.%, решта до 100мас.% складається зі звичайних складових частин композиції. В здатних до емульгування концентратах концентрація діючої речовини становить приблизно від 1 до 90, переважно від 5 до 80мас.%. Композиції для запилення містять від 1 до 30мас.% діючої речовини, переважно в більшості випадків від 5 до 20мас.% діючої речовини, розпилюваний розчин містить приблизно від 0,05 до 80, переважно від 2 до 50мас.% діючої речовини. У диспергованих у воді гранулятах вміст діючої речовини частково залежить від того, чи є діюча сполука рідкою або твердою, і який засіб гранулювання, наповнювач, і т.д. застосовано. У диспергованих у воді гранулятах вміст діючої речовини становить, наприклад, від 1 до 95мас.%, переважно від 10 до 80мас.%.

Поряд з тим зазначена композиція діючої речовини містить при необхідності, в кожному окремому випадку звичайний активатор адгезії, змочувач, диспергатор, емульгатор, просочувач, консерватор, антифриз та розчинник, наповнювач, носій та фарбник, протипінний засіб, антитранспі-

рант та засоби, що впливають на значення pH і в'язкість.

Як компоненти для комбінування для сполуки згідно з винаходом у комплексі сумішей або сумішей у резервуарі застосовується, наприклад, відома діюча речовина, яка залежить від інгібування наприклад, ацетолактатсинтази, ацетил-CoA-карбоксілази, целюлозасинтази, енолпірувілішкімат-3-фосфатсинтази, глутамінсинтетази, п-гідроксифенілпіруватдіоксигенази, фітоендесатурази, фотосистеми I, фотосистеми II, протопорфіриногеноксидази, як наприклад, відомо з Weed Research 26 (1986) 441-445 або "The Pesticide Manual", 13-е вид, The British Crop Protection Council and the Royal Soc. of Chemistry, 2003 та цитованих там джерел. Серед відомих гербіцидів, які можуть бути зкомбіновані зі сполуками згідно з винаходом, можна назвати наступні діючі речовини (примітка: сполуки позначаються або "звичайною назвою" за міжнародною організацією стандартизації (ISO) або хімічними назвами, при необхідності зі звичайними номерами кодів) та охоплюють постійно всі без винятку форми застосування, такі як кислоти, солі, естери та ізомери, такі як стереоізомери та оптичні ізомери. Причому, нижче названі одна або кілька форм застосування:

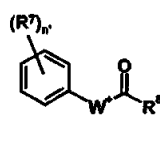
2,4-D, ацетохлор, ацифторфен, ацифторфен-натрій, аклоніфен, алахлор, алоксидим, алоксидим-натрій, аметрин, амікарбазон, амідосульфурон, амінопіралід, амітрол, анілофос, асулам, атразин, азафенідин, азимсульфурон, бифлутамід, беназолін, беназолін-етил, бенфуресат, бенсульфурон-метил, бентазон, бензфендізон, бензобіциклон, бензофенап, біфенокс, біфенафос, біспірибак-натрій, бромацил, бромобутид, бромофеноксим, бромоксиніл, бутахлор, бутафенацил, бутенахлор, бутралін, бутроксидим, бутилат, сафенстрол, карбетамід, карфентразон-етил, хлومتоксифен, хлоридазон, хлоримурон-етил, хлорнітрофен, хлоротолурон, хлорсульфурон, цинідон-етил, цинметилін, циносульфурон, клетодим, клетодим, клодинафоп-пропаргил, кломазон, кломепроп, клопіралід, клорансулам-метил, кумулурон, ціаназин, циклосульфамурон, циклоксидим, цигалофоп-бутил, десмедіфан, дикамба, дихлобеніл, дихлорпроп, дихлорпроп-Р, диклофоп-метил, диклосулам, дифензокват, дифлуфенікан, дифлуфензопір, дикегулак-натрій, димефурон, димепіперат, диметахлор, диметаметрин, диметенамід, триазифлам, дикват-дибромід, дитіопір, діурон, димрон, ЕРТС, еспрокарб, еталфлуралін, етаметсульфурон-метил, етофумезат, етоксифен, етоксисульфурон, етобензанід, феноксапроп-етил, феноксапроп-Р-етил, фентразамід, флампроп-М-ізопропіл, флампроп-М-метил, флазасульфурон, флорасулам, флаузифоп, флаузифоп-бутил, флаузифоп-бутил, флаузолат, флаукарбазон-натрій, флауцетосульфурон, флахло-ралін, флауфенацет, флцфенпір, флуметсулам, флуміклорак-пентил, флуміоксазин, флуометурон, фторхлоридон, фторглікофен-етил, флупоксам, флупірсульфурон-метил-натрій, флуридон, флу-роксибір, флуороксибір-бутоксипропіл, флуорокси-бір-метил, флуорпрімідол, флуортамон, флутиацет-метил, фомезафен, форамсульфурон, глүфоси-нат, глүфосинат-амоній, гліфосат, галосульфурон-

метил, галоксифоп, галоксифоп-етокиетил, галоксифоп-метил, галоксифоп-Р-метил, гексазинон, імазаметабенз-метил, імазамокс, імазапик, імазапир, імазаквін, імазетапир, імазосульфурон, інданован, йодосульфурон-метил-натрій, іоксиніл, ізопротурон, ізоурон, ізоксабен, ізоксахлортол, ізокасфлутол, кетоспірадокс, лактофен, ленацил, лінурон, МСРА, мекопроп, мекопроп-Р, мефенацет, мезосульфурон-метил, мезотрион, метаміфоп, метамітрон, метазахлор, метабензтіазурон, метилдимрон, метобромурон, метолахлор, метосулам, метоксурон, метрибузин, метсульфурон-метил, монілат, монолінурон, напроаніліди, напропаміди, небурон, нікосульфурон, норфлуразон, орбенкарб, оризалін, оксадіаргіл, оксадіазон, оксасульфурон, оксазикломефон, оксифторфен, паракват, пеларгонова кислота, пендиметалін, пендралін, пенокссулам, пентоксазон, петоксамід, фенмедифам, піклорам, піколінафен, піноксаден, піперофос, претілахлор, примісульфурон-метил, профлуазол, профоксидим, прометрин, пропахлор, пропаніл, пропаквізафоп, пропізохлор, пропоксикарбазон-натрій, пропізамід, просульфокарб, просульфурон, піраклоніл, пірафлуфен-етил, піразолат, піразосульфурон-етил, піразоксифен, пірибензоксим, пірибутикарб, піридафол, піридат, пірифталід, піримінобак-метил, піритіобак-натрій, квінклолак, квінмерак, квінкламін, квізалофоп-етил, квізалофоп-Р-етил, квізалофоп-Р-тефурил, римсульфурон, сетоксидим, симазин, симетрин, S-метолахлор, сулкотріон, сульфентразон, сульфометурон-метил, сульфосат, сульфосульфурон, тебутіурон, тепралоксидим, тербутилазин, тербутрин, тенілхлор, тіазопір, тіфенсульфурон-метил, тіобенкарб, тіокарбазил, тралоксидим, триалат,

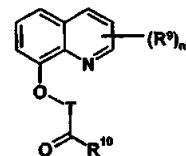
триасульфурон, трибенурон-метил, триклопир, тридифан, трифлорисульфурон, трифлуралін, трифлусульфурон-метил та тритосульфурон.

Сполуки згідно з винаходом можуть також застосовуватися в комбінації з одним або декількома діючими засобами як захисними засобами. Прикладами таких захисних засобів є:

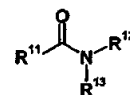
а) Сполуки формул від (XVII) до (XIX),



(XVII)



(XVIII)



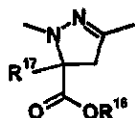
(XIX)

в яких символи та індекс мають наступні значення:

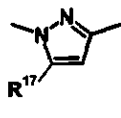
n' означає натуральне число від 0 до 5, переважно від 0 до 3;

T означає (C_1 або C_2)анкандіїльний ланцюг, який є незаміщеним або заміщений одним або двома (C_1 - C_4) алкільними залишками або [(C_1 - C_3)алкоксикарбонільними залишками];

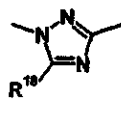
W^+ означає заміщений або незаміщений дво-валентний гетероциклічний залишок, вибраний з групи, що складається із частково ненасичених або ароматичних п'ятичленних гетероциклів, що містять від 1 до 3 кільцевих гетероатомів типу N або O, причому в кільці наявні хоча б один атом азоту і максимум один атом кисню, переважно один із залишків із групи від (W^+1) до (W^+4),



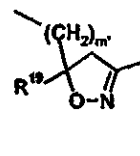
W*1



W*2



W*3



W*4

m' означає 0 або 1;

R^7 , R^9 є однаковими або різними і означають кисень, водень, галоген, (C_1 - C_4)алкіл, (C_1 - C_4)алкокси, нітро або (C_1 - C_4)галоалкіл;

R^8 , R^{10} є однаковими або різними і означають OR^{14} , SR^{14} або $NR^{14}R^{15}$ або насичений чи ненасичений 3- - 7-членний гетероцикл, що має щонайменше один атом азоту та до 3 гетероатомів, переважно з групи O та S, що пов'язані через атом азоту з карбонільною групою у формулах (XVII)-(XVIII), та є незаміщеним або заміщеним залишками з групи, що включає (C_1 - C_4)алкіл, (C_1 - C_4)алкокси або необов'язково заміщений феніл, переважно залишок формули OR^{14} , NHR^{15} або $N(CH_3)_2$, зокрема, формули OR^{14} ;

R^{14} означає водень або незаміщений або заміщений аліфатичний вуглеводневий залишок, що містить переважно в цілому від 1 до 18 атомів вуглецю;

R^{15} означає водень, (C_1 - C_6)алкіл, (C_1 - C_4)алкокси або заміщений чи незаміщений феніл;

R^{16} означає кисень, (C_1 - C_{48})алкіл, (C_1 - C_6)галоалкіл, (C_1 - C_4)алкокси-(C_1 - C_4)алкіл, (C_1 - C_4)гідроксиалкіл, (C_3 - C_{12})циклоалкіл або три-(C_1 - C_4)алкілсиліл;

R^{17} , R^{18} , R^{19} є однаковими або різними і означають кисень, (C_1 - C_1)алкіл, (C_1 - C_8)галоалкіл, (C_3 - C_{12})циклоалкіл або заміщений або незаміщений феніл;

R^{11} означає (C_1 - C_4)алкіл, (C_1 - C_4)галоалкіл, (C_1 - C_4)алкеніл, (C_2 - C_4)галоалкеніл, (C_3 - C_7)циклоалкіл, переважно дихлорметил;

R^{12} , R^{13} є однаковими або різними і означають кисень, водень, (C_1 - C_4)алкіл, (C_2 - C_4)алкеніл, (C_2 - C_4)алкініл, (C_1 - C_4)галоалкіл, (C_2 - C_4)галоалкеніл, (C_1 - C_4)алкілкарбамоїл-(C_1 - C_4)алкіл, (C_2 - C_4)алкенілкарбамоїл-(C_1 - C_4)алкіл, (C_1 - C_4)алкокси-(C_1 - C_4)алкіл, діоксоланіл-(C_1 - C_4)алкіл, тіазоліл, фурил, фурилалкіл, тієніл, піперидил, заміщений або незаміщений феніл, або R^{12} та R^{13} утворюють разом заміщене або незаміщене гетероциклічне кільце, переважно оксазолідин-, тіазолідин-, піпе-

рідин-, морфолін-, дигідропіримідин- або бензооксазинове кільце; або

b) одна або декілька сполук з групи:

1,8-гідрид нафталенової кислоти,

метил-дифенілметоксиацетат,

ціанометоксиіміно(феніл)ацетонітрил (ціометриніл),

1,3-діоксолан-2-

илметоксиіміно(феніл)ацетонітрил (оксабетриніл),

4'-хлор-2,2,2-трифторацетофенон O-1,3-

діоксолан-2-ілметилоксим (флюксофеніл),

4,6-дихлор-2-фенілпіримідин (фенклорим),

бензил-2-хлор-4-трифторметил-1,3-тіазол-5-

карбоксилат(флуразол),

2-дихлорметил-2-метил-1,3-діоксолан (MG-

191),

N-(4-метилфеніл)-N'-(1-метил-1-

фенілетил)карбамід (димрон),

1-[4-(N-2-метоксибензотсульфамойл)феніл]-3-метилкарбамід,

1-[4-(N-2-метоксибензоїлсульфамойл)феніл]-

3,3-диметилкарбамід,

1-[4-(N-4,5-диметилбензоїлсульфамойл)феніл]-

3-метилкарбамід,

1-[4-(N-нафтоїлсульфамойл)феніл]-3,3-

диметилкарбамід,

(2,4-дихлорфенокси)оцтова кислота(2,4-D),

(4-хлорфенокси)оцтова кислота,

(R,S)-2-(4-хлор-о-толілокси)пропіонова кислота (мекопроп),

4-(2,4-дихлорфенокси)масляна кислота (2,4-DB),

(4-хлор-о-толілокси)оцтова кислота (MCPA),

4-(4-хлор-о-толілокси)масляна кислота,

4-(4-хлорфенокси)масляна кислота,

3,6-дихлор-2-метоксибензойна кислота (дикамба),

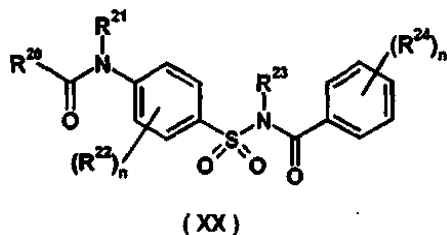
1-(етоксикарбоніл)етил

3,6-дихлор-2-

метоксибензоат (лактідихлор),

а також їх солі та естер, переважно (C₁-C₄)-естер;

c) N-ацилсульфонаміди формули (XX) та їхні солі,



в якій

R²⁰ означає водень, вуглеводневий залишок, вуглеводнево-окисильний залишок, вуглеводнево-тіольний залишок або гетероциклічний залишок, причому останні чотири залишки є незаміщеними або заміщеними одним або більше однаковими або різними залишками з групи, що охоплює галогени, ціано, нітро, аміно, гідрокси, карбокси, форміл, карбонамід, сульфонамід та залишки формули -Z^a-R^a,

причому кожна вуглеводнева частина включає переважно від 1 до 20 атомів вуглецю та вуглецевмісний залишок R²⁰, представлений замісника-

ми, що містять переважно від 1 до 30 атомів вуглецю;

R²¹ означає водень або (C₁-C₄)алкіл, переважно водень, або R²⁰ та R²¹ разом з групою формули -CO-N- означає залишок, що містить від 3- до 8-членних насичених або ненасичених кілець;

R²² означає однаково або по-різному галоген, ціано, нітро, аміно, гідрокси, карбокси, форміл, CONH₂, SO₂NH₂ або залишок формули -Z^b-R^b;

R²³ означає водень або (C₁-C₄)алкіл, переважно H;

R²⁴ означає однаково або по-різному галоген, ціано, нітро, аміно, гідрокси, карбокси, CHO, CONH₂, SO₂NH₂ або залишок формули -Z^c-R^c;

R^a означає вуглеводневий залишок або гетероциклічний залишок, причому останні два залишки є незаміщеними або заміщеними одним або більше однаковими або різними залишками з групи, що охоплює галоген, ціано, нітро, аміно, гідрокси, моно- та ди-[(C₁-C₄)алкіл]аміно, або алкільний залишок, в якому кілька, переважно 2 або 3 несусідніх CH₂-групи відповідно замінені одним атомом кисню;

R^b, R^c є однаковими або різними та означають гетероциклічний залишок, причому кожне з двох останніх залишків є незаміщеними або заміщеними одним або більше однаковими або різними залишками з групи, що охоплює галоген, ціано, нітро, аміно, гідрокси, фосфорил, галоген-(C₁-C₄)алкокси, моно- та ди-[(C₁-C₄)алкіл]аміно, або алкільний залишок, у якому кілька, переважно 2 або 3 несусідніх CH₂-групи в кожному випадку замінені атомом кисню;

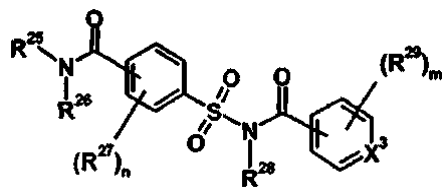
Z^a означає двовалентну групу формули -O-, -S-, -CO-, -CS-, -CO-O-, -CO-S-, -O-CO-, -S-CO-, -SO-, -SO₂-, -NR⁺-, -CO-NR⁺-, -NR⁺-CO-, -SO₂-NR⁺ або -NR⁺-SO₂-, причому праві вказані зв'язки відповідної двовалентної групи є зв'язками із залишком R^a та причому R⁺ в останніх п'яти залишках незалежно один від одного в кожному випадку означають H, (C₁-C₄)алкіл або гало-(C₁-C₄)алкіл;

Z^b, Z^c незалежно один від одного означають простий зв'язок або двовалентну групу формули -O-, -S-, -CO-, -CS-, -CO-O-, -CO-S-, -O-CO-, -S-CO-, -SO-, -SO₂-, -NR-, -SO₂-NR⁺-, -NR⁺-SO₂-, -CO-NR⁺ або -NR⁺-CO-, причому праві вказані зв'язки відповідної двовалентної групи є зв'язками із залишком R^b відповідно R^c та причому R⁺ в останніх п'яти залишках незалежно один від одного в кожному випадку означають H, (C₁-C₄)алкіл або гало-(C₁-C₄)алкіл;

n означає ціле число від 0 до 4, переважно 0, 1 або 2, зокрема, 0 або 1, та

m означає ціле число від 0 до 5, переважно 0, 1, 2 або 3, зокрема, 0, 1 або 2;

d) амід ацилсульфамойлбензойної кислоти загальної формули (XXI), при необхідності також у формі солей,



(XXI)

в яких

X³ означає CH або N;

R²⁵ означає водень, гетероцикліл або вуглеводневий залишок, причому останні два залишки при необхідності заміщені одним або більше, однаковими або різними залишками з групи, що охоплює галогени, ціано, нітро, аміно, гідрокси, карбокси, CHO, CONH₂, SO₂NH₂ та Z^a-R^a;

R²⁶ означає водень, гідрокси, (C₁-C₆)алкіл, (C₂-C₆)алкеніл, (C₂-C₆)алкініл, (C₁-C₆)алкокси, (C₂-C₆)алкенілокси, причому п'ять останніх залишків при необхідності є заміщеними одним або більше, однаковими або різними залишками з групи, що охоплює галогени, гідрокси, (C₁-C₄)алкіл, (C₁-C₄)алкокси та (C₁-C₄)Алкілтіо, або R²⁵ та R²⁶ разом з атомом азоту, до якого вони приєднані, утворюють 3- - 8-членне насичене або ненасичене кільце;

