



УКРАЇНА

(19) **UA** (11) **113392** (13) **C2**
(51) МПК (2016.01)
C07D 498/04 (2006.01)
C07D 519/00
A01N 43/90 (2006.01)
A01P 13/00

ДЕРЖАВНА СЛУЖБА
ІНТЕЛЕКТУАЛЬНОЇ
ВЛАСНОСТІ
УКРАЇНИ

(12) ОПИС ДО ПАТЕНТУ НА ВІНАХІД

(21) Номер заявки: **а 2013 02096**
(22) Дата подання заявки: **20.07.2011**
(24) Дата, з якої є чинними права на винахід: **25.01.2017**
(31) Номер попередньої заявки відповідно до Паризької конвенції: **10170416.1, 61/366,535**
(32) Дата подання попередньої заявки відповідно до Паризької конвенції: **22.07.2010, 22.07.2010**
(33) Код держави-учасниці Паризької конвенції, до якої подано попередню заявку: **EP, US**
(41) Публікація відомостей про заявку: **25.03.2013, Бюл.№ 6**
(46) Публікація відомостей про видачу патенту: **25.01.2017, Бюл.№ 2**
(86) Номер та дата подання міжнародної заявки, поданої відповідно до Договору РСТ: **РСТ/EP2011/062454, 20.07.2011**

(72) Винахідник(и):
Міхровская-Пяновская Анна Александра (PL/DE),
Майор Юліа (DE),
Хюцлер Йоганнес (DE),
Ньютон Тревор Вілльям (GB/DE),
Еванс Річард Роджер (US/DE),
Кройц Клаус (DE),
Гроссманн Клаус (DE),
Зонг Дшун (DE),
Зімон Анья (DE),
Вітшель Маттіас (DE),
Моберг Вілльям Карл (US/DE),
Парра Рапато Ліліана (ES/DE),
Цюй Тао (CN/DE),
Штельцер Франк (DE),
Краус Гельмут (DE/FR),
Зайтц Томас (DE),
ван дер Клут Андре (NL/DE),
Райнгрубер Рюдігер (DE)

(73) Власник(и):
БАСФ СЕ,
67056 Ludwigshafen, Germany (DE)

(74) Представник:
Петров Андрій Володимирович, реєстр. №139

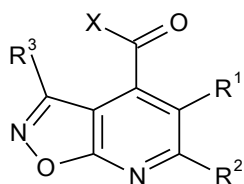
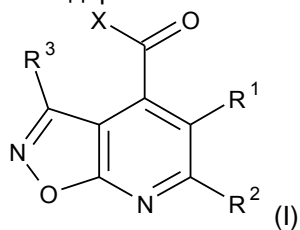
(56) Перелік документів, взятих до уваги експертизою:
DATABASE REGISTRY [Online] CHEMICAL ABSTRACTS, COLUMBUS, OHIO, US; 2008, XP002660620, retrieved from STN Database accession no. 1061838-57-0 compounds 1061838-57-0
DATABASE REGISTRY [Online] CHEMICAL ABSTRACTS, COLUMBUS, OHIO, US; 2009, XP002660621, retrieved from STN Database accession no. 1099890-46-6 compounds 1099890-46-6
VOLOCHNYUK DMITRIY M. et al. Approach to the Library of Fused Pyridine-4-carboxylic Acids by Combes-Type Reaction of Acyl Pyruvates and Electron-Rich Amino Heterocycles// J.COMB. CHEM., vol. 12, no.4, 11 May 2010, pp. 510-517
US 5 510 319, A, 23.04.1996
US 3 541 101, A, 17.11.1970

UA 113392 C2

(54) ГЕРБІЦИДНІ ІЗОКСАЗОЛО[5,4-Ь]ПІРИДИНИ

(57) Реферат:

Застосування ізоксазоло[5,4-Ь]піридинових сполук формули I та застосовних в сільському господарстві солей ізоксазоло[5,4-Ь]піридинових сполук формули I як гербіцидів.