R²⁷ означає галоген, ціано, нітро, аміно, гідрокси, карбокси, CHO, CONH₂, SO₂NH₂ або Z^b-R^b;

R²⁸ означає водень, (C₁-C₄)алкіл, (C₂-C₄)алкеніл або (C₂-C₄)алкініл;

R²⁹ означає галоген, ціано, нітро, аміно, гідрокси, карбокси, фосфорил, CHO, CONH₂, SO₂NH₂ або Z^c-R^c;

R^a означає (C₂-C₂₀)алкільний залишок, вуглецевий ланцюг якого однократно або багаторазово перерваний атомами кисню, гетероцикліл або вуглеводневий залишок, причому два останні залишки при необхідності є заміщеними одним або більше, однаковими або різними залишками з групи, що охоплює галогени, ціано, нітро, аміно, гідрокси, моно- та ди-[(C₁-C₄)алкіл]аміно;

R^b, R^c означають однаково або по-різному (C₂-C₂₀)алкільний залишок, вуглецевий ланцюг якого однократно або багаторазово перерваний атомами кисню, гетероцикліл або вуглеводневий залишок, причому два останні залишки при необхідності є заміщеними одним або більше, однаковими або різними залишками з групи, що охоплює галоген, ціано, нітро, аміно, гідрокси, фосфорил, (C₁-C₄)-галоалкокси, моно- та ди-[(C₁-C₄)алкіл]аміно;

Z^a означає двовалентну одиницю з групи, що охоплює O, S, CO, CS, C(O)O, C(O)S, SO, SO₂, NR^d, C(O)NR^d або SO₂NR^d;

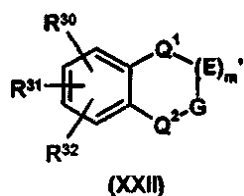
Z^b, Z^c означають однаково або по-різному простий зв'язок або двовалентну одиницю з групи, що охоплює O, S, CO, CS, C(O)O, C(O)S, SO, SO₂, NR^d, SO₂NR^d або C(O)NR^d;

R^d означає водень, (C₁-C₄)алкіл або (C₁-C₄)галоалкіл;

n означає ціле число від 0 до 4, та

m у випадку, де X означає CH, означає ціле число від 0 до 5, та у випадку, де X означає N, означає ціле число від 0 до 4;

е) Сполуки формули (XXII),



(XXII)

в якій символи та індекси мають наступні значення:

R³⁰ означає H, (C₁-C₄)алкіл, (C₁-C₄)алкіл, заміщений (C₁-C₄)алкіл-X⁴ або (C₁-C₄)галоалкіл-X⁴, (C₁-C₄)галоалкіл, NO₂, CN, -COO-R³³, NR₂³⁴, SO₂NR₂³⁵ або CONR₂³⁶;

R³¹ означає H, галоген, (C₁-C₄)алкіл, CF₃, (C₁-C₄)алкокси або (C₁-C₄)галоалкокси;

R³² означає H, галоген або (C₁-C₄)алкіл;

Q¹, Q², E, G є однаковими або різними і означають -O-, -S-, -CR₂³⁷-, -CO-, NR³⁸- або групу формули (XXIII),



(XXIII)

за умови, що

щонайменше одна з груп Q¹, Q², E, G означає карбонільну групу, точно одна з цих груп означає залишок формули (XXIII) та група формули (XXIII) є сусідньою з карбонільною групою, та дві сусідні групи Q¹, Q², E та G не можуть одночасно означати кисень;

R^a означає однаково або по-різному H або (C₁-C₈)алкіл або обидва залишки R^a разом означають (C₂-C₆)алкілен;

A означають R^b-Y³- або -NR₂³⁵;

X⁴ означає -O- або -S(O)_p;

Y³ означає -O- або -S-;

R^b означає H, (C₁-C₈)алкіл, (C₁-C₈)галоалкіл, (C₁-C₄)алкокси-(C₁-C₈)алкіл, (C₃-C₆)-алкенілокси-(C₁-C₈)алкіл, або феніл-(C₁-C₈)алкіл, причому фенільне кільце при необхідності заміщене галогеном, (C₃-C₆)алкіл, CF₃, метокси або метил-S(O)_p; (C₃-C₆)алкеніл, (C₃-C₆)галоалкеніл, феніл-(C₃-C₆)алкеніл, (C₃-C₆)алкініл, феніл-(C₃-C₆)алкініл, оксетаніл, фурфуріл, тетрагідрофуріл;

R³³ означає H або (C₁-C₄)алкіл;

R³⁴ однаково чи по-різному означає H, (C₁-C₄)алкіл, (C₁-C₄)алкілкарбоніл або обидва залишки R³⁴ разом означають (C₄-C₅)алкілен;

R³⁵, R³⁶ незалежно один від одного означають в кожному випадку однаково або по-різному H, (C₁-C₄)алкіл, або обидва залишки R³⁵ та/або R³⁶ разом означають (C₄-C₅)алкілен, причому CH₂-група може бути заміщена O або S або одна або дві CH₂-групи можуть бути заміщені -NR^c-;

R^c означає H або (C₁-C₄)алкіл;

R³⁷ однаково або по-різному означає H, (C₁-C₈)алкіл або обидва залишки R³⁷ разом означають (C₂-C₆)алкілен;

R³⁸ означає H, (C₁-C₈)алкіл, заміщений або незаміщений феніл, або незаміщений або заміщений фенільним кільцем бензил;

R³⁹ однаково або по-різному означає H, (C₁-C₈)алкіл, феніл, феніл-(C₁-C₈)алкіл, причому фе-

нільне кільце може бути заміщене F, Cl, Br, NO₂, CN, OCH₃, (C₁-C₄)алкіл або CH₃SO₂; (C₁-C₄)алкокси-(C₁-C₈)алкіл, (C₃-C₆)алкеніл, (C₃-C₆)алкініл, (C₃-C₆)циклоалкіл або два залишки R³⁹ разом означають (C₄-C₅)алкілен, причому одна CH₂-група може бути заміщена O або S або одна чи дві CH₂-групи можуть бути заміщені -NR^d;

R^d означає H або (C₁-C₄)алкіл;

m" означає 0 або та р означає 0, 1 або 2;

включаючи стереоізмери та солі, що застосовуються у сільському господарстві.

Для застосування наявні у комерційно доступній формі композиції при необхідності розріджуються у звичайний спосіб за допомогою води, як наприклад, порошки для змочування, емульсійні концентрати, дисперсії та дисперговані у воді грануляти, препарати для розпилення, грануляти для нанесення на ґрунт та розсипання, так само, як і розпилювані розчини перед застосуванням більше не розріджуються у звичайний спосіб іншими інертними речовинами.

Необхідна кількість сполуки згідно з винаходом змінюється в залежності від зовнішніх умов, таких як температура, вологість, вид застосовуваного гербіциду. Кількість діючої речовини може коливатися в межах, наприклад, від 0,001 до 10,0 кг/га або більше, переважно від 0,005 до 5 кг/га.

Приклади

А. Приклади синтезу

Приклад А1

N-(трет-бутил)-2-метоксибензолсульфонамід

До 30,00г розчину (145,17ммоль) хлориду 2-метоксибензолсульфоновної кислоти у 150мл дихлорметану при 5-10°C додають 22,30г (304,87ммоль) краплями трет-бутиламін. Після цього здійснюють перемішування протягом 2 годин при кімнатній температурі. Після екстракції з водою органічну фазу над сульфатом натрію висушують та випаровують до сухого залишку. Таким чином отримують 31,10г (88% від теор.) N-(трет-бутил)-2-метоксибензолсульфонамід.

¹H-ЯМР (CDCl₃): 7,91 дд, J=1,7, 7,8, 1H); 7,50 (м, 1H); 7,03 (м, 2H); 4,93 (шс, 1H); 3,98 (с, 3H); 1,17 (с, 9H).

Приклад А2

N-(трет-бутил)-2-йодо-6-

метоксибензолсульфонамід (Приклад-№2.092b)

Розчин 30,00г (123,29ммоль) N-(трет-бутил)-2-метоксибензолсульфонамід у 400мл тетрагідрофурану охолоджують до -70°C та повільно змішують з 110,96мл (277,41ммоль) 2,5 молярного розчину бутиллітію у ТГФ. Після чого розчин нагрівають швидко до -30°C та знову охолоджують до -60°C. При цій температурі в розчин додають краплями 31,29г (123,29ммоль) йоду у 200мл тетрагідрофурану. Після цього реакційну суміш протягом ночі перемішують при кімнатній температурі. Після екстракції з водою органічну фазу висушують над сульфатом натрію та випаровують до сухого залишку. Таким чином отримують 42,40г (93% від теор.) N-(трет-бутил)-2-йодо-6-метоксибензолсульфонамід.

Приклад А3

2-йодо-6-метоксибензолсульфонамід (Приклад-№2.092a)

42,40г (114,84ммоль) N-(трет-бутил)-2-йодо-6-метоксибензолсульфонамід розмішують у 265мл трифтороцтової кислоти протягом 3 годин при кімнатній температурі. Після того реакційну суміш наливають на льодяну воду, фільтрують конденсат та промивають нейтральною водою. Таким чином отримують 32,40г (90% від теор.) 2-йодо-6-метоксибензол-сульфонамід.

Приклад А4

N-[[[4,6-диметоксипіримідин-2-

ил)аміно]карбоніл]-2-йодо-6-

метоксибензолсульфонамід (Приклад-№1.146)

Розчин 200мг (0,64ммоль) 2-йодо-6-метоксибензолсульфонамід у 3мл ацетонітрилу спочатку змішують при кімнатній температурі з 316,49мг (1,15ммоль) фенілестеру N-(4,6-диметоксипіримідин-2-ил)карбаїнової кислоти, а після того повільно додають 0,19мл (1,28ммоль) 1,8-діазабіцикло[5.4.0]ундец-7-ену. Після 30 хвилин помішування при кімнатній температурі розчинники 2N сольового розчину настроюють до pH 1. Відбирають виключно тверду речовину, потім промивають водою та висушують. Таким чином отримують 242мг (77% від теор.) N-[[[4,6-диметоксипіримідин-2-ил)аміно]карбоніл]-2-йодо-6-метоксибензолсульфонамід.

Приклад А5

2-гідрокси-6-йодобензолсульфонамід (Приклад-№2.300a)

0,50г (1,60ммоль) 2-йодо-6-метоксибензолсульфонамід додають до 10мл дихлорметану при кімнатній температурі та обережно змішують з 0,6г (2,40ммоль) бортрибромідом. Реакційний розчин розмішують протягом наступних 45хв при кімнатній температурі та потім поміщають у 2N соляну кислоту. Після екстракції з дихлорметаном органічну фазу висушують та випаровують. Таким чином отримують 0,43г (90% від теор.) 2-гідрокси-6-йодобензолсульфонамід.

Приклад А6

2-йодо-6-пропоксибензолсульфонамід (Приклад №2.095a)

5,00г (16,72ммоль) 2-гідрокси-6-йодобензолсульфонамід додають до 50мл диметилформамід у 2,54г (18,39ммоль) карбонату калію. Цю суміш мішають протягом 1 години при кімнатній температурі. Потім додають по краплях 3,13г (18,39ммоль) пропіліюдиду та реакційну суміш протягом трьох годин мішають при кімнатній температурі. Потім наливають на воду, причому продукт випадає в осад. Тверда речовина промивається водою та висушується. Таким чином отримують 4,00г (70% від теор.) 2-йодо-6-пропоксибензолсульфонамід.

Приклад А7

N-(трет-бутил)-2-фторо-6-

йодобензолсульфонамід (Приклад №2.001b)

30г (0,13ммоль) (N-трет-бутил)-2-фторобензолсульфонамід, отриманого внаслідок реакції взаємодії хлориду 2-фторобензолсульфоновної кислоти із N-трет-бутиламіном аналогічно до прикладу А1, додається до 300мл сухого тетрагідрофурану. Розчин охолоджують до -70°C та по краплях додають розчин 18,28г (0,285ммоль) н-бутиллітію (2,5 молярний у тетрагідрофурані). Після цього реакційний розчин

протягом 30 хвилин нагрівають до -30°C і знову охолоджують до -70°C . Потім 36,21г (0,143моль) йоду по краплях додають до 200мл сухого тетрагідрофурану. Після додавання реакційний розчин повільно нагрівають до кімнатної температури та протягом 12 годин мішають. Після того, розчин промивають 50%-процентним водним розчином натрій тіосульфату водою. Органічну фазу висушують та випаровують. Таким чином отримують 40,8г (88% від теор.) N-(трет-бутил)-2-фторо-6-йодобензолсульфонамід.

Приклад А8

2-(2,2-дифторетокси)-6-йодобензолсульфонамід (приклад-номер 2.187а)

0,64г (26,57ммоль) гідриду натрію додають до 10мл сухого тетрагідрофурану і повільно змішують при кімнатній температурі із 2,18г (26,57ммоль) 2,2-дифторетанолу. Реакційну мішають суміш до кінця утворення газу при кімнатній температурі. Після того 4,00г (13,29ммоль) 2-фтор-6-йодобензолсульфонамід, отриманого шляхом реакції N-(трет-бутил)-2-фторо-6-йодобензолсульфонамід з трифтороцтовою кислотою аналогічно до прикладу А3, вкrapують і розчиняють у 20мл сухого тетрагідрофурану. Цю реакційну суміш піддають впливу 100Ват мікрохвильової енергії протягом 30 хвилин при 150°C . Після цього поміщають у 2N соляної кислоти із рН 4-5 та у воду/етилацетат, органічна фаза висушується та випаровується. Отримують 3,00г (62% від теор.) 2-(2,2-дифторетокси)-6-йодобензолсульфонамід.

Приклад А9

2-йодо-6-(метилтіо)бензолсульфонамід (Приклад номер 2.208а)

30,00г (99,64ммоль) 2-фторо-6-йодобензолсульфонамід, отриманого шляхом реакції N-(трет-бутил)-2-фторо-6-йодобензолсульфонамід з трифтороцтовою кислотою аналогічно до прикладу А3, змішують із 15,15г (109,61ммоль) карбонату калію у 250мл диметилформамід. При кімнатній температурі додають порціями 7,68г (109,61ммоль) натрійтіометилату, після чого протягом 12 годин мішають при кімнатній температурі. Реакційну суміш наливають на 150мл льодяної води, змішують із 2N соляної кислоти із рН 4-5 та екстрагують із етилацетатом. Органічну фазу висушують та випаровують. Препаративне HPLC (реверсивна фаза, 0,05% трифтороцтової кислоти у воді/ ацетонітрил, градієнт: 30 хвилин, від 25 до 100% ацетонітрилу) отримують 7,40г (23% від теор.) 2-йодо-6-(метилтіо)бензолсульфонамід.

У таблицях один і два вказані сполуки, які отримуються шляхом аналогічних дій, як у вищезазначених прикладах А1-А9.

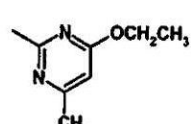
Скорочення у наступних таблицях 1 та 2:

* = ^1H -ЯМР дані наступної таблиці 1 відповідають даним таблиці 2

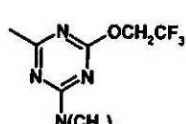
Me = метил

Ph = феніл

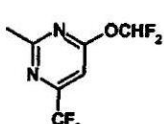
Het = гетероцикл, причому Het для кожного з наступних залишків означає від Н1 до Н23



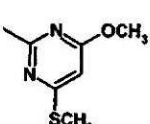
H4



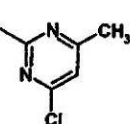
48



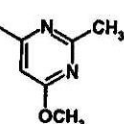
413



H18



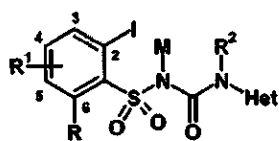
420



H23

Таблиця 1

Сполуки загальної формули (1-а)



(1-a)

	R	R ¹	R ²	M	Het	¹ H-ЯМР
1.001	F	-	H	H	H1	*
1.002	F	-	H	H	H2	*
1.003	F	-	H	H	H5	*
1.004	F	-	H	H	H6	*
1.005		-	H	H	H7	
1.006	Br	-	H	H	H1	
1.007	Br	-	H	H	H2	
1.008	Br	-	H	H	H6	
1.009	I	-	H	H	H1	
1.010	I	-	H	H	H2	
1.011	I	-	H	H	H6	
1.012	CH ₃	-	H	H	H1	*
1.013	CH ₃	-	H	Na	H1	
1.014	CH ₃	5-CH ₃	H	H	H1	
1.015	CH ₃	-	CH ₃	H	H1	
1.016	CH ₃	-	H	H	H2	*
1.017	CH ₃	-	H	Na	H2	
1.018	CH ₃	5-CH ₃	H	H	H2	
1.019	CH ₃	-	CH ₃	H	H2	
1.020	CH ₃	-	H	H	H5	*
1.021	CH ₃	-	H	H	H6	*

	R	R ¹	R ²	M	Het	¹ H-ЯМР
1.022	CH ₃	-	H	Na	H6	
1.023	CH ₃	5-CH ₃	H	H	H6	
1.024	CH ₃	-	CH ₃	H	H6	
1.025	CH ₃	-	H	H	H7	*
1.026	CH ₂ CH ₃	-	H	H	H1	
1.027	CH ₂ CH ₃	-	H	H	H2	
1.028	(CH ₂) ₂ CH ₃	-	H	H	H1	
1.029	(CH ₂) ₂ CH ₃	-	H	H	H2	
1.030	CH(CH ₃) ₂	-	H	H	H1	
1.031	CH(CH ₃) ₂	-	H	H	H2	
1.032	(CH ₂) ₃ CH ₃	-	H	H	H1	
1.033	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃	-	H	H	H1	
1.034	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-	H	H	H1	
1.035	C(CH ₃) ₃	-	H	H	H1	
1.036	CH≡CH ₂	-	H	H	H1	
1.037	CH=CH ₂	-	H	H	H2	
1.038	C(CH ₃)=CH ₂	-	H	H	H1	
1.039	C≡CH	-	H	H	H1	
1.040	C≡CH	-	H	H	H2	
1.041	C≡CCH ₃	-	H	H	H1	
1.042	C≡CCn ₂ CH ₃	-	H	H	H1	
1.043	CH ₂ CH=CH ₂	-	H	H	H1	
1.044	CH ₂ C(CH ₃)=CH ₂	-	H	H	H1	
1.045	CH ₂ C≡CH	-	H	H	H1	
1.046	CH ₂ C≡CCH ₃	-	H	H	H1	
1.047	CH ₂ C≡CCH ₂ CH ₃	-	H	H	H1	
1.048	циклопропіл	-	H	H	H1	
1.049	циклопропіл	-	H	H	H2	
1.050	2,2-ди-Ф-циклопропіл	-	H	H	H1	
1.051	2,2-ди-Ф-циклопропіл	-	H	H	H2	