I

Гербіцидні ізоксазоло[5,4-*b*]піридини

Даний винахід відноситься до ізоксазоло[5,4-*b*]піридинів загальної формули I, визначених нижче й до їх застосуванню як гербіцидів. Крім того, винахід відноситься до композицій для захисту рослин і до способу боротьби з небажаною рослинністю.

5 Сполуки, що мають ізоксазоло[5,4-*b*]піридинову частину є відомими з рівня техніки. Документ US2009163545 описує такі сполуки як такі, що змінюють життєздатність для еукаріотичних організмів. Відповідно до заявки WO2009015208, окремі похідні сечовини проявляють антибактеріальну дію. Можливі шляхи синтезу сполук ізоксазоло[5,4-*b*]піридину є відомими з Elbannany et al., Pharmazie (1988) 43(2), 128-129 and Volochnyuk et al., Journal of

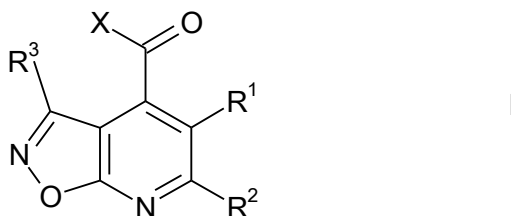
10 Combinatorial Chemistry (2010) 12(4), 510-517.

У сільському господарстві існує постійна потреба в розробці нових діючих речовин, які доповнюють або перевершують способи обробки відносно активності, селективності й екологічно безпеки.

Внаслідок цього задачею даного винаходу є надання хімічних сполук, які є придатними як 15 гербіциди. Зокрема, його задача полягає в тому, щоб ідентифікувати хімічні сполуки з високою гербіцидною активністю, переважно при низьких нормах витрати, залишаючи при цьому бажані рослини, наприклад, культурні рослини, неушкодженими.

Ці та інші задачі вирішуються за допомогою ізоксазоло[5,4-*b*]піридинів формули I, визначених нижче й за допомогою їх застосовних в сільському господарстві солей.

20 Відповідно, даний винахід пропонує ізоксазоло[5,4-*b*]піридини формули I



де в формулі I, змінні є такими, як визначені нижче:

25 R^1 водень, галоген, гідроксил, C_1 - C_6 -алкіл, C_1 - C_6 -галоалкіл, C_1 - C_6 -алкокси- C_1 - C_6 -алкіл, C_3 - C_6 -циклоалкіл, C_3 - C_6 -галоциклоалкіл, C_2 - C_6 -алкеніл, C_2 - C_6 -алкініл, C_1 - C_6 -алкокси, C_1 - C_6 -галоалкокси, феніл, феніл- C_1 - C_4 -алкіл;

R^2 водень, C_1 - C_6 -алкіл, C_1 - C_6 -галоалкіл, C_1 - C_6 -гідроксіалкіл, C_1 - C_6 -алкокси- C_1 - C_6 -алкіл, C_3 - C_6 -циклоалкіл, C_3 - C_6 -галоциклоалкіл, C_1 - C_4 -алкіл- C_3 - C_6 -циклоалкіл, феніл- C_1 - C_4 -алкіл, C_2 - C_6 -алкеніл, C_2 - C_6 -алкініл, C_1 - C_6 -алкокси, C_1 - C_6 -галоалкокси, C_1 - C_6 -алкілтіо, аміно, C_1 - C_6 -алкіламіно, N,N-ді-(C_1 - C_6)-алкіламіно, гетероциклі; гетероциклічні частини R^2 можуть бути незаміщеними або заміщеними одним або декількома радикалами, вибраними з галогену, нітро, C_1 - C_4 -алкілу, C_1 - C_4 -галоалкілу, C_1 - C_4 -алкокси, C_1 - C_4 -галоалкокси, C_1 - C_4 -алкоксикарбонілу, гетероциклілу, фенілу;

35 або R^1 і R^2 разом утворюють C_3 - C_5 -алкандиїл;