	R	R ¹	R ²	M	Het	¹ H-ЯМР
1.052	2,2-ди-Cl-циклопропіл	-	H	H	H1	
1.053	2,2-ди-CH ₃ -циклопропіл	-	H	H	H1	
1.054	циклобутил	-	H	H	H1	
1.055	циклопентил	-	H	H	H1	
1.056	циклогексил	-	H	H	H1	
1.057	CH ₂ циклопропіл	-	H	H	H1	
1.058	CH ₂ циклобутил	-	H	H	H1	
1.059	CH ₂ циклопентил	-	H	H	H1	
1.060	CH ₂ циклогексил	-	H	H	H1	
1.061	CH ₂ OCH ₃	-	H	H	H1	
1.062	CH ₂ OCH ₂ CH ₃	-	H	H	H1	
1.063	CH(CH ₃)OCH ₃	-	H	H	H1	
1.064	Ph	-	H	H	H1	
1.065	Ph	-	H	H	H2	
1.066	2-F-Ph	-	H	H	H1	
1.067	3-F-Ph	-	H	H	H1	
1.068	4-F-Ph	-	H	H	H1	
1.069	2,6-ди-F-Ph	-	H	H	H1	
1.070	2,4-ди-F-Ph	-	H	H	H1	
1.071	2-Cl-Ph	-	H	H	H1	
1.072	3-Cl-Ph	-	H	H	H1	
1.073	4-Cl-Ph	-	H	H	H1	
1.074	2,6-ди-Cl-Ph	-	H	H	H1	
1.075	2,4-ди-Cl-Ph	-	H	H	H1	
1.076	2-МеО-Ph	-	H	H	H1	
1.077	3-МеО-Ph	-	H	H	H1	
1.078	4-МеО-Ph	-	H	H	H1	
1.079	2,4-ди-МеО-Ph	-	H	H	H1	
1.080	2-Ме-Ph	-	H	H	H1	
1.081	3-Ме-Ph	-	H	H	H1	

	R	R ¹	R ²	M	Het	¹ H-ЯМР
1.082	4-Me-Ph	-	H	H	H1	
1.083	2-CF ₃ -Ph	-	H	H	H1	
1.084	3-CF ₃ -Ph	-	H	H	H1	
1.085	4-CF ₃ -Ph	-	H	H	H1	
1.086	CH ₂ Ph	-	H	H	H1	
1.087	CH ₂ -2-F-Ph	-	H	H	H1	
1.088	CH ₂ -2,4-ди-F-Ph	-	H	H	H1	
1.089	CH ₂ -2-MeO-Ph	-	H	H	H1	
1.090	CH ₂ -3-MeO-Ph	-	H	H	H1	
1.091	CF ₃	-	H	H	H1	*
1.092	CF ₃	-	H	Na	H1	
1.093	CF ₃	5-CH ₃	H	H	H1	
1.094	CF ₃	-	CH ₃	H	H1	
1.095	CF ₃	-	H	H	H2	*
1.096	CF ₃	-	H	Na	H2	
1.097	CF ₃	5-CH ₃	H	H	H2	
1.098	CF ₃	-	CH ₃	H	H2	
1.099	CF ₃	-	H	H	H5	*
1.100	CF ₃	-	H	H	H6	*
1.101	CF ₃	-	H	Na	H6	
1.102	CF ₃	5-CH ₃	H	H	H6	
1.103	CF ₃	-	CH ₃	H	H6	
1.104	CF ₃	-	H	H	H7	*
1.105	CF ₃	-	H	H	H10	
1.106	CF ₃	-	H	H	H11	
1.107	CF ₃	-	H	H	H12	
1.108	CF ₃	-	H	H	H13	
1.109	CHF ₂	-	H	H	H1	
1.110	CHF ₂	-	H	H	H2	
1.111	CHF ₂	-	H	H	H6	

	R	R ¹	R ²	M	Het	¹ H-ЯМР
1.112	CH ₂ F	-	H	H	H1	
1.113	CH ₂ CF ₃	-	H	H	H1	
1.114	CH ₂ CHF ₂	-	H	H	H1	
1.115	CH ₂ CH ₂ F	-	H	H	H1	
1.116	CF=CH ₂	-	H	H	H1	
1.117	CH=CF ₂	-	H	H	H1	
1.118	CF ₂ CH=CH ₂	-	H	H	H1	
1.119	CH=CH-CF ₃	-	H	H	H1	
1.120	CHFCH=CH ₂	-	H	H	H1	
1.121	CN	-	H	H	H1	
1.122	CN	-	H	H	H2	
1.123	NO ₂	-	H	H	H1	
1.124	NH ₂	-	H	H	H1	
1.125	NHCH ₃	-	H	H	H1	
1.126	N(CH ₃) ₂	-	H	H	H1	
1.127	N(CH ₃)CH ₂ CH=CH ₂	-	H	H	H1	
1.128	N(CH ₃)CH ₂ C≡CH	-	H	H	H1	
1.129	NH-циклопропіл	-	H	H	H1	
1.130	N(CH ₃)-циклопропіл	-	H	H	H1	
1.131	N(CH ₂ CH ₃)-циклопропіл	-	H	H	H1	
1.132	NHC(O)H	-	H	H	H1	
1.133	NHC(O)H	-	H	H	H2	
1.134	NHC(O)CH ₃	-	H	H	H1	
1.135	NHC(O)CH ₃	-	H	H	H2	
1.136	NHC(O)OCH ₃	-	H	H	H1	
1.137	NHC(O)OCH ₃	-	H	H	H2	
1.138	NHSO ₂ CH ₃	-	H	H	H1	
1.139	NHSO ₂ CH ₃	-	H	H	H2	
1.140	NHSO ₂ CF ₃	-	H	H	H1	
1.141	NHSO ₂ CF ₃	-	H	H	H2	

	R	R ¹	R ²	M	Het	¹ H-ЯMP
1.142	NHSO ₂ CHF ₂	-	H	H	H1	
1.143	NHSO ₂ CHF ₂	-	H	H	H2	
1.144	NHSO ₂ CH ₂ F	-	H	H	H1	
1.145	OH	-	H	H	H1	
1.146	OCH ₃	-	H	H	H1	*
1.147	OCH ₃	-	H	Na	H1	
1.148	OCH ₃	5-CH ₃	H	H	H1	
1.149	OCH ₃	-	CH ₃	H	H1	
1.150	OCH ₃	-	H	H	H2	*
1.151	OCH ₃	-	H	Na	H2	
1.152	OCH ₃	5-CH ₃	H	H	H2	
1.153	OCH ₃	-	CH ₃	H	H2	
1.154	OCH ₃	-	H	H	H5	*
1.155	OCH ₃	-	H	H	H6	*
1.156	OCH ₃	-	H	Na	H6	
1.157	OCH ₃	5-CH ₃	H	H	H6	
1.158	OCH ₃	-	CH ₃	H	H6	
1.159	OCH ₃	-	H	H	H7	*
1.160	OCH ₃	-	H	H	H10	
1.161	OCH ₃	-	H	H	H11	
1.162	OCH ₃	-	H	H	H12	
1.163	OCH ₃	-	H	H	H13	
1.164	OCH ₂ CH ₃	-	H	H	H1	*
1.165	OCH ₂ CH ₃	-	H	H	H2	*
1.166	OCH ₂ CH ₃	-	H	H	H5	*
1.167	OCH ₂ CH ₃	-	H	H	H6	*
1.168	OCH ₂ CH ₃	-	H	H	H7	*
1.169	OCH ₂ CH ₃	-	H	H	H10	
1.170	OCH ₂ CH ₃	-	H	H	H11	
1.171	O(CH ₂) ₂ CH ₃	-	H	H	H1	*

	R	R ¹	R ²	M	Het	¹ H-ЯМР
1.172	O(CH ₂) ₂ CH ₃	-	H	H	H2	
1.173	O(CH ₂) ₂ CH ₃	-	H	H	H5	*
1.174	O(CH ₂) ₂ CH ₃	-	H	H	H6	*
1.175	O(CH ₂) ₂ CH ₃	-	H	H	H7	*
1.176	O(CH ₂) ₂ CH ₃	-	H	H	H10	
1.177	O(CH ₂) ₂ CH ₃	-	H	H	H11	
1.178	OCH(CH ₃) ₂	-	H	H	H1	*
1.179	OCH(CH ₃) ₂	-	H	Na	H1	
1.180	OCH(CH ₃) ₂	5-CH ₃	H	H	H1	
1.181	OCH(CH ₃) ₂	-	CH ₃	H	H1	
1.182	OCH(CH ₃) ₂	-	H	H	H2	*
1.183	OCH(CH ₃) ₂	-	H	Na	H2	
1.184	OCH(CH ₃) ₂	5-CH ₃	H	H	H2	
1.185	OCH(CH ₃) ₂	-	CH ₃	H	H2	
1.186	OCH(CH ₃) ₂	-	H	H	H5	*
1.187	OCH(CH ₃) ₂	-	H	H	H6	*
1.188	OCH(CH ₃) ₂	-	H	Na	H6	
1.189	OCH(CH ₃) ₂	5-CH ₃	H	H	H6	
1.190	OCH(CH ₃) ₂	-	CH ₃	H	H6	
1.191	OCH(CH ₃) ₂	-	H	H	H7	*
1.192	O(CH ₂) ₃ CH ₃	-	H	H	H1	*
1.193	O(CH ₂) ₃ CH ₃	-	H	H	H10	
1.194	O(CH ₂) ₃ CH ₃	-	H	H	H11	
1.195	O(CH ₂) ₃ CH ₃	-	H	H	H12	
1.196	OCH(CH ₃)CH ₂ CH ₃	-	H	H	H1	*
1.197	OCH ₂ CH(CH ₃) ₂	-	H	H	H1	*
1.198	OC(CH ₃) ₃	-	H	H	H1	
1.199	OC(CH ₃) ₃	-	H	H	H2	
1.200	OCH=CH ₂	-	H	H	H1	
1.201	OC(CH ₃)=CH ₂	-	H	H	H1	

	R	R ¹	R ²	M	Het	H-ЯМР
1.202	$\text{OCH}=\text{CH}(\text{CH}_3)$	-	H	H	H1	
1.203	$\text{OCH}=\text{C}(\text{CH}_3)_2$	-	H	H	H1	
1.204	$\text{OC}(\text{CH}_3)=\text{CHCH}_3$	-	H	H	H1	
1.205	$\text{OC}(\text{CH}_3)=\text{C}(\text{CH}_3)_2$	-	H	H	H1	
1.206	$\text{OC}\equiv\text{CH}$	-	H	H	H1	
1.207	$\text{OC}\equiv\text{CCH}_3$	-	H	H	H1	
1.208	$\text{OC}\equiv\text{CCH}_2\text{CH}_3$	-	H	H	H1	
1.209	$\text{OCH}_2\text{CH}=\text{CH}_2$	-	H	H	H1	
1.210	$\text{OCH}_2\text{CH}=\text{CH}_2$	-	H	H	H2	
1.211	$\text{OCH}_2\text{C}(\text{CH}_3)=\text{CH}_2$	-	H	H	H1	
1.212	$\text{OCH}_2\text{CH}=\text{CHCH}_3$	-	H	H	H1	
1.213	$\text{OCH}_2\text{CH}=\text{C}(\text{CH}_3)_2$	-	H	H	H1	
1.214	$\text{OCH}_2\text{C}(\text{CH}_3)=\text{CHCH}_3$	-	H	H	H1	
1.215	$\text{OCH}_2\text{C}(\text{CH}_3)=\text{C}(\text{CH}_3)_2$	-	H	H	H1	
1.216	$\text{OCH}(\text{CH}_3)\text{CH}=\text{CH}_2$	-	H	H	H1	
1.217	$\text{OCH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$	-	H	H	H1	
1.218	$\text{OCH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$	-	H	H	H2	
1.219	$\text{OCH}_2\text{C}\equiv\text{CCH}_3$	-	H	H	H1	
1.220	$\text{OCH}_2\text{C}\equiv\text{CCH}_2\text{CH}_3$	-	H	H	H1	
1.221	$\text{OCH}(\text{CH}_3)\text{C}\equiv\text{CH}$	-	H	H	H1	
1.222	О-циклопропіл	-	H	H	H1	
1.223	О-циклопропіл	-	H	H	H2	
1.224	О-2,2-ди-СІ-циклопропіл	-	H	H	H1	
1.225	О-2,2-ди-F-циклопропіл	-	H	H	H1	
1.226	О-циклобутил	-	H	H	H1	
1.227	О-циклопентил	-	H	H	H1	
1.228	О-циклогексил	-	H	H	H1	
1.229	OCH_2 -циклопропіл	-	H	H	H1	*
1.230	OCH_2 -циклопропіл	-	H	Na	H1	
1.231	OCH_2 -циклопропіл	5- CH_3	H	H	H1	
1.232	OCH_2 -циклопропіл	-	CH_3	H	H1	
1.233	OCH_2 -циклопропіл	-	H	H	H2	*

	R	R ¹	R ²	M	Het	'H-ЯМР
1.234	ОСН ₂ -циклопропіл	-	H	Na	H2	
1.235	ОСН ₂ -циклопропіл	5-CH ₃	H	H	H2	
1.236	ОСН ₂ -циклопропіл	-	CH ₃	H	H2	
1.237	ОСН ₂ -циклопропіл	-	H	H	H5	*
1.238	ОСН ₂ -циклопропіл	-	H	H	H6	*
1.239	ОСН ₂ -циклопропіл	-	H	Na	H6	
1.240	ОСН ₂ -циклопропіл	5-CH ₃	H	H	H6	
1.241	ОСН ₂ -циклопропіл	-	CH ₃	H	H6	
1.242	ОСН ₂ -циклопропіл	-	H	H	H7	*
1.243	ОСН ₂ -циклопропіл	-	H	H	H10	
1.244	ОСН ₂ -циклопропіл	-	H	H	H11	
1.245	ОСН ₂ -циклопропіл	-	H	H	H12	
1.246	ОСН ₂ -циклопропіл	-	H	H	H13	
1.247	ОСН(CH ₃)-циклопропіл	-	H	H	H1	
1.248	ОСН(CH ₃)-циклопропіл	-	H	H	H2	
1.249	ОСН ₂ -2-Ме-циклопропіл	-	H	H	H1	
1.250	ОСН ₂ -2,2-ди-Ме-циклопропіл	-	H	H	H1	
1.251	ОСН ₂ -2,2-ди-Cl-циклопропіл	-	H	H	H1	
1.252	ОСН ₂ -2,2-ди-F-циклопропіл	-	H	H	H1	
1.253	ОСН ₂ -циклобутил	-	H	H	H1	
1.254	ОСН ₂ -циклопентил	-	H	H	H1	
1.255	ОСН(CH ₃)-циклопентил	-	H	H	H1	
1.256	ОСН ₂ -циклогексил	-	H	H	H1	
1.257	ОСН(CH ₃)-циклогексил	-	H	H	H1	
1.258	ОСН ₂ ОСН ₃	-	H	H	H1	
1.259	O(CH ₂) ₂ ОСН ₃	-	H	H	H1	
1.260	ОСН ₂ ОСН ₂ СН ₃	-	H	H	H1	
1.261	O(CH ₂) ₂ ОСН ₂ СН ₃	-	H	H	H1	

	R	R ¹	R ²	M	Het	H-ЯМР
1.262	OCH(CH ₃)OCH ₃	-	H	H	H1	
1.263	OPh	-	H	H	H1	
1.264	OPh	-	H	H	H2	
1.265	O-2-F-Ph	-	H	H	H1	
1.266	O-3-F-Ph	-	H	H	H1	
1.267	O-4-F-Ph	-	H	H	H1	
1.268	O-2,6-ди-F-Ph	-	H	H	H1	
1.269	O-2,4-ди-F-Ph	-	H	H	H1	
1.270	O-2-Cl-Ph	-	H	H	H1	
1.271	O-3-Cl-Ph	-	H	H	H1	
1.272	O-4-Cl-Ph	-	H	H	H1	
1.273	O-2,6-ди-Cl-Ph	-	H	H	H1	
1.274	O-2,4-ди-Cl-Ph	-	H	H	H1	
1.275	O-2-CF ₃ -Ph	-	H	H	H1	
1.276	O-3-CF ₃ -Ph	-	H	H	H1	
1.277	O-4-CF ₃ -Ph	-	H	H	H1	
1.278	O-2-MeO-Ph	-	H	H	H1	
1.279	O-3-MeO-Ph	-	H	H	H1	
1.280	O-4-MeO-Ph	-	H	H	H1	
1.281	O-2,4-ди-MeO-Ph	-	H	H	H1	
1.282	O-2-Me-Ph	-	H	H	H1	
1.283	O-3-Me-Ph	-	H	H	H1	
1.284	O-4-Me-Ph	-	H	H	H1	
1.285	OCH ₂ Ph	-	H	H	H1	
1.286	OCH ₂ Ph	-	H	H	H2	
1.287	OCH(CH ₃)Ph	-	H	H	H1	
1.288	OCH ₂ -2-F-Ph	-	H	H	H1	
1.289	OCH ₂ -3-F-Ph	-	H	H	H1	
1.290	OCH ₂ -4-F-Ph	-	H	H	H1	
1.291	OCH ₂ -2,4-ди-F-Ph	-	H	H	H1	

	R	R ¹	R ²	M	Het	¹ H-ЯМР
1.292	OCH ₂ -2-Cl-Ph	-	H	H	H1	
1.293	OCH ₂ -3-Cl-Ph	-	H	H	H1	
1.294	OCH ₂ -4-Cl-Ph	-	H	H	H1	
1.295	OCH ₂ -2,4-ди-Cl-Ph	-	H	H	H1	
1.296	OCH ₂ -2-MeO-Ph	-	H	H	H1	
1.297	OCH ₂ -3-MeO-Ph	-	H	H	H1	
1.298	OCH ₂ -4-MeO-Ph	-	H	H	H1	
1.299	OCH ₂ -2-CF ₃ -Ph	-	H	H	H1	
1.300	OCH ₂ -3-CF ₃ -Ph	-	H	H	H1	
1.301	OCH ₂ -4-CF ₃ -Ph	-	H	H	H1	
1.302	OCF ₃	-	H	H	H1	*
1.303	OCF ₃	-	H	Na	H1	
1.304	OCF ₃	5-CH ₃	H	H	H1	
1.305	OCF ₃	-	CH ₃	H	H1	
1.306	OCF ₃	-	H	H	H2	*
1.307	OCF ₃	-	H	Na	H2	
1.308	OCF ₃	5-CH ₃	H	H	H2	
1.309	OCF ₃	-	CH ₃	H	H2	
1.310	OCF ₃	-	H	H	H5	*
1.311	OCF ₃	-	H	H	H6	*
1.312	OCF ₃	-	H	Na	H6	
1.313	OCF ₃	5-CH ₃	H	H	H6	
1.314	OCF ₃	-	CH ₃	H	H6	
1.315	OCF ₃	-	H	H	H7	*
1.316	OCF ₃	-	H	H	H3	
1.317	OCF ₃	-	H	H	H10	
1.318	OCF ₃	-	H	H	H11	
1.319	OCF ₃	-	H	H	H12	
1.320	OCF ₃	-	H	H	H13	
1.321	OCHF ₂	-	H	H	H1	*

	R	R ¹	R ²	M	Het	¹ H-NMR
1.322	OCHF ₂	-	H	Na	H1	
1.323	OCHF ₂	5-CH ₃	H	H	H1	
1.324	OCHF ₂	-	CH ₃	H	H1	
1.325	OCHF ₂	-	H	H	H2	*
1.326	OCHF ₂	-	H	Na	H2	
1.327	OCHF ₂	5-CH ₃	H	H	H2	
1.328	OCHF ₂	-	CH ₃	H	H2	
1.329	OCHF ₂	-	H	H	H5	*
1.330	OCHF ₂	-	H	H	H6	*
1.331	OCHF ₂	-	H	Na	H6	
1.332	OCHF ₂	5-CH ₃	H	H	H6	
1.333	OCHF ₂	-	CH ₃	H	H6	
1.334	OCHF ₂	-	H	H	H7	
1.335	OCH ₂ F	-	H	H	H1	
1.336	OCH ₂ F	-	H	H	H3	
1.337	OCH ₂ F	-	H	H	H10	
1.338	OCH ₂ F	-	H	H	H11	
1.339	OCH ₂ F	-	H	H	H12	
1.340	OCH ₂ F	-	H	H	H13	
1.341	OCH ₂ CF ₃	-	H	H	H1	
1.342	OCH ₂ CF ₃	-	H	H	H2	*
1.343	OCH ₂ CF ₃	-	H	H	H5	*
1.344	OCH ₂ CF ₃	-	H	H	H6	*
1.345	OCH ₂ CF ₃	-	H	H	H7	
1.346	OCH ₂ CF ₃	-	H	H	H3	
1.347	OCH ₂ CF ₃	-	H	H	H10	
1.348	OCH ₂ CF ₃	-	H	H	H11	
1.349	OCH ₂ CF ₃	-	H	H	H12	
1.350	OCH ₂ CF ₃	-	H	H	H13	
1.351	OCH ₂ CHF ₂	-	H	H	H1	
1.352	OCH ₂ CHF ₂	-	H	H	H2	*
1.353	OCH ₂ CHF ₂	-	H	H	H5	*

	R	R ¹	R ²	M	Het	¹ H-RMP
1.354	OCH ₂ CHF ₂	-	H	H	H6	*
1.355	OCH ₂ CHF ₂	-	H	H	H7	*
1.356	OCH ₂ CH ₂ F	-	H	H	H1	
1.357	OCH ₂ CH ₂ F	-	H	H	H3	
1.358	OCH ₂ CH ₂ F	-	H	H	H10	
1.359	OCH ₂ CH ₂ F	-	H	H	H11	
1.360	OCH ₂ CH ₂ F	-	H	H	H12	
1.361	OCH ₂ CH ₂ F	-	H	H	H13	
1.362	OCH(CH ₃)CF ₃	-	H	H	H1	*
1.363	OCH(CH ₃)CF ₃	-	H	H	H2	*
1.364	OCH(CH ₃)CF ₃	-	H	H	H5	*
1.365	OCH(CH ₃)CF ₃	-	H	H	H6	*
1.366	OCH(CH ₃)CF ₃	-	H	H	H7	*
1.367	OCH(CH ₃)CHF ₂	-	H	H	H1	
1.368	OCH(CH ₃)CH ₂ F	-	H	H	H1	
1.369	OCH ₂ CF ₂ CF ₃	-	H	H	H1	
1.370	OCH ₂ CF ₂ CF ₃	-	H	H	H2	*
1.371	OCH ₂ CF ₂ CF ₃	-	H	H	H5	*
1.372	OCH ₂ CF ₂ CF ₃	-	H	H	H6	*
1.373	OCH ₂ CF ₂ CF ₃	-	H	H	H7	*
1.374	OCH ₂ CF ₂ CHF ₂	-	H	H	H1	
1.375	OCH ₂ CF ₂ CH ₂ F	-	H	H	H1	
1.376	OCH(CH ₃)CF ₂ CF ₃	-	H	H	H1	
1.377	OCH(CH ₃)CF ₂ CHF ₂	-	H	H	H1	
1.378	OCH(CH ₃)CF ₂ CH ₂ F	-	H	H	H1	
1.379	OCH ₂ CHFCF ₃	-	H	H	H1	
1.380	O(CH ₂) ₂ CF ₃	-	H	H	H1	
1.381	O(CH ₂) ₂ CHF ₂	-	H	H	H1	

	R	R ¹	R ²	M	Het	¹ H-ЯМР
1.382	O(CH ₂) ₃ CF ₃	-	H	H	H1	
1.383	O(CH ₂) ₃ CHF ₂	-	H	H	H1	
1.384	OCF=CH ₂	-	H	H	H1	
1.385	OCH=CF ₂	-	H	H	H1	
1.386	OCF ₂ CH=CH ₂	-	H	H	H1	
1.387	OCHFCH=CH ₂	-	H	H	H1	
1.388	OCH=CHCF ₃	-	H	H	H1	
1.389	SCH ₃	-	H	H	H1	*
1.390	SCH ₃	-	H	H	H2	*
1.391	SCH ₂ CH ₃	-	H	H	H1	
1.392	SCH ₂ CH ₃	-	H	H	H2	
1.393	S(CH ₂) ₂ CH ₃	-	H	H	H1	
1.394	SCH(CH ₃) ₂	-	H	H	H1	
1.395	SCH(CH ₃) ₂	-	H	H	H2	
1.396	SC(CH ₃) ₃	-	H	H	H1	
1.397	SCH ₂ Ph	-	H	H	H1	
1.398	SPh	-	H	H	H1	
1.399	SCF ₃	-	H	H	H1	
1.400	SCF ₃	-	H	H	H2	
1.401	SCHF ₂	-	H	H	H1	
1.402	SCHF ₂	-	H	H	H2	
1.403	SCH ₂ F	-	H	H	H1	
1.404	SCH=CH ₂	-	H	H	H1	
1.405	SCH ₂ CH=CH ₂	-	H	H	H1	
1.406	SCH ₂ CH=CH ₂	-	H	H	H2	
1.407	SC≡CH	-	H	H	H1	
1.408	SCH ₂ O≡CH	-	H	H	H1	
1.409	SCH ₂ C≡CH	-	H	H	H2	
1.410	S-циклопропіл	-	H	H	H1	
1.411	SCH ₂ -циклопропіл	-	H	H	H1	

	R	R ¹	R ²	M	Het	H-ЯМР
1.412	SCH ₂ -циклопропіл	-	H	H	H2	
1.413	SF ₅	-	H	H	H1	
1.414	S(O)CH ₃	-	H	H	H1	
1.415	S(O)CH ₂ CH ₃	-	H	H	H1	
1.416	S(O)(CH ₂) ₂ CH ₃	-	H	H	H1	
1.417	S(O)CH(CH ₃) ₂	-	H	H	H1	
1.418	S(O)C(CH ₃) ₃	-	H	H	H1	
1.419	S(O)CH ₂ Ph	-	H	H	H1	
1.420	S(O)Ph	-	H	H	H1	
1.421	S(O)CF ₃	-	H	H	H1	
1.422	S(O)CHF ₂	-	H	H	H1	
1.423	S(O)CH ₂ F	-	H	H	H1	
1.424	S(O)CH=CH ₂	-	H	H	H1	
1.425	S(O)CH ₂ CH=CH ₂	-	H	H	H1	
1.426	S(O)C≡CH	-	H	H	H1	
1.427	S(O)CH ₂ C≡CH	-	H	H	H1	
1.428	S(O)-циклопропіл	-	H	H	H1	
1.429	S(O)CH ₂ -циклопропіл	-	H	H	H1	
1.430	SO ₂ CH ₃	-	H	H	H1	
1.431	SO ₂ CH ₃	-	H	H	H2	
1.432	SO ₂ CH ₂ CH ₃	-	H	H	H1	
1.433	SO ₂ CH ₂ CH ₃	-	H	H	H2	
1.434	SO ₂ (CH ₂) ₂ CH ₃	-	H	H	H1	
1.435	SO ₂ CH(CH ₃) ₂	-	H	H	H1	
1.436	SO ₂ CH(CH ₃) ₂	-	H	H	H2	
1.437	SO ₂ C(CH ₃) ₃	-	H	H	H1	
1.438	SO ₂ CH ₂ Ph	-	H	H	H1	
1.439	SO ₂ Ph	-	H	H	H1	
1.440	SO ₂ Ph	-	H	H	H2	
1.441	SO ₂ CF ₃	-	H	H	H1	

71

89672

72

	R	R ¹	R ²	M	Het	¹ H-ЯМР
1.442	SO ₂ CF ₃	-	H	H	H2	
1.443	SO ₂ CHF ₂	-	H	H	H1	
1.444	SO ₂ CHF ₂	-	H	H	H2	
1.445	SO ₂ CH ₂ F	-	H	H	H1	
1.446	SO ₂ CH=CH ₂	-	H	H	H1	
1.447	SO ₂ CH ₂ CH=CH ₂	-	H	H	H1	
1.448	SO ₂ CH ₂ CH=CH ₂	-	H	H	H2	
1.449	SO ₂ C≡CH	-	H	H	H1	
1.450	SO ₂ CH ₂ C≡CH	-	H	H	H1	
1.451	SO ₂ CH ₂ C≡CH	-	H	H	H2	
1.452	SO ₂ -циклопропіл	-	H	H	H1	
1.453	SO ₂ -циклопропіл	-	H	H	H2	
1.454	SO ₂ CH ₂ -циклопропіл	-	H	H	H1	
1.455	SO ₂ CH ₂ -циклопропіл	-	H	H	H2	
1.456	SO ₂ NHCH ₃	-	H	H	H1	
1.457	SO ₂ N(CH ₃) ₂	-	H	H	H1	
1.458	SO ₂ N(CH ₃) ₂	-	H	H	H2	
1.459	SO ₂ NHCF ₃	-	H	H	H1	
1.460	SO ₂ NHCF ₃	-	H	H	H2	
1.461	SO ₂ NHCHF ₂	-	H	H	H1	
1.462	SO ₂ NHCHF ₂	-	H	H	H2	
1.463	OSO ₂ CH ₃	-	H	H	H1	*
1.464	OSO ₂ CH ₃	-	H	Na	H1	
1.465	OSO ₂ CH ₃	5-CH ₃	H	H	H1	
1.466	OSO ₂ CH ₃	-	CH ₃	H	H1	
1.467	OSO ₂ CH ₃	-	H	H	H2	
1.468	OSO ₂ CH ₃	-	H	Na	H2	
1.469	OSO ₂ CH ₃	5-CH ₃	H	H	H2	
1.470	OSO ₂ CH ₃	-	CH ₃	H	H2	
1.471	OSO ₂ CH ₃	-	H	H	H5	*

	R	R ¹	R ²	M	Het	¹ H-ЯМР
1.472	OSO ₂ CH ₃	-	H	H	H6	*
1.473	OSO ₂ CH ₃	-	H	Na	H6	
1.474	OSO ₂ CH ₃	5-CH ₃	H	H	H6	
1.475	OSO ₂ CH ₃	-	CH ₃	H	H6	
1.476	OSO ₂ CH ₃	-	H	H	H7	*
1.477	OSO ₂ CH ₃	-	H	H	H3	
1.478	OSO ₂ CH ₃	-	H	H	H10	
1.479	OSO ₂ CH ₃	-	H	H	H11	
1.480	OSO ₂ CH ₃	-	H	H	H12	
1.481	OSO ₂ CH ₃	-	H	H	H13	
1.482	OSO ₂ CH ₂ CH ₃	-	H	H	H1	
1.483	OSO ₂ CH(CH ₃) ₂	-	H	H	H1	
1.484	OSO ₂ C(CH ₃) ₃	-	H	H	H1	
1.485	OSO ₂ CH ₂ Ph	-	H	H	H1	
1.486	OSO ₂ CF ₃	-	H	H	H1	
1.487	OSO ₂ CF ₃	-	H	H	H2	
1.488	OSO ₂ CHF ₂	-	H	H	H1	
1.489	OSO ₂ CHF ₂	-	H	H	H2	
1.490	OSO ₂ CH ₂ F	-	H	H	H1	
1.491	OSO ₂ CH ₂ CF ₃	-	H	H	H1	
1.492	OSO ₂ CH ₂ CHF ₂	-	H	H	H1	
1.493	OSO ₂ (CH ₂) ₂ F	-	H	H	H1	
1.494	OSO ₂ CH=CH ₂	-	H	H	H1	
1.495	OSO ₂ CH ₂ CH=CH ₂	-	H	H	H1	
1.496	OSO ₂ CH ₂ CH=CH ₂	-	H	H	H2	
1.497	OSO ₂ C≡CH	-	H	H	H1	
1.498	OSO ₂ CH ₂ C≡CH	-	H	H	H1	
1.499	OSO ₂ CH ₂ C≡CH	-	H	H	H2	
1.500	OSO ₂ -циклопропіл	-	H	H	H1	
1.501	OSO ₂ -циклопропіл	-	H	H	H2	

75

89672

76

	R	R ¹	R ²	M	Het	¹ H-ЯМР
1.502	OSO ₂ CH ₂ -циклопропіл	-	H	H	H1	
1.503	OSO ₂ CH ₂ -циклопропіл	-	H	H	H2	
1.504	OSO ₂ CH ₂ CN	-	H	H	H1	
1.505	OSO ₂ CH ₂ CN	-	H	H	H2	
1.506	OSO ₂ NHCH ₃	-	H	H	H1	
1.507	OSO ₂ N(CH ₃) ₂	-	H	H	H1	*
1.508	OSO ₂ N(CH ₃) ₂	-	H	H	H2	
1.509	OSO ₂ N(CH ₃) ₂	-	H	H	H5	*
1.510	OSO ₂ N(CH ₃) ₂	-	H	H	H6	*
1.511	OSO ₂ N(CH ₃) ₂	-	H	H	H7	*
1.512	OSO ₂ NHCH ₂ CH=CH ₂	-	H	H	H1	
1.513	OSO ₂ NHCH ₂ C=CH	-	H	H	H1	
1.514	OSO ₂ NHCF ₃	-	H	H	H1	
1.515	OSO ₂ NHCF ₃	-	H	H	H2	
1.516	OSO ₂ NHCHF ₂	-	H	H	H1	
1.517	OSO ₂ NHCH ₂ F	-	H	H	H1	
1.518	OC(O)H	-	H	H	H1	
1.519	OC(O)H	-	H	H	H2	
1.520	OC(O)CH ₃	-	H	H	H1	
1.521	OC(O)CH ₃	-	H	H	H2	
1.522	OC(O)CH ₂ CH ₃	-	H	H	H1	
1.523	OC(O)CH ₂ CH ₃	-	H	H	H2	
1.524	OC(O)OCH ₃	-	H	H	H1	
1.525	OC(O)OCH ₃	-	H	H	H2	
1.526	OC(O)OCH ₂ CH ₃	-	H	H	H1	
1.527	OC(O)OCH ₂ CH ₃	-	H	H	H2	
1.528	OC(O)NH ₂	-	H	H	H1	
1.529	OC(O)NHCH ₃	-	H	H	H1	
1.530	OC(O)N(CH ₃) ₂	-	H	H	H1	
1.531	OC(O)N(CH ₃) ₂	-	H	H	H2	

	R	R ¹	R ²	M	Het	¹ H-ЯМР
1.532	OC(O)N(CH ₂ CH ₃) ₂	-	H	H	H1	
1.533	Si(CH ₃) ₃	-	H	H	H1	
1.534	Si(CH ₃) ₃	-	H	H	H2	
1.535	2-тієніл	-	H	H	H1	
1.536	2-тієніл	-	H	H	H2	
1.537	3-тієніл	-	H	H	H1	
1.538	3-тієніл	-	H	H	H2	
1.539	2-піридил	-	H	H	H1	
1.540	2-піридил	-	H	H	H2	
1.541	3-піридил	-	H	H	H1	
1.542	3-піридил	-	H	H	H2	
1.543	4-піридил	-	H	H	H1	
1.544	4-піридил	-	H	H	H2	
1.545	ОН	-	H	H	H1	
1.546	ОН	-	H	H	H2	
1.547	SCH ₃	-	H	Na	H1	
1.548	SCH ₃	5-CH ₃	H	H	H1	
1.549	SCH ₃	-	CH ₃	H	H1	
1.550	SCH ₃	-	H	H	H5	*
1.551	SCH ₃	-	H	H	H6	*
1.552	SCH ₃	-	H	H	H7	
1.553	O(CH ₂) ₃ CH ₃	-	H	H	H2	*
1.554	O(CH ₂) ₃ CH ₃	-	H	H	H5	*
1.555	O(CH ₂) ₃ CH ₃	-	H	H	H6	*
1.556	O(CH ₂) ₃ CH ₃	-	H	H	H7	*
1.557	OCH(CH ₃)CH ₂ CH ₃	-	H	H	H2	*
1.558	OCH(CH ₃)CH ₂ CH ₃	-	H	H	H5	*
1.559	OCH(CH ₃)CH ₂ CH ₃	-	H	H	H6	
1.560	OCH(CH ₃)CH ₂ CH ₃	-	H	H	H7	*
1.561	OCH ₂ CH(CH ₃) ₂	-	H	H	H2	