R^3 водень, галоген, гідрокси, C_1 - C_6 -алкіл, C_1 - C_6 -галоалкіл, C_1 - C_6 -гідроксіалкіл, C_1 - C_6 -алкокси- C_1 - C_6 -алкіл, C_1 - C_6 -галоалкокси- C_1 - C_6 -алкіл, C_3 - C_6 -циклоалкіл- C_1 - C_6 -алкіл, C_3 - C_6 -галоциклоалкіл- C_1 - C_6 -алкіл, C_3 - C_6 -циклоалкіл, C_3 - C_6 -галоциклоалкіл, C_1 - C_4 -алкіл- C_3 - C_6 -циклоалкіл, C_3 - C_6 -циклоалкеніл, C_3 - C_6 -галоциклоалкеніл, феніл- C_1 - C_6 -алкіл, гетероциклі- C_1 - C_6 -алкіл, C_2 - C_6 -алкеніл, C_2 - C_6 -галоалкеніл, C_2 - C_6 -алкініл, C_2 - C_6 -галоалкініл, C_1 - C_6 -алкокси, C_1 - C_6 -галоалкокси, C_1 - C_6 -алкілтіо, C_1 - C_6 -галоалкілтіо, аміно, C_1 - C_6 -алкіламіно, N,N-ді-(C_1 - C_6)-алкіламіно, гетероциклі, феніл; причому гетероциклічні й фенільні частини R^3 можуть бути незаміщеними або заміщеними одним або декількома радикалами, вибраними з галогену, гідрокси, нітро, ціано, C_1 - C_4 -алкілу, C_1 - C_4 -галоалкілу, C_1 - C_4 -алкокси- C_1 - C_4 -алкілу, C_3 - C_6 -циклоалкілу, C_2 - C_6 -алкенілу, C_2 - C_6 -алкінілу, C_1 - C_4 -алкокси, C_1 - C_4 -галоалкокси, C_1 - C_4 -алкоксикарбонілу, C_1 - C_4 -алкілтіо, C_1 - C_4 -алкілсульфінілу, C_1 - C_4 -алкілсульфонілу, аміно, C_1 - C_4 -алкіламіно, N,N-ді-(C_1 - C_4)-алкіламіно, гетероциклілу, фенілу;

X OR⁴, SR⁵; NR⁶R⁷;

50 R^4 , R^5 водень, C_1 - C_6 -алкіл, C_1 - C_6 -галоалкіл, C_1 - C_6 -гідроксіалкіл, C_1 - C_6 -ціаноалкіл, C_1 - C_6 -алкокси- C_1 - C_6 -алкіл, C_1 - C_6 -алкокси- C_1 - C_6 -алкокси- C_1 - C_6 -алкіл, C_1 - C_6 -галоалкокси- C_1 - C_6 -алкіл, C_2 - C_6 -алкенілокси- C_1 - C_6 -алкіл, C_2 - C_6 -галоалкенілокси- C_1 - C_6 -алкіл, C_1 - C_6 -алкоксикарбоніл- C_1 - C_6 -алкіл, амінокарбоніл- C_1 - C_6 -алкіл, C_1 - C_6 -алкіл-амінокарбоніл- C_1 - C_6 -алкіл, N,N-ді-(C_1 - C_6 -алкіл)-амінокарбоніл- C_1 - C_6 -алкіл, [N-(C_3 - C_6 -циклоалкіл- C_1 - C_6 -алкіл), N-(C_1 - C_6 -алкіл)]-амінокарбоніл- C_1 - C_6 -алкіл, C_1 - C_6 -алкокси-амінокарбоніл- C_1 - C_6 -алкіл, C_2 - C_6 -алкеніл, C_2 - C_6 -галоалкеніл, C_2 - C_6 -

алкініл-С₂-С₆-алкеніл, С₂-С₆-алкініл, С₂-С₆-галоалкініл, гетероцикліл, феніл, гетероциклілкарбоніл, фенілкарбоніл, гетероциклілкарбоніл-С₁-С₆-алкіл, фенілкарбоніл-С₁-С₆-алкіл, гетероцикліл-С₁-С₆-алкіл, феніл-С₁-С₆-алкіл; причому фенільні й гетероциклільні частини R⁴ і R⁵ можуть бути незаміщеними або заміщеними одним або декількома радикалами, вибраними з галогену, С₁-С₄-алкілу, С₁-С₄-галоалкілу