	R	R ¹	R ²	M	Het	¹ H-ЯМР
1.562	OCH ₂ CH(CH ₃) ₂	-	H	H	H5	
1.563	OCH ₂ CH(CH ₃) ₂	-	H	H	H6	*
1.564	OCH ₂ CH(CH ₃) ₂	-	H	H	H7	
1.565	OC(CH ₃) ₃	-	H	H	H5	
1.566	OC(CH ₃) ₃	-	H	H	H6	
1.567	OC(CH ₃) ₃	-	H	H	H7	
1.568	O(CH ₂) ₂ Cl	-	H	H	H1	
1.569	O(CH ₂) ₂ Cl	-	H	H	H2	
1.570	O(CH ₂) ₂ Cl	-	H	H	H5	
1.571	O(CH ₂) ₂ Cl	-	H	H	H6	
1.572	O(CH ₂) ₂ Cl	-	H	H	H7	
1.573	O(CH ₂) ₃ Cl	-	H	H	H1	
1.574	O(CH ₂) ₃ Cl	-	H	H	H2	
1.575	O(CH ₂) ₃ Cl	-	H	H	H5	
1.576	O(CH ₂) ₃ Cl	-	H	H	H6	
1.577	O(CH ₂) ₃ Cl	-	H	H	H7	
1.578	О-циклопропіл	-	H	H	H5	
1.579	О-циклопропіл	-	H	H	H6	
1.580	О-циклопропіл	-	H	H	H7	
1.581	SCH ₂ CH ₃	-	H	H	H5	
1.582	SCH ₂ CH ₃	-	H	H	H6	
1.583	SCH ₂ CH ₃	-	H	H	H7	
1.584	S(O)CH ₃	-	H	H	H2	
1.585	S(O)CH ₃	-	H	H	H5	
1.586	S(O)CH ₃	-	H	H	H6	
1.587	S(O)CH ₃	-	H	H	H7	
1.588	S(O)CH ₂ CH ₃	-	H	H	H2	
1.589	S(O)CH ₂ CH ₃	-	H	H	H5	
1.590	S(O)CH ₂ CH ₃	-	H	H	H6	
1.591	S(O)CH ₂ CH ₃	-	H	H	H7	

	R	R ¹	R ²	M	Het	¹ H-ЯМР
1.592	SO ₂ CH ₃	-	H	H	H5	
1.593	SO ₂ CH ₃	-	H	H	H6	
1.594	SO ₂ CH ₃	-	H	H	H7	
1.595	SO ₂ CH ₂ CH ₃	-	H	H	H5	
1.596	SO ₂ CH ₂ CH ₃	-	H	H	H6	
1.597	SO ₂ CH ₂ CH ₃	-	H	H	H7	
1.598	OCH ₃	3-Cl	H	H	H1	*
1.599	OCH ₃	3-Cl	H	H	H2	*
1,600	OCH ₃	3-Cl	H	H	H5	*
1,601	OCH ₃	3-Cl	H	H	H6	*
1,602	OCH ₃	3-Cl	H	H	H7	*

¹H-ЯМР дані:

Приклад-номер: 1,001 (d₆-DMSO): 13,11 (шс, 1H); 10,74 (шс, 1H); 8,04 (шд, J=7,6, 1H); 7,49 (ддд, J=1,1, 8,4, 11,3, 1H); 7,41 (дт, J=5,3, 7,9, 1H); 6,02 (с, 1H); 3,94 (с, 6H).

Приклад-номер: 1,002 (d₆-DMSO): 13,01 (шс, 1H); 11,15 (с, 1H); 8,04 (шд, J=7,6, 1H); 7,49 (ддд, J=1,1, 8,4, 11,2, 1H); 7,42 (дт, J=5,3, 7,8, 1H); 3,99 (с, 3H); 2,48 (с, 3H).

Приклад-номер: 1,003 (CDCl₃): 13,51 (шс, 1H); 8,14 (шс, 1H); 7,90 (м, 1H); 7,17 (м, 2H); 6,74 (с, 1H); 2,43 (с, 6H).

Приклад-номер: 1,004 (CDCl₃): 12,45 (шс, 1H); 7,96 (м, 1H); 7,43 (шс, 1H); 7,22 (м, 2H); 6,51 (с, 1H); 4,05 (с, 6H).

Приклад-номер: 1,012 (CDCl₃): 12,81 (с, 1H); 8,02 (д, J=7,8, 1H); 7,33 (д, J=7,8, 1H); 7,12 (шс, 1H); 7,05 (т, J=7,8, 1H); 5,80 (с, 1H); 4,00 (с, 6H); 2,89 (с, 3H).

Приклад-номер: 1,016 (CDCl₃): 12,76 (шс, 1H); 8,02 (шд, J=7,8, 1H); 7,34 (шс, 1H); 7,33 (шд, J=7,5, 1H); 7,06 (т, J=7,8, 1H); 4,06 (с, 3H); 2,88 (с, 3H); 2,59 (с, 3H).

Приклад-номер: 1,020 (CDCl₃): 13,29 (шс, 1H); 8,01 (дд, J=0,7, 7,8, 1H); 7,44 (шс, 1H); 7,32 (шд, J=7,5, 1H); 7,03 (т, J=7,8, 1H); 6,78 (с, 1H); 2,90 (с, 3H); 2,48 (с, 3H).

Приклад-номер: 1,021 (CDCl₃): 12,37 (шс, 1H); 8,02 (д, J=7,8, 1H); 7,35 (шс, 1H); 7,33 (д, J=7,5, 1H); 7,05 (т, J=7,8, 1H); 6,50 (с, 1H); 4,06 (с, 3H); 2,89 (с, 3H).

Приклад-номер: 1,025 (CDCl₃): 12,47 (шс, 1H); 8,02 (дд, J=0,7, 7,8, 1H); 7,33 (шд, J=7,8, 1H); 7,25 (шс, 1H); 7,06 (т, J=7,8, 1H); 4,08 (с, 6H); 2,88 (с, 3H).

Приклад-номер: 1,091 (CDCl₃): 13,09 (шс, 1H); 8,38 (дд, J=1,3, 8,0, 1H); 7,96 (шдд, J=0,7, 8,0, 1H); 7,28 (тд, J=0,7, 8,0, 1H); 7,23 (шс, 1H); 5,81 (с, 1H); 3,98 (с, 6H).

Приклад-номер: 1,095 (CDCl₃): 13,00 (шс, 1H); 9,96 (с, 1H); 8,26 (дд, J=1,2, 8,0, 1H); 7,84 (шд, J=8,0, 1H); 7,19 (т, J=7,9, 1H); 3,93 (с, 3H); 2,44 (с, 3H).

Приклад-номер: 1,099 (d₆-DMSO): 14,08 (шс, 1H); 10,67 (с, 1H); 8,47 (дд, J=1,1, 7,9, 1H); 8,02 (дд,

J=1,0, 8,0, 1H); 7,46 (т, J=8,1, 1H); 7,02 (с, 1H); 2,43 (с, 6H).

Приклад-номер: 1,100 (CDCl₃): 12,62 (шс, 1H); 8,38 (дд, J=1,3, 8,0, 1H); 7,97 (шдд, J=0,7, 8,0, 1H); 7,63 (шс, 1H); 7,30 (тд, J=0,7, 8,0, 1H); 6,51 (с, 1H); 4,04 (с, 3H).

Приклад-номер: 1,104 (CDCl₃): 12,76 (шс, 1H); 9,40 (шс, 1H); 8,32 (дд, J=1,2, 8,0, 1H); 7,90 (дд, J=0,7, 8,0, 1H); 7,24 (м, 1H); 4,00 (с, 6H).

Приклад-номер: 1,146 (d₆-DMSO): 12,69 (шс, 1H); 10,52 (шс, 1H); 7,81 (м, 1H); 7,28 (м, 2H); 6,03 (с, 1H); 3,93 (с, 6H); 3,73 (с, 3H).

Приклад-номер: 1,150 (d₆-DMSO): 12,41 (шс, 1H); 10,98 (шс, 1H); 7,81 (м, 1H); 7,29 (м, 2H); 3,99 (с, 3H); 3,79 (с, 3H); 2,50 (с, 3H).

Приклад-номер: 1,154 (d₆-DMSO): 13,05 (с, 1H); 10,45 (с, 1H); 7,77 (м, 1H); 7,23 (м, 2H); 7,01 (с, 1H); 3,70 (с, 3H); 2,42 (с, 6H).

Приклад-номер: 1,155 (d₆-DMSO): 11,97(с, 1H); 10,73 (с, 1H); 7,79 (м, 1H); 7,26 (м, 2H); 6,88 (с, 1H); 3,98 (с, 3H); 3,78 (с, 3H).

Приклад-номер: 1,159 (CDCl₃): 12,13 (с, 1H); 7,81 (дд, J=1,1, 7,9, 1H); 7,33 (шс, 1H); 7,11 (т, J=8,3, 1H); 7,01 (дд, J=1,0, 8,5, 1H); 4,07 (с, 6H); 3,91 (с, 3H).

Приклад-номер: 1,164 (CDCl₃): 12,46 (с, 1H); 7,82 (дд, J=1,2, 7,8, 1H); 7,18 (шс, 1H); 7,08 (т, J=8,4, 1H); 6,99 (дд, J=1,2, 8,4, 1H); 5,78 (с, 1H); 4,14 (кв, J=7,0, 2H); 3,97 (с, 6H); 1,32 (т, J=7,0, 3H).

Приклад-номер: 1,165 (d₆-DMSO): 12,25 (с, 1H); 10,99 (с, 1H); 7,79 (м, 1H); 7,26 (м, 2H); 4,14 (кв, J=7,7, 2H); 3,98 (с, 3 H); 2,47 (с, 3H); 1,21 (т, J=7,0, 3H).

Приклад-номер: 1,166 (CDCl₃): 12,68 (с, 1H); 7,81 (дд, J=1,2, 7,8, 1H); 7,60 (шс, 1H); 7,07 (т, J=8,3, 1H); 6,98 (дд, J=1,2, 8,4, 1H); 6,76 (с, 1H); 4,13 (кв, J=7,0, 2H); 2,46 (с, 6H); 1,37 (т, J=7,0, 3H).

Приклад-номер: 1,167 (CDCl₃): 11,83 (с, 1H); 7,82 (дд, J=1,1, 7,7 1H); 7,36 (шс, 1H); 7,09 (т, J=8,3, 1H); 7,00 (дд, J=1,1, 8,4, 1H); 6,49 (с, 1H); 4,17 (кв, J=7,0, 2H); 4,01 (с, 3H); 1,41 (т, J=7,0, 3H).

Приклад-номер: 1,168 (CDCl₃): 11,99 (с, 1H); 7,82 (дд, J=1,3, 7,8, 1H); 7,29 (шс, 1H); 7,09 (т, J=8,4, 1H); 7,00 (дд, J=1,2, 8,4, 1H); 4,16 (кв, J=7,0, 2H); 4,06 (с, 6H); 1,43 (т, J=7,0, 3H).

Приклад-номер: 1,171 (CDCl₃): 12,41 (с, 1H); 7,82 (дд, J=1,2, 7,8, 1H); 7,17 (шс, 1H); 7,07 (т, J=8,4, 1H); 6,99 (дд, J=1,1, 8,4, 1H); 5,79 (с, 1H); 4,02 (т, J=6,7, 2H); 3,97 (с, 6H); 1,74 (м, 2H); 0,96 (т, J=7,4, 3H).

Приклад-номер: 1,173 (d₆-DMSO): 12,81 (шс, 1H); 10,52 (с, 1H); 7,79 (дд, J=1,7, 7,1, 1H); 7,24 (м, 2H); 7,02 (с, 1H); 4,00 (т, J=6,4, 2H); 2,41 (с, 6H); 1,56 (м, 2H); 0,87 (т, J=7,4, 3H).

Приклад-номер: 1,174 (CDCl₃): 11,77 (с, 1H); 7,81 (дд, J=1,2, 7,8, 1H); 7,30 (шс, 1H); 7,08 (т, J=8,4, 1H); 7,00 (дд, J=1,1, 8,4, 1H); 6,48 (с, 1H); 4,04 (т, J=6,6, 2H); 4,00 (с, 3H); 1,82 (м, 2H); 1,01 (т, J=7,4, 3H).

Приклад-номер: 1,175 (CDCl₃): 11,96 (с, 1H); 7,80 (дд, J=1,2, 7,8, 1H); 7,46 (шс, 1H); 7,08 (т, J=8,4, 1H); 6,99 (дд, J=1,1, 8,4, 1H); 4,05 (с, 6H); 4,03 (т, J=6,6, 2H); 1,83 (м, 2H); 1,03 (т, J=7,4, 3H).

Приклад-номер: 1,178 (CDCl₃): 12,32 (с, 1H); 7,80 (дд, J=1,2, 7,7, 1H); 7,17 (шс, 1H); 7,06 (т, J=8,4, 1H); 6,99 (шд, J=8,2, 1H); 5,78 (с, 1H); 4,70 (м, 1H); 3,97 (с, 6H); 1,28 (д, J=6,1, 6H).

Приклад-номер: 1,182 (CDCl₃): 12,00 (шс, 1H); 7,80 (дд, J=1,0, 7,8, 1H); 7,43 (шс, 1H); 7,08 (т, J=8,2, 1H); 7,00 (шд, J=8,1, 1H); 4,71 (м, 1H); 4,05 (с, 3H); 2,58 (с, 3H); 1,35 (д, J=6,0, 6H).

Приклад-номер: 1,186 (CDCl₃): 12,51 (шс, 1H); 7,80 (м, 1H); 7,39 (шс, 1H); 7,06 (м, 1H); 6,98 (м, 1H); 6,76 (с, 1H); 4,69 (м, 1H); 2,47 (с, 6H); 1,32 (шд, J=6,0, 6H).

Приклад-номер: 1,187 (CDCl₃): 11,68 (с, 1H); 7,80 (дд, J=1,1, 7,8, 1H); 7,33 (шс, 1H); 7,07 (т, J=8,4, 1H); 7,00 (шд, J=7,8, 1H); 6,48 (с, 1H); 4,71 (м, 1H); 4,00 (с, 3H); 1,35 (д, J=6,1, 6H).

Приклад-номер: 1,191 (CDCl₃): 11,90 (шс, 1H); 7,79 (дд, J=1,3, 7,7, 1H); 7,39 (шс, 1H); 7,08 (т, J=8,4, 1H); 7,00 (дд, J=1,2, 8,5, 1H); 4,71 (м, 1H); 4,06 (с, 6H); 1,35 (д, J=6,1, 6H).

Приклад-номер: 1,192 (CDCl₃): 12,41 (шс, 1H); 7,83 (дд, J=1,1, 7,8, 1H); 7,11 (шс, 1H); 7,08 (т, J=7,9, 1H); 7,00 (дд, J=1,0, 8,5, 1H); 5,79 (с, 1H); 4,06 (т, J=6,9, 2H); 3,97 (с, 6H); 1,68 (м, 2H); 1,38 (м, 2H); 0,86 (т, J=7,4, 3H).

Приклад-номер: 1,196 (CDCl₃): 12,31 (шс, 1H); 7,80 (дд, J=7,8, 1H); 7,14 (шс, 1H); 7,06 (т, J=8,5, 1H); 6,98 (шд, J=8,0, 1H); 5,79 (с, 1H); 4,46 (м, 1H); 3,96 (с, 6H); 1,69 (м, 1H); 1,57 (м, 1H); 1,22 (д, J=6,1, 3H); 0,89 (т, J=7,4, 3H).

Приклад-номер: 1,197 (CDCl₃): 12,38 (шс, 1H); 7,82 (дд, J=1,1, 7,8, 1H); 7,15 (шс, 1H); 7,08 (дд, J=7,9, 8,4, 1H); 6,99 (дд, J=1,1, 8,5, 1H); 5,78 (с, 1H); 3,96 (с, 6H); 3,82 (д, J=6,7, 2H); 2,05 (м, 1H); 0,97 (д, J=6,7, 6H).

Приклад-номер: 1,229 (CDCl₃): 12,51 (шс, 1H); 7,82 (дд, J=1,1, 7,7, 1H); 7,26 (шс, 1H); 7,06 (т, J=8,4, 1H); 6,97 (дд, J=1,1, 8,5, 1H); 5,78 (с, 1H); 3,97 (с, 6H); 3,89 (д, J=6,9, 2H); 1,15 (м, 1H); 0,47 (м, 2H); 0,23 (м, 2H).

Приклад-номер: 1,233 (CDCl₃): 12,11 (шс, 1H); 7,83 (дд, J=1,1, 7,8, 1H); 7,44 (шс, 1H); 7,09 (т, J=8,2, 1H); 7,00 (дд, J=1,0, 8,4, 1H); 4,05 (с, 3H); 3,94 (д, J=6,8, 2H); 2,55 (с, 3H); 1,25 (м, 1H); 0,54 (м, 2H); 0,32 (м, 2H).

Приклад-номер: 1,237 (CDCl₃): 12,70 (шс, 1H); 7,83 (дд, J=1,1, 7,8, 1H); 7,41 (шс, 1H); 7,07 (т, J=8,0, 1H); 6,99 (дд, J=1,0, 8,4, 1H); 6,76 (с, 1H);

3,93 (д, J=6,7, 2H); 2,45 (с, 6H); 1,22 (м, 1H); 0,47 (м, 2H); 0,29 (м, 2H).

Приклад-номер: 1,238 (CDCl₃): 11,82 (шс, 1H); 7,83 (дд, J=1,1, 7,8, 1H); 7,33 (шс, 1H); 7,08 (т, J=8,3, 1H); 6,99 (дд, J=1,0, 8,4, 1H); 6,48 (с, 1H); 4,02 (с, 3H); 3,93 (д, J=6,9, 2H); 1,25 (м, 1H); 0,53 (м, 1H); 0,29 (м, 2H).

Приклад-номер: 1,242 (CDCl₃): 11,97 (шс, 1H); 7,83 (дд, J=1,1, 7,8, 1H); 7,32 (шс, 1H); 7,09 (т, J=8,3, 1H); 6,99 (дд, J=1,0, 8,4, 1H); 4,05 (с, 6H); 3,93 (д, J=7,0, 2H); 1,28 (м, 1H); 0,57 (м, 2H); 0,32 (м, 2H).

Приклад-номер: 1,302 (d₆-DMSO): 13,11 (шс, 1H); 10,76 (шс, 1H); 8,26 (дд, J=0,8, 8,0, 1H); 7,63 (дт, J=0,8, 8,0, 1H); 7,47 (т, J=8,0, 1H); 6,03 (с, 1H); 3,95 (с, 6H).

Приклад-номер: 1,306 (CDCl₃): 12,77 (шс, 1H); 8,16 (дд, J=1,2, 8,0, 1H); 7,43 (м, 2H); 7,24 (т, J=8,1, 1H); 4,05 (с, 3H); 2,58 (с, 3H).

Приклад-номер: 1,310 (d₆-DMSO): 13,86 (с, 1H); 10,72 (с, 1H); 8,24 (дд, J=1,2, 7,9, 1H); 7,60 (дт, J=1,3, 8,3, 1H); 7,44 (т, J=8,1, 1H); 7,03 (с, 1H); 2,42 (с, 3H).

Приклад-номер: 1,311 (CDCl₃): 12,38 (шс, 1H); 8,17 (дд, J=0,8, 8,0, 1H); 7,44 (дт, J=0,8, 8,0, 1H); 7,37 (шс, 1H); 7,24 (т, J=8,0, 1H); 6,52 (с, 1H); 4,04 (с, 3H).

Приклад-номер: 1,315 (CDCl₃): 12,51 (с, 1H); 8,16 (дд, J=1,2, 8,0, 1H); 7,43 (дт, J=1,2, 8,3, 1H); 7,38 (с, 1H); 7,24 (т, J=8,0, 1H); 4,07 (с, 6H).

Приклад-номер: 1,321 (CDCl₃): 12,87 (шс, 1H); 8,12 (дд, J=1,3, 7,9, 1H); 7,34 (дд, J=1,2, 8,2, 1H); 7,21 (шс, 1H); 7,21 (т, J=8,0, 1H); 6,69 (т, J=74,5, 1H); 5,81 (с, 1H); 3,98 (с, 6H).

Приклад-номер: 1,325 (CDCl₃): 12,84 (шс, 1H); 9,55 (шс, 1H); 8,02 (дд, J=1,2, 7,9, 1H); 7,25 (дд, J=1,0, 8,0, 1H); 7,15 (т, J=8,0, 1H); 6,67 (т, J=74,6, 1H); 3,97 (с, 3H); 2,49 (с, 3H).

Приклад-номер: 1,329 (CDCl₃): 13,46 (шс, 1H); 8,08 (дд, J=1,2, 7,9, 1H); 7,97 (шс, 1H); 7,30 (дд, J=1,1, 8,2, 1H); 7,18 (т, J=8,0, 1H); 6,76 (с, 1H); 6,69 (т, J=74,8, 1H); 2,45 (с, 6H).

Приклад-номер: 1,330 (CDCl₃): 12,35 (шс, 1H); 8,11 (дд, J=1,1, 7,9, 1H); 7,39 (шс, 1H); 7,34 (дд, J=1,1, 8,2, 1H); 7,22 (т, J=8,0, 1H); 6,68 (т, J=74,3, 1H); 6,51 (с, 1H); 4,04 (с, 3H).

Приклад-номер: 1,342 (CDCl₃): 12,45 (шс, 1H); 7,99 (дд, J=0,9, 7,8, 1H); 7,37 (шс, 1H); 7,18 (т, J=8,2, 1H); 7,08 (дд, J=0,9, 8,3, 1H); 4,49 (кв, J=8,1, 2H); 4,05 (с, 3H); 2,58 (с, 3H).

Приклад-номер: 1,343 (CDCl₃): 13,03 (шс, 1H); 7,98 (шд, J=7,8, 1H); 7,46 (шс, 1H); 7,15 (т, J=8,2, 1H); 7,07 (шд, J=8,1, 1H); 6,76 (с, 1H); 4,48 (кв, J=8,2, 2H); 2,45 (с, 6H).

Приклад-номер: 1,344 (CDCl₃): 12,11 (с, 1H); 7,98 (шд, J=7,6, 1H); 7,32 (шс, 1H); 7,17 (т, J=8,2, 1H); 7,09 (шд, J=8,0, 1H); 6,50 (с, 1H); 4,50 (кв, J=8,2, 2H); 4,02 (с, 3H).

Приклад-номер: 1,352 (CDCl₃): 12,37 (шс, 1H); 8,31 (шс, 1H); 7,89 (шд, J=7,6, 1H); 7,13 (т, J=8,1, 1H); 7,03 (шд, J=8,2, 1H); 6,15 (тт, J=3,9, 54,9, 1H); 4,29 (тд, J=3,7, 12,9, 2H); 4,02 (с, 3H); 2,54 (с, 3H).

Приклад-номер: 1,353 (d₆-DMSO): 13,04 (шс, 1H); 9,33 (шс, 1H); 7,81 (дд, J=1,1, 7,7, 1H); 7,08 (т, J=8,1, 1H); 7,02 (дд, J=1,1, 8,3, 1H); 6,69 (с, 1H);

6,04 (тт, J=3,9, 55,0, 1H); 4,24 (тд, J=3,9, 13,2, 2H); 2,37 (с, 6H).

Приклад-номер: 1,354 (CDCl₃): 12,10 (шс, 1H); 9,25 (шс, 1H); 7,91 (дд, J=1,1, 7,8, 1H); 7,16 (т, J=8,2, 1H); 7,08 (дд, J=1,0, 8,4, 1H); 6,47 (с, 1H); 6,17 (тт, J=3,9, 54,9, 1H); 4,33 (тд, J=4,0, 13,2, 2H); 4,02 (с, 3H).

Приклад-номер: 1,355 (CDCl₃): 12,23 (шс, 1H); 8,48 (шс, 1H); 7,88 (шд, J=7,7, 1H); 7,12 (т, J=8,3, 1H); 7,02 (шд, J=8,3, 1H); 6,18 (тт, J=4,0, 54,8, 1H); 4,28 (тд, J=4,0, 13,0, 2H); 4,02 (с, 6H).

Приклад-номер: 1,362 (CDCl₃): 12,52 (шс, 1H); 7,94 (дд, J=1,1, 7,8, 1H); 7,13 (шс, 1H); 7,13 (т, J=8,3, 1H); 7,04 (шд, J=8,2, 1H); 5,79 (с, 1H); 4,85 (м, 1H); 3,96 (с, 6H); 1,52 (д, J=6,4, 3H).

Приклад-номер: 1,363 (CDCl₃): 12,30 (шс, 1H); 7,94 (д, J=7,7, 1H); 7,44 (шс, 1H); 7,14 (т, J=8,2, 1H); 7,04 (д, J=8,2, 1H); 4,84 (м, 1H); 4,04 (с, 3H); 2,00 (с, 3H); 1,55 (д, J=6,1, 3H).

Приклад-номер: 1,364 (CDCl₃): 7,79 (дд, J=1,0, 7,7, 1H); 7,01 (т, J=8,3, 1H); 6,96 (шд, J=7,8, 1H); 6,65 (с, 1H); 4,79 (м, 1H); 2,33 (с, 6H); 1,37 (д, J=6,4, 3H).

Приклад-номер: 1,365 (CDCl₃): 11,95 (шс, 1H); 7,94 (дд, J=1,1, 7,8, 1H); 7,29 (шс, 1H); 7,14 (т, J=8,4, 1H); 7,05 (шд, J=8,2, 1H); 6,49 (с, 1H); 4,84 (м, 1H); 4,00 (с, 3H); 1,57 (д, J=6,5, 3H).

Приклад-номер: 1,366 (CDCl₃): 12,17 (шс, 1H); 7,93 (дд, J=1,1, 7,8, 1H); 7,29 (шс, 1H); 7,14 (т, J=8,4, 1H); 7,06 (шд, J=8,1, 1H); 4,83 (м, 1H); 4,06 (с, 6H); 1,58 (д, J=6,5, 3H).

Приклад-номер: 1,370 (CDCl₃): 12,40 (шс, 1H); 8,01 (дд, J=1,0, 7,7, 1H); 7,35 (шс, 1H); 7,19 (т, J=8,3, 1H); 7,11 (дд, J=1,0, 8,3, 1H); 4,57 (шт, J=13,2, 2H); 4,05 (с, 3H); 2,57 (с, 3H).

Приклад-номер: 1,371 (CDCl₃): 8,00 (дд, J=1,3, 7,7, 1H); 7,59 (шс, 1H); 7,20 (т, J=6,9, 1H); 7,10 (дд, J=1,3, 8,3, 1H); 6,79 (с, 1H); 4,57 (т, J=13,2, 2H); 2,47 (с, 6H).

Приклад-номер: 1,372 (CDCl₃): 12,08 (с, 1H); 8,00 (дд, J=1,4, 7,6, 1H); 7,28 (шс, 1H); 7,19 (т, J=8,2, 1H); 7,13 (дд, J=1,2, 8,2, 1H); 6,50 (с, 1H); 4,59 (шт, J=12,8, 2H); 4,01 (с, 3H).

Приклад-номер: 1,373 (CDCl₃): 12,27 (шс, 1H); 7,98 (шд, J=7,5, 1H); 7,46 (шс, 1H); 7,18 (т, J=8,3, 1H); 7,12 (шд, J=7,3, 1H); 4,58 (шт, J=13,2, 2H); 4,05 (с, 6H).

Приклад-номер: 1,389 (CDCl₃): 12,99 (шс, 1H); 8,46 (шс, 1H); 7,96 (дд, J=1,0, 7,7, 1H); 7,35 (д, J=7,8, 1H); 7,07 (т, J=8,0, 1H); 5,79 (с, 1H); 4,00 (с, 6H); 2,45 (с, 3H).

Приклад-номер: 1,390 (CDCl₃): 12,93 (шс, 1H); 10,23 (шс, 1H); 7,95 (дд, J=1,1, 7,8, 1H); 7,36 (д, J=8,2, 1H); 7,08 (т, J=7,8, 1H); 4,06 (с, 3H); 2,56 (с, 3H); 2,45 (с, 3H).

Приклад-номер: 1,463 (CDCl₃): 13,00 (шс, 1H); 8,71 (шс, 1H); 7,98 (дд, J=1,1, 8,0, 1H); 7,50 (дд, J=1,1, 8,3, 1H); 7,12 (т, J=8,1, 1H); 5,66 (с, 1H); 3,85 (с, 6H); 3,26 (с, 3H).

Приклад-номер: 1,471 (CDCl₃): 13,54 (шс, 1H); 8,11 (дд, J=1,2, 8,0, 1H); 7,67 (дд, J=1,2, 8,3, 1H); 7,44 (шс, 1H); 7,23 (т, J=8,1, 1H); 6,78 (с, 1H); 3,38 (с, 3H); 2,48 (с, 6H).

Приклад-номер: 1,472 (CDCl₃): 12,45 (шс, 1H); 8,12 (шд, J=8,0, 1H); 7,65 (шд, J=8,3, 1H); 7,39 (шс,

1H); 7,25 (шт, J=8,0, 1H); 6,52 (с, 1H); 4,04 (с, 3H); 3,41 (с, 3H).

Приклад-номер: 1,476 (CDCl₃): 12,62 (шс, 1H); 9,35 (с, 1H); 8,05 (дд, J=1,2, 8,0, 1H); 7,55 (дд, J=1,2, 8,3, 1H); 7,18 (т, J=8,1, 1H); 4,00 (с, 6H); 3,37 (с, 3H).

Приклад-номер: 1,507 (CDCl₃): 12,90 (шс, 1H); 8,02 (дд, J=1,2, 7,9, 1H); 7,74 (дд, J=1,2, 8,4, 1H); 7,20 (дд, J=8,0, 8,3, 1H); 5,80 (с, 1H); 4,00 (с, 6H); 3,10 (с, 6H).

Приклад-номер: 1,509 (CDCl₃): 13,38 (шс, 1H); 8,02 (дд, J=1,1, 7,9, 1H); 7,76 (дд, J=1,1, 8,4, 1H); 7,40 (шс, 1H); 7,19 (т, J=8,0, 1H); 6,77 (с, 1H); 3,10 (с, 6H); 2,47 (с, 6H).

Приклад-номер: 1,510 (CDCl₃): 12,31 (шс, 1H); 8,03 (дд, J=1,1, 7,9, 1H); 7,75 (дд, J=1,1, 8,4, 1H); 7,39 (шс, 1H); 7,21 (т, J=8,2, 1H); 6,50 (с, 1H); 4,03 (с, 3H); 3,10 (с, 6H).

Приклад-номер: 1,511 (CDCl₃): 12,41 (шс, 1H); 8,04 (дд, J=1,2, 7,9, 1H); 7,75 (дд, J=1,2, 8,4, 1H); 7,32 (шс, 1H); 7,21 (дд, J=8,0, 8,4, 1H); 4,07 (с, 6H); 3,10 (с, 6H).

Приклад-номер: 1,550 (CDCl₃): 8,88 (шс, 1H); 7,94 (дд, J=1,1, 7,8, 1H); 7,34 (дд, J=0,5, 8,1, 1H); 7,06 (т, J=7,9, 1H); 6,81 (шс, 1H); 2,49 (с, 6H); 2,45 (с, 3H).

Приклад-номер: 1,551 (CDCl₃): 12,41 (шс, 1H); 7,95 (дд, J=1,1, 7,8, 1H); 7,35 (д, J=8,2, 1H); 7,28 (шс, 1H); 7,06 (т, J=7,9, 1H); 6,50 (с, 1H); 4,06 (с, 3H); 2,47 (с, 3H).

Приклад-номер: 1,553 (CDCl₃): 12,10 (шс, 1H); 7,83 (дд, J=1,2, 7,8, 1H); 7,42 (шс, 1H); 7,10 (т, J=8,4, 1H); 7,01 (дд, J=1,1, 8,4, 1H); 4,07 (т, J=6,9, 2H); 4,05 (с, 3H); 2,58 (с, 3H); 1,78 (м, 2H); 1,45 (м, 2H); 0,91 (т, J=7,4, 3H).

Приклад-номер: 1,554 (CDCl₃): 12,64 (шс, 1H); 7,82 (дд, J=1,2, 7,8, 1H); 7,33 (шс, 1H); 7,07 (т, J=7,9, 1H); 6,99 (дд, J=1,1, 8,4, 1H); 6,76 (с, 1H); 4,05 (т, J=6,9, 2H); 2,47 (с, 6H); 1,74 (м, 2H); 1,42 (м, 2H); 0,86 (т, J=7,4, 3H).

Приклад-номер: 1,555 (CDCl₃): 11,78 (шс, 1H); 7,82 (дд, J=1,0, 7,8, 1H); 7,27 (шс, 1H); 7,09 (т, J=8,2, 1H); 7,01 (дд, J=1,0, 8,5, 1H); 6,49 (с, 1H); 4,08 (т, J=6,9, 2H); 4,01 (с, 3H); 1,77 (м, 2H); 1,43 (м, 2H); 0,90 (т, J=7,4, 3H).

Приклад-номер: 1,556 (CDCl₃): 11,95 (шс, 1H); 7,81 (дд, J=1,1, 7,8, 1H); 7,36 (шс, 1H); 7,09 (т, J=8,3, 1H); 7,01 (дд, J=1,1, 8,4, 1H); 4,07 (т, J=6,8, 2H); 4,06 (с, 6H); 1,79 (м, 2H); 1,46 (м, 2H); 0,92 (т, J=7,4, 3H).

Приклад-номер: 1,557 (CDCl₃): 12,02 (шс, 1H); 7,80 (дд, J=1,1, 7,8, 1H); 7,44 (шс, 1H); 7,08 (т, J=8,4, 1H); 6,99 (шд, J=8,0, 1H); 4,48 (м, 1H); 4,05 (с, 3H); 2,58 (с, 3H); 1,78 (м, 1H); 1,64 (м, 1H); 1,27 (д, J=6,1, 3H); 0,93 (т, J=7,5, 3H).

Приклад-номер: 1,558 (CDCl₃): 12,50 (шс, 1H); 7,80 (дд, J=1,1, 7,8, 1H); 7,51 (шс, 1H); 7,06 (т, J=8,4, 1H); 6,97 (шд, J=8,0, 1H); 6,77 (с, 1H); 4,46 (м, 1H); 2,47 (с, 6H); 1,75 (м, 1H); 1,60 (м, 1H); 1,24 (д, J=6,1, 3H); 0,90 (т, J=7,5, 3H).

Приклад-номер: 1,560 (CDCl₃): 11,88 (шс, 1H); 7,79 (дд, J=1,1, 7,8, 1H); 7,32 (шс, 1H); 7,07 (т, J=8,4, 1H); 6,99 (шд, J=8,0, 1H); 4,48 (м, 1H); 4,06 (с, 6H); 1,81 (м, 1H); 1,65 (м, 1H); 1,27 (д, J=6,1, 3H); 0,92 (т, J=7,5, 3H).

87

Приклад-номер: 1,563 (CDCl₃): 11,76 (шс, 1H); 7,82 (дд, J=1,2, 7,8, 1H); 7,28 (шс, 1H); 7,09 (т, J=8,4, 1H); 7,00 (дд, J=1,1, 8,5, 1H); 6,49 (с, 1H); 4,00 (с, 3H); 3,84 (д, J=6,7, 2H); 2,13 (м, 1H); 1,02 (д, J=6,7, 6H).

Приклад-номер: 1,598 (CDCl₃): 12,72 (шс, 1H); 7,65 (д, J=9,0, 1H); 7,02 (д, J=9,0, 1H); 7,25 (шс, 1H); 5,81 (с, 1H); 3,97 (с, 6H); 3,85 (с, 3H).

Приклад-номер: 1,599 (CDCl₃): 12,45 (шс, 1H); 9,35 (шс, 1H); 7,59 (д, J=9,0, 1H); 6,75 (д, J=9,0, 1H); 3,98 (с, 3H); 3,82 (с, 3H); 2,50 (с, 3H).

89672

88

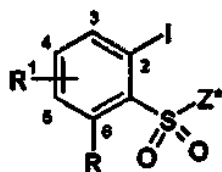
Приклад-номер: 1,600 (CDCl₃): 13,01 (шс, 1H); 7,64 (д, J=9,0, 1H); 7,56 (шс, 1H); 7,01 (д, J=9,0, 1H); 6,78 (с, 1H); 3,87 (с, 3H); 2,48 (с, 6H).

Приклад-номер: 1,601 (CDCl₃): 12,12 (шс, 1H); 7,66 (д, J=9,0, 1H); 7,34 (шс, 1H); 7,03 (д, J=9,0, 1H); 6,51 (с, 1H); 4,02 (с, 3H); 3,93 (с, 3H).

Приклад-номер: 1,602 (d₆-DMSO): 12,38 (шс, 1H); 10,99 (шс, 1H); 7,87 (д, J=9,0, 1H); 7,35 (д, J=9,2, 1H); 3,99 (с, 6H); 3,82 (с, 3H).

Таблиця 2

Сполуки загальної формули (II*)



(II*)

Сполуки а: Z* = NH₂

Сполуки b: Z* = NH-третбутил

Сполуки с: Z* = NH-C(O)O-феніл

Сполуки d: Z* = NH-C(S)O-феніл

Сполуки е: Z* = NCO

Сполуки f: Z* = NCS

	R	R ¹	Z*					
			a	b	c	d	e	f
2,001 a-f	F	-	*	*				
2,002 a-f	Br	-						
2,003 a-f	I	-						
2,004 a-f	CH ₃	-	*	*				
2,005 a-f	CH ₃	5-CH ₃						
2,006 a-f	CH ₂ CH ₃	-						
2,007 a-f	(CH ₂) ₂ CH ₃	-						
2,008 a-f	CH(CH ₃) ₂	-						
2,009 a-f	(CH ₂) ₃ CH ₃	-						
2,010 a-f	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃	-						
2,011 a-f	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-						
2,012 a-f	C(CH ₃) ₃	-						

2,013 a-f	$\text{CH}=\text{CH}_2$	-						
2,014 a-f	$\text{C}(\text{CH}_3)=\text{CH}_2$	-						
2,015 a-f	$\text{C}\equiv\text{CH}$	-						
2,016 a-f	$\text{C}\equiv\text{CCH}_3$	-						
2,017 a-f	$\text{C}\equiv\text{CCH}_2\text{CH}_3$	-						
2,018 a-f	$\text{CH}_2\text{CH}=\text{CH}_2$	-						
2,019 a-f	$\text{CH}_2\text{C}(\text{CH}_3)=\text{CH}_2$	-						
2,020 a-f	$\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$	-						
2,021 a-f	$\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CCH}_3$	-						
2,022 a-f	$\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CCH}_2\text{CH}_3$	-						
2,023 a-f	Циклопропіл	-						
2,024 a-f	2,2-ди- F -циклопропіл							
2,025 a-f	2,2-ди- Cl -циклопропіл	-						
2,026 a-f	2,2-ди- CH_3 -циклопропіл	-						
2,027 a-f	Циклобутил	-						
2,028 a-f	Циклопентил	-						
2,029 a-f	Циклогексил	-						
2,030 a-f	CH_2 циклопропіл	-						
2,031 a-f	CH_2 циклобутил	-						
2,032 a-f	CH_2 циклопентил	-						
2,033 a-f	CH_2 циклогексил	-						
2,034 a-f	CH_2OCH_3	-						
2,035 a-f	$\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{CH}_3$	-						
2,036 a-f	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{OCH}_3$	-						
2,037 a-f	Ph	-						
2,038 a-f	2- F -Ph	-						
2,039 a-f	3- F -Ph	-						
2,040 a-f	4- F -Ph	-						
2,041 a-f	2,6-ди- F -Ph	-						
2,042 a-f	2,4-ди- F -Ph	-						
2,043 a-f	2- Cl -Ph	-						

91

89672

92

2,044 a-f	3-Cl-Ph	-						
2,045 a-f	4-Cl-Ph	-						
2,046 a-f	2,6-ди-Cl-Ph	-						
2,047 a-f	2,4-ди-Cl-Ph	-						
2,048 a-f	2-МеО-Ph	-						
2,049 a-f	3-МеО-Ph	-						
2,050 a-f	4-МеО-Ph	-						
2,051 a-f	2,4-ди-МеО-Ph	-						
2,052 a-f	2-Ме-Ph	-						
2,053 a-f	3-Ме-Ph	-						
2,054 a-f	4-Ме-Ph	-						
2,055 a-f	2-CF ₃ -Ph	-						
2,056 a-f	3-CF ₃ -Ph	-						
2,057 a-f	4-CF ₃ -Ph	-						
2,058 a-f	CH ₂ Ph	-						
2,059 a-f	CH ₂ -2-F-Ph	-						
2,060 a-f	CH ₂ -2,4-ди-F-Ph	-						
2,061 a-f	CH ₂ -2-МеО-Ph	-						
2,062 a-f	CH ₂ -3-МеО-Ph	-						
2,063 a-f	CF ₃	-	*	*				
2,064 a-f	CF ₃	5-						
2,065 a-f	CHF ₂	-						
2,066 a-f	CH ₂ F	-						
2,067 a-f	CH ₂ CF ₃	-						
2,068 a-f	CH ₂ CHF ₂	-						
2,069 a-f	CH ₂ CH ₂ F	-						
2,070 a-f	CF=CH ₂	-						
2,071 a-f	CH=CF ₂	-						
2,072 a-f	CF ₂ CH=CH ₂	-						
2,073 a-f	CH=CH-CF ₃	-						
2,074 a-f	CHFCH=CH ₂	-						
2,075 a-f	CN	-						

2,076 a-f	NO_2	-						
2,077 a-f	NH_2	-						
2,078 a-f	NHCH_3	-						
2,079 a-f	$\text{N}(\text{CH}_3)_2$	-						
2,080 a-f	$\text{N}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{CH}=\text{CH}_2$	-						
2,081 a-f	$\text{N}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$	-						
2,082 a-f	НН-циклопропіл	-						
2,083 a-f	$\text{N}(\text{CH}_3)$ -циклопропіл	-						
2,084 a-f	$\text{N}(\text{CH}_2\text{CH}_3)$ -циклопропіл	-						
2,085 a-f	$\text{NHC}(\text{O})\text{H}$	-						
2,086 a-f	$\text{NHC}(\text{O})\text{CH}_3$	-						
2,087 a-f	$\text{NHC}(\text{O})\text{OCH}_3$	-						
2,088 a-f	NHSO_2CH_3	-						
2,089 a-f	NHSO_2CF_3	-						
2,090 a-f	$\text{NHSO}_2\text{CHF}_2$	-						
2,091 a-f	$\text{NHSO}_2\text{CH}_2\text{F}$	-						
2,092 a-f	OCH_3	-	*	*				
2,093 a-f	OCH_3	5- CH_3						
2,094 a-f	OCH_2CH_3	-	*					
2,095 a-f	$\text{O}(\text{CH}_2)_2\text{CH}_3$	-	*					
2,096 a-f	$\text{OCH}(\text{CH}_3)_2$	-	*					
2,097 a-f	$\text{OCH}(\text{CH}_3)_2$	5- CH_3						
2,098 a-f	$\text{O}(\text{CH}_2)_3\text{CH}_3$	-	*					
2,099 a-f	$\text{OCH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{CH}_3$	-	*					
2,100 a-f	$\text{OCH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)_2$	-	*					

2,101 a-f	$\text{OC}(\text{CH}_3)_3$	-						
2,102 a-f	$\text{OCH}=\text{CH}_2$	-						
2,103 a-f	$\text{OC}(\text{CH}_3)=\text{CH}_2$	-						
2,104 a-f	$\text{OCH}=\text{CH}(\text{CH}_3)$	-						
2,105 a-f	$\text{OCH}=\text{C}(\text{CH}_3)_2$	-						
2,106 a-f	$\text{OC}(\text{CH}_3)=\text{CHCH}_3$	-						
2,107 a-f	$\text{OC}(\text{CH}_3)=\text{C}(\text{CH}_3)_2$	-						
2,108 a-f	$\text{OC}\equiv\text{CH}$	-						
2,109 a-f	$\text{OC}\equiv\text{CCH}_3$	-						
2,110 a-f	$\text{OC}\equiv\text{CCH}_2\text{CH}_3$	-						
2,111 a-f	$\text{OCH}_2\text{CH}=\text{CH}_2$	-						
2,112 a-f	$\text{OCH}_2\text{C}(\text{CH}_3)=\text{CH}_2$	-						
2,113 a-f	$\text{OCH}_2\text{CH}=\text{CHCH}_3$	-						
2,114 a-f	$\text{OCH}_2\text{CH}=\text{C}(\text{CH}_3)_2$	-						
2,115 a-f	$\text{OCH}_2\text{C}(\text{CH}_3)=\text{CHCH}_3$	-						
2,116 a-f	$\text{OCH}_2\text{C}(\text{CH}_3)=\text{C}(\text{CH}_3)_2$	-						
2,117 a-f	$\text{OCH}(\text{CH}_3)\text{CH}=\text{CH}_2$	-						
2,118 a-f	$\text{OCH}_2\text{C}=\text{CH}$	-						
2,119 a-f	$\text{OCH}_2\text{C}\equiv\text{CCH}_3$	-						
2,120 a-f	$\text{OCH}_2\text{C}\equiv\text{CCH}_2\text{CH}_3$	-						
2,121 a-f	$\text{OCH}(\text{CH}_3)\text{C}\equiv\text{CH}$	-						
2,122 a-f	О-циклопропіл	-						
2,123 a-f	О-2,2-ди-СІ-циклопропіл	-						
2,124 a-f	О-2,2-ди-F-циклопропіл	-						
2,125 a-f	О-циклобутил	-						
2,126 a-f	О-циклопентил	-						
2,127 a-f	О-циклогексил	-						
2,128 a-f	OCH_2 -циклопропіл	-	*					
2,129 a-f	OCH_2 -циклопропіл	5- CH_3						

2,130 a-f	OCH(CH ₃)-циклопропіл	-						
2,131 a-f	OCH ₂ -2-Ме-циклопропіл	-						
2,132 a-f	OCH ₂ -2,2-ди-Ме-циклопропіл	-						
2,133 a-f	OCH ₂ -2,2-ди-Сl-циклопропіл	-						
2,134 a-f	OCH ₂ -2,2-ди-F-циклопропіл	-						
2,135 a-f	OCH ₂ -циклобутил	-						
2,136 a-f	OCH ₂ -циклопентил	-						
2,137 a-f	OCH(CH ₃)-циклопентил	-						
2,138 a-f	OCH ₂ -циклогексил	-						
2,139 a-f	OCH(CH ₃)-циклогексил	-						
2,140 a-f	OCH ₂ OCH ₃	-						
2,141 a-f	O(CH ₂) ₂ OCH ₃	-						
2,142 a-f	OCH ₂ OCH ₂ CH ₃	-						
2,143 a-f	O(CH ₂) ₂ OCH ₂ CH ₃	-						
2,144 a-f	OCH(CH ₃)OCH ₃	-						
2,145 a-f	OPh	-						
2,146 a-f	O-2-F-Ph	-						
2,147 a-f	O-3-F-Ph	-						
2,148 a-f	O-4-F-Ph	-						
2,149 a-f	O-2,6-ди-F-Ph	-						
2,150 a-f	O-2,4-ди-F-Ph	-						
2,151 a-f	O-2-Cl-Ph	-						
2,152 a-f	O-3-Cl-Ph	-						
2,153 a-f	O-4-Cl-Ph	-						
2,154 a-f	O-2,6-ди-Cl-Ph	-						
2,155 a-f	O-2,4-ди-Cl-Ph	-						
2,156 a-f	O-2-CF ₃ -Ph	-						
2,157 a-f	O-3-CF ₃ -Ph	-						
2,158 a-f	O-4-CF ₃ -Ph	-						

2,159 a-f	O-2-MeO-Ph	-						
2,160 a-f	O-3-MeO-Ph	-						
2,161 a-f	O-4-MeO-Ph	-						
2,162 a-f	O-2,4-ди-MeO-Ph	-						
2,163 a-f	O-2-Me-Ph	-						
2,164 a-f	O-3-Me-Ph	-						
2,165 a-f	O-4-Me-Ph	-						
2,166 a-f	OCH ₂ Ph	-						
2,167 a-f	OCH(CH ₃)Ph	-						
2,168 a-f	OCH ₂ -2-F-Ph	-						
2,169 a-f	OCH ₂ -3-F-Ph	-						
2,170 a-f	OCH ₂ -4-F-Ph	-						
2,171 a-f	OCH ₂ -2,4-ди-F-Ph	-						
2,172 a-f	OCH ₂ -2-Cl-Ph	-						
2,173 a-f	OCH ₂ -3-Cl-Ph	-						
2,174 a-f	OCH ₂ -4-Cl-Ph	-						
2,175 a-f	OCH ₂ -2,4-ди-Cl-Ph	-						
2,176 a-f	OCH ₂ -2-MeO-Ph	-						
2,177 a-f	OCH ₂ -3-MeO-Ph	-						
2,178 a-f	OCH ₂ -4-MeO-Ph	-						
2,179 a-f	OCH ₂ -2-CF ₃ -Ph	-						
2,180 a-f	OCH ₂ -3-CF ₃ -Ph	-						
2,181 a-f	OCH ₂ -4-CF ₃ -Ph	-						
2,182 a-f	OCF ₃	-	*	*				
2,183 a-f	OCF ₃	5-CH ₃						
2,184 a-f	OCHF ₂	-	*					
2,185 a-f	OCHF ₂	5-CH ₃						
2,186 a-f	OCH ₂ CF ₃	-	*					
2,187 a-f	OCH ₂ CHF ₂	-	*					

101

89672

102

2,188 a-f	$\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{F}$	-						
2,189 a-f	$\text{OCH}(\text{CH}_3)\text{CF}_3$	-	*					
2,190 a-f	$\text{OCH}(\text{CH}_3)\text{CHF}_2$	-						
2,191 a-f	$\text{OCH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{F}$	-						
2,192 a-f	$\text{OCH}_2\text{CF}_2\text{CF}_3$	-	*					
2,193 a-f	$\text{OCH}_2\text{CF}_2\text{CHF}_2$	-						
2,194 a-f	$\text{OCH}_2\text{CF}_2\text{CH}_2\text{F}$	-						
2,195 a-f	$\text{OCH}(\text{CH}_3)\text{CF}_2\text{CF}_3$	-						
2,196 a-f	$\text{OCH}(\text{CH}_3)\text{CF}_2\text{CHF}_2$	-						
2,197 a-f	$\text{OCH}(\text{CH}_3)\text{CF}_2\text{CH}_2\text{F}$	-						
2,198 a-f	$\text{OCH}_2\text{CHFCF}_3$	-						
2,199 a-f	$\text{O}(\text{CH}_2)_2\text{CF}_3$	-						
2,200 a-f	$\text{O}(\text{CH}_2)_2\text{CHF}_2$	-						
2,201 a-f	$\text{O}(\text{CH}_2)_3\text{CF}_3$	-						
2,202 a-f	$\text{O}(\text{CH}_2)_3\text{CHF}_2$	-						
2,203 a-f	$\text{OCF}=\text{CH}_2$	-						
2,204 a-f	$\text{OCH}=\text{CF}_2$	-						
2,205 a-f	$\text{OCF}_2\text{CH}=\text{CH}_2$	-						
2,206 a-f	$\text{OCHFCH}=\text{CH}_2$	-						
2,207 a-f	$\text{OCH}=\text{CHCF}_3$	-						
2,208 a-f	SCH_3	-	*	*				
2,209 a-f	SCH_2CH_3	-						
2,210 a-f	$\text{S}(\text{CH}_2)_2\text{CH}_3$	-						
2,211 a-f	$\text{SCH}(\text{CH}_3)_2$	-						
2,212 a-f	$\text{SC}(\text{CH}_3)_3$	-						
2,213 a-f	SCH_2Ph	-						
2,214 a-f	SPh	-						
2,215 a-f	SCF_3	-						
2,216 a-f	SCHF_2	-						

103

89672

104

2,217 a-f	SCH ₂ F	-						
2,218 a-f	SCH=CH ₂	-						
2,219 a-f	SCH ₂ CH=CH ₂	-						
2,220 a-f	SC≡CH	-						
2,221 a-f	SCH ₂ C= CH	-						
2,222 a-f	S-циклопропіл	-						
2,223 a-f	SCH ₂ -циклопропіл	-						
2,224 a-f	SF ₅	-						
2,225 a-f	S(O)CH ₃	-						
2,226 a-f	S(O)CH ₂ CH ₃	-						
2,227 a-f	S(O)(CH ₂) ₂ CH ₃	-						
2,228 a-f	S(O)CH(CH ₃) ₂	-						
2,229 a-f	S(O)C(CH ₃) ₃	-						
2,230 a-f	S(O)CH ₂ Ph	-						
2,231 a-f	S(O)Ph	-						
2,232 a-f	S(O)CF ₃	-						
2,233 a-f	S(O)CHF ₂	-						
2,234 a-f	S(O)CH ₂ F	-						
2,235 a-f	S(O)CH=CH ₂	-						
2,236 a-f	S(O)CH ₂ CH=CH ₂	-						
2,237 a-f	S(O)C= CH	-						
2,238 a-f	S(O)CH ₂ C= CH	-						
2,239 a-f	S(O)-циклопропіл	-						
2,240 a-f	S(O)CH ₂ -циклопропіл	-						
2,241 a-f	SO ₂ CH ₃	-						
2,242 a-f	SO ₂ CH ₂ CH ₃	-						
2,243 a-f	SO ₂ (CH ₂) ₂ CH ₃	-						
2,244 a-f	SO ₂ CH(CH ₃) ₂	-						
2,245 a-f	SO ₂ C(CH ₃) ₃	-						

105

89672

106

2,246 a-f	SO ₂ CH ₂ Ph	-						
2,247 a-f	SO ₂ Ph	-						
2,248 a-f	SO ₂ CF ₃	-						
2,249 a-f	SO ₂ CHF ₂	-						
2,250 a-f	SO ₂ CH ₂ F	-						
2,251 a-f	SO ₂ CH=CH ₂	-						
2,252 a-f	SO ₂ CH ₂ CH=CH ₂	-						
2,253 a-f	SO ₂ C≡CH	-						
2,254 a-f	SO ₂ CH ₂ C≡CH	-						
2,255 a-f	SO ₂ -циклопропіл	-						
2,256 a-f	SO ₂ CH ₂ -циклопропіл	-						
2,257 a-f	SO ₂ NHCH ₃	-						
2,258 a-f	SO ₂ N(CH ₃) ₂	-						
2,259 a-f	OSO ₂ CH ₃	-	*					
2,260 a-f	OSO ₂ CH ₃	5-CH ₃						
2,261 a-f	OSO ₂ CH ₂ CH ₃	-						
2,262 a-f	OSO ₂ CH(CH ₃) ₂	-						
2,263 a-f	OSO ₂ C(CH ₃) ₃	-						
2,264 a-f	OSO ₂ CH ₂ Ph	-						
2,265 a-f	OSO ₂ CF ₃	-						
2,266 a-f	OSO ₂ CHF ₂	-						
2,267 a-f	OSO ₂ CH ₂ F	-						
2,268 a-f	OSO ₂ CH ₂ CF ₃	-						
2,269 a-f	OSO ₂ CH ₂ CHF ₂	-						
2,270 a-f	OSO ₂ (CH ₂) ₂ F	-						
2,271 a-f	OSO ₂ CH=CH ₂	-						
2,272 a-f	OSO ₂ CH ₂ CH=CH ₂	-						
2,273 a-f	OSO ₂ C≡CH	-						
2,274 a-f	OSO ₂ CH ₂ C≡CH	-						

2,275 a-f	OSO ₂ -циклопропіл	-						
2,276 a-f	OSO ₂ CH ₂ -циклопропіл	-						
2,277 a-f	OSO ₂ CH ₂ CN	-						
2,278 a-f	OSO ₂ NHCH ₃	-						
2,279 a-f	OSO ₂ N(CH ₃) ₂	-	*					
2,280 a-f	OSO ₂ NHCH ₂ CH=CH ₂	-						
2,281 a-f	OSO ₂ NHCH ₂ C=CH	-						
2,282 a-f	OSO ₂ NHCF ₃	-						
2,283 a-f	OSO ₂ NHCHF ₂	-						
2,284 a-f	OSO ₂ NHCH ₂ F	-						
2,285 a-f	OC(O)H	-						
2,286 a-f	OC(O)CH ₃	-						
2,287 a-f	OC(O)CH ₂ CH ₃	-						
2,288 a-f	OC(O)OCH ₃	-						
2,289 a-f	OC(O)OCH ₂ CH ₃	-						
2,290 a-f	OC(O)NH ₂	-						
2,291 a-f	OC(O)NHCH ₃	-						
2,292 a-f	OC(O)N(CH ₃) ₂	-						
2,293 a-f	OC(O)N(CH ₂ CH ₃) ₂	-						
2,294 a-f	Si(CH ₃) ₃	-						
2,295 a-f	2-тієніл	-						
2,296 a-f	3-тієніл	-						
2,297 a-f	2-піридил	-						
2,298 a-f	3-піридил	-						
2,299 a-f	4-піридил	-						
2,300 a-f	ОН	-	*					
2,301 a-f	OCH ₃	3-Cl	*	*				
2,302 a-f	OCH ₃	3-CH ₃	*	*				

¹H-ЯМР дані:

Приклад-номер: 2,001a (d₆-DMSO): 7,96 (дт, J=0,9, 7,8, 1H); 7,78 (шс, 2H); 7,43 (ддд, J=1,1, 8,3, 11,2, 1H); 7,28 (дт, J=5,4, 8,0, 1H).

Приклад-номер: 2,004a (d₆-DMSO): 7,89 (шд, J=7,8, 1H); 7,55 (тд, J=0,9, 7,6, 1H); 7,49 (шс, 2H); 7,40 (тд, J=1,2, 7,9, 1H), 3,34 (с, 3H).

Приклад-номер: 2,063a (d₆-DMSO): 8,48 (дд, J=1,0, 7,9, 1H); 7,95 (дд, J=1,0, 8,0, 1H); 7,74 (шс, 2H); 7,39 (шт, J=8,3, 1H).

Приклад-номер: 2,092a (d₆-DMSO): 7,70 (дд, J=1,1, 7,7, 1H); 7,25 (дд, J=0,9, 8,4, 1H); 7,20 (шс, 2H); 7,17 (т, J=7,9, 1H); 3,90 (с, 3H).

Приклад-номер: 2,094a (d₆-DMSO): 7,70 (дд, J=1,0, 7,8, 1H); 7,26 (шд, J=8,4, 1H); 7,15 (т, J=8,0, 1H); 7,03 (шс, 2H); 4,23 (кв, J=7,0, 2H); 1,37 (т, J=6,9, 3H).

Приклад-номер: 2,095a (d₆-DMSO): 7,70 (дд, J=1,0, 7,8, 1H); 7,26 (дд, J=0,9, 8,4, 1H); 7,15 (т,

J=7,9, 1H); 6,98 (шс, 2H); 4,12 (т, J=6,6, 2H); 1,80 (м, 2H); 0,96 (т, J=7,4, 3H).

Приклад-номер: 2,096a (d₆-DMSO): 7,69 (дд, J=1,0, 1H); 7,29 (шд, J=8,1, 1H); 7,14 (т, J=8,0, 1H); 6,91 (шс, 2H); 4,82 (м, 1H); 1,34 (д, J=6,0, 6H).

Приклад-номер: 2,098a (CDCl₃): 7,70 (дд, J=1,0, 7,8, 1H); 7,27 (дд, J=0,9, 8,4, 1H); 7,16 (т, J=8,0, 1H); 6,97 (с, 2H); 4,16 (т, J=6,7, 2H); 1,77 (м, 2H); 1,42 (м, 2H); 0,92 (т, J=7,4, 3H).

Приклад-номер: 2,099a (CDCl₃): 7,74 (м, 1H); 7,06 (м, 2H); 5,38 (с, 2H); 4,58 (м, 1H); 1,82 (м, 2H); 1,40 (д, J=6,1, 3H); 1,03 (т, J=7,5, 3H).

Приклад-номер: 2,100a (CDCl₃): 7,77 (дд, J=1,6, 7,2, 1H); 7,06 (м, 2H); 5,36 (шс, 2H); 3,94 (д, J=6,5, 2H); 2,20 (снт, J=6,5, 1H); 1,10 (д, J=6,8, 6H).

Приклад-номер: 2,128a (d₆-DMSO): 7,71 (дд, J=1,1, 7,8, 1H); 7,27 (дд, J=1,1, 8,4, 1H); 7,15 (т, J=7,8, 1H); 7,01 (шс, 2H); 4,04 (д, J=7,2, 2H); 1,33 (м, 1H); 0,56 (м, 2H); 0,36 (м, 2H).

Приклад-номер: 2,182a (d₆-DMSO): 8,19 (дд, J=1,1, 7,9, 1H); 7,67 (шс, 2H); 7,55 (дт, J=1,3, 8,3, 1H); 7,34 (т, J=8,1, 1H).

Приклад-номер: 2,184a (CDCl₃): 7,96 (дд, J=1,2, 8,0, 1H); 7,25 (м, 1H); 7,07 (т, J=8,1, 1H); 6,51 (т, J=73,8, 1H); 6,37 (шс, 2H).

Приклад-номер: 2,186a (d₆-DMSO): 7,84 (дд, J=0,9, 7,9, 1H); 7,40 (шд, J=8,2, 1H); 7,23 (т, J=8,0, 1H); 7,07 (шс, 2H); 4,99 (кв, J=8,8, 2H).

Приклад-номер: 2,187a (d₆-DMSO): 7,79 (дд, J=1,0, 7,8, 1H); 7,35 (дд, J=0,8, 8,4, 1H); 7,20 (т, J=7,9, 1H); 7,10 (шс, 2H); 6,53 (тт, J=3,7, 54,7, 1H); 4,51 (тд, J=3,7, 14,3, 2H).

Приклад-номер: 2,189a (d₆-DMSO): 7,83 (дд, J=0,8, 7,9, 1H); 7,46 (шд, J=8,3, 1H); 7,22 (т, J=8,1, 1H); 6,91 (шс, 2H); 5,50 (м, 1H); 1,48 (д, J=6,4, 3H).

Приклад-номер: 2,192a (d₆-DMSO): 7,85 (дд, J=1,0, 7,9, 1H); 7,42 (шд, J=8,3, 1H); 7,24 (т, J=8,0, 1H); 7,00 (шс, 2H); 5,07 (т, J=13,9, 2H).

Приклад-номер: 2,208a (d₆-DMSO): 7,95 (дд, J=0,9, 7,7, 1H); 7,46 (м, 3H); 7,12 (т, J=7,9, 1H); 2,41 (с, 3H).

Приклад-номер: 2,259a (d₆-DMSO): 8,13 (дд, J=1,2, 7,9, 1H); 7,60 (шс, 2H); 7,53 (дд, J=1,2, 8,2, 1H); 7,31 (т, J=8,0, 1H); 3,53 (с, 3H).

Приклад-номер: 2,279a (d₆-DMSO): 8,07 (дд, J=1,2, 7,9, 1H); 7,52 (дд, J=1,2, 8,2, 1H); 7,19 (т, J=8,1, 1H); 5,48 (шс, 2H); 3,10 (с, 6H).

Приклад-номер: 2,300a (CDCl₃): 9,91 (с, 1H); 7,60 (м, 1H); 7,05 (м, 2H); 5,49 (шс, 2H).

Приклад-номер: 2,301a (d₆-DMSO): 7,76 (д, J=9,0, 1H); 7,30 (д, J=9,0, 1H); 7,30 (шс, 2H); 3,91 (с, 3H).

Приклад-номер: 2,302a (CDCl₃): 7,39 (д, J=8,5, 1H); 7,00 (д, J=8,5, 1H); 5,43 (шс, 2H); 4,00 (с, 3H); 2,52 (с, 3H).

Приклад-номер: 2,001 b (d₆-DMSO): 7,99 (дт, J=0,7, 7,7, 1H); 7,79 (шс, 1H); 7,42 (ддд, J=1,1, 8,1, 11,0, 1H); 7,28 (тд, J=5,1, 7,7, 1H); 1,13 (с, 9H).

Приклад-номер: 2,004b (d₆-DMSO): 7,92 (дд, J=1,1, 7,7, 1H); 7,55 (м, 2H); 7,39 (м, 1H); 3,31 (с, 3H); 1,14 (с, 9H).

Приклад-номер: 2,063b (d₆-DMSO): 8,49 (дд, J=1,1, 7,7, 1H); 7,97 (дд, J=1,1, 8,1, 1H); 7,78 (шс, 1H); 7,40 (тд, J=0,7, 8,1, 1H); 1,07 (с, 9H).

Приклад-номер: 2,092b (CDCl₃): 7,80 (м, 1H); 7,06 (м, 2H); 5,28 (шс, 1H); 3,99 (с, 3H); 1,22 (с, 9H).

Приклад-номер: 2,182b (CDCl₃): 8,12 (дд, J=0,8, 8,0, 1H); 7,41 (дт, J=0,8, 8,0, 1H); 7,18 (т, J=8,0, 1H); 5,12 (шс, 1H); 1,27 (с, 9H).

Приклад-номер: 2,208b (CDCl₃): 7,96 (дд, J=1,0, 7,5, 1H); 7,35 (дд, J=0,7, 8,5, 1H); 7,00 (т, J=7,8, 1H); 5,74 (шс, 1H); 2,47 (с, 3H); 1,25 (с, 9H).

Приклад-номер: 2,301 b (CDCl₃): 7,61 (д, J=8,9, 1H); 7,04 (д, J=8,9, 1H); 5,43 (шс, 1H); 4,00 (с, 3H); 1,22 (с, 9H).

Приклад-номер: 2,302b (CDCl₃): 7,37 (дд, J=0,5, 8,5, 1H); 6,97 (д, J=8,5, 1H); 5,45 (шс, 1H); 3,97 (с, 3H); 2,53 (с, 3H); 1,21 (с, 9H).

В. Приклади композицій

а) Засіб для заповнення отримують наступним способом: 10 масових частин сполуки формули (I) та/або її солей та 90 масових частин тальку як інертної речовини змішують і подрібнюють у молотковому млині.

б) Легко диспергований у воді змочуваний порошок отримують наступним способом 25 масових частин сполуки формули (I) та/або її солей, 64 масових частин кварцу, що містить каолін, як інертної речовини, 10 масових частин лігнінсульфонокислотного калію та 1 масова частина олеїлметилтаурінкислотного натрію як змочувача та диспергатора розмішують та розмелюють у штифтовому млині.

с) Легко диспергований у воді дисперсійний концентрат отримують наступним способом: 20 масових частин сполуки формули (I) та/або її солей розмішують із 6 масовими частинами алкілфенолполіглікоєтеру (©Triton X 207), 3 масовими частинами ізотридеканолаполіглікольєтер (8 EO) та 71 масовими частинами парафінової мінеральної олії (інтервал кипіння, наприклад, становить приблизно від 255 до понад 277°C) та розмелюють у тертково-шаровому млині до товщини максимум 5 мікронів.

д) Емульгований концентрат отримують із 15 масових частин сполуки формули (I) та/або її солей, 75 масових частин циклогексанону як розчинника та 10 масових частин окситильованого нонілфенолу як емульгатора.

Диспергований у воді гранулят отримують наступним чином: 75 масових частин сполуки формули (I) та/або її солей, 10 масових частин лігнінсульфонокислотного кальцію, 5 масових частин сульфату натрію, 3 масові частин полівінілалкоголь та 7 масових частин каоліну розмішують і розмелюють у штифтовому млині, а порошок гранують у псевдорозрідженому слої шляхом розпилення води як грануючої рідини.

е) Диспергований у воді гранулят також отримують наступним шляхом 25 масових частин речовини за формулою (I) та/або її солей, 5 масових частин 2,2'-динафтилметан-6,6'-дисульфоновокислотного натрію, 2 масових частин олеїлметилтаурінокислотного натрію, 1 масова частина полівінілалкоголю, 17 масових частин карбонату кальцію та 50 масових частин води гомогенізують та подрібнюють у колоїдному млині, потім розмелюють у гранульному млині, а отриману суспензію розпиляють у розпилювальній башті за допомогою однокомпонентного сопла та висушують.

С Біологічні приклади

1. Дія на бур'яни до моменту появи їх сходів

Насіння, відповідно частини ризомі одно- та дводольних бур'янів поміщають у картонні горшки з піщаним глиноземом та засипають землею. Після того сполуки згідно з винаходом у формі змочуваного порошку або емульсованого концентрату як водяну суспензію, відповідно - емульсію, з водою в кількості з розрахунку від 600 до 800л/га в різному дозуванні наносять на поверхню землі.

Після обробки горшки установлюють у теплиці при добрих умовах росту для бур'янів Оптичну оцінку ушкодження рослин та сходів здійснюють через 3-4 тижні після появи сходів досліджуваних рослин та порівнюють із необробленими контрольними групами. Як показують результати, сполуки згідно з винаходом виявляють гарну гербіцидну дію до появи сходів проти

широкого спектру трав та бур'янів. Наприклад, сполуки номер 1,001, 1,002, 1,003, 1,004, 1,012, 1,016, 1,020, 1,021, 1,025, 1,091, 1,095, 1,099, 1,100, 1,104, 1,146, 1,150, 1,154, 1,155, 1,159, 1,164, 1,165, 1,166, 1,167, 1,168, 1,171, 1,173, 1,174, 1,175, 1,178, 1,182, 1,186, 1,187, 1,191, 1,192, 1,196, 1,197, 1,229, 1,233, 1,237, 1,238, 1,242, 1,302, 1,306, 1,310, 1,311, 1,315, 1,321, 1,325, 1,329, 1,330, 1,342, 1,343, 1,344, 1,352, 1,353, 1,354, 1,355, 1,362, 1,363, 1,364, 1,365, 1,366, 1,370, 1,371, 1,372, 1,373, 1,389, 1,390, 1,463, 1,471, 1,472, 1,476, 1,507, 1,509, 1,510, 1,511, 1,550, 1,551, 1,553, 1,554, 1,555, 1,556, 1,557, 1,558, 1,560, 1,563, 1,598, 1,599, 1,600, 1,601, 1,602 та інші сполуки з таблиці 1 мають дуже добру гербіцидну дію проти шкідливих рослин, таких як *Sinapis alba*, *Chrysanthemum segetum*, *Avena sativa*, *Stellaria media*, *Echinochloa crus-galli*, *Lolium multiflorum*, *Setaria viridis*, *Abutilon theophrasti*, *Amaranthus retroflexus* та *Panicum miliaceum* при обробці до появи сходів при кількості застосування 0,3кг та менше активної субстанції на гектар.

2. Дія на бур'яни після появи їх сходів

Насіння, відповідно - ризоми однодольних та дводольних бур'янів поміщуються у пластикові ємності у пісчаній глинистий ґрунт, присипаються землею та *und im Gewächshaus unter guten Wachstumsbedingungen angezogen*. Через три тижні після посіву піддослідні рослини проходять трьох стадійну обробку. Сполуки згідно з винаходом у формі порошку для змочування, відповідно - емільгованого концентрату, розпилюють у різному дозуванні із водою із розрахунку від 600 до 800л/га на зелені частини рослин *gespruht*. Через приблизно 3-4 тижнів росту після обробки діб препарату можна наочно порівняти та оцінити досліджувані рослини у теплиці при оптимальних умовах росту. Засіб згідно з винаходом виявляє також хорошу гербіцидну дію у період після посіву проти широкого спектру трав та бур'янів господарського значення. Наприклад, сполуки номер 1,001, 1,002, 1,003, 1,004, 1,012, 1,016, 1,020, 1,021, 1,025, 1,091, 1,095, 1,099, 1,100, 1,104,

1,146, 1,150, 1,154, 1,155, 1,159, 1,164, 1,165, 1,166, 1,167, 1,168, 1,171, 1,173, 1,174, 1,175, 1,178, 1,182, 1,186, 1,187, 1,191, 1,192, 1,196, 1,197, 1,229, 1,233, 1,237, 1,238, 1,242, 1,302, 1,306, 1,310, 1,311, 1,315, 1,321, 1,325, 1,329, 1,330, 1,342, 1,343, 1,344, 1,352, 1,353, 1,354, 1,355, 1,362, 1,363, 1,364, 1,365, 1,366, 1,370, 1,371, 1,372, 1,373, 1,389, 1,390, 1,463, 1,471, 1,472, 1,476, 1,507, 1,509, 1,510, 1,511, 1,550, 1,551, 1,553, 1,554, 1,555, 1,556, 1,557, 1,558, 1,560, 1,563, 1,598, 1,599, 1,600, 1,601, 1,602 та інші сполуки із таблиці 1 мають хорошу гербіцидну дію проти шкідливих рослин, таких як *Sinapis alba*, *Echinochloa crus-galli*, *Lolium multiflorum*, *Chrysanthemum segetum*, *Setaria viridis*, *Abutilon theophrasti*, *Amaranthus retroflexus*, *Panicum miliaceum* та *Avena sativa* після посіву при застосуванні кількості 0,3кг та менше активної речовини на гектар.

3. Сумісність із культурними рослинами

При дальшому спостереженні у теплиці насіння великої кількості культурних рослин та бур'янів поміщають у пісчаній глинистий ґрунт та присипають землею. Частину ємностей обробляють так як описано у розділі 1, решта поміщених у теплиці рослин ростуть, доки у них не з'явиться від двох до трьох листків, а потім вони оприскуються сполуками згідно з винаходом так, як описано у розділі 2 у різному дозуванні. Від чотирьох до п'яти тижнів після нанесення і перебування у теплиці за допомогою оптичної оцінки фіксують, що сполуки згідно з винаходом залишають неущкодженіми культури з двома зародковими листками, такі як соя, бавовник, рапс, цукровий буряк або картопля до і після посіву самостійно при високому дозуванні діючої речовини. Деякі речовини охороняють при цьому також зернові культури такі як ячмінь, пшениця, жито, просто, кукурудза або рис. Сполуки згідно з винаходом виявляють частково високу селективність та деякі придатні для боротьби проти небажаних рослинних наростів у сільськогосподарських культурах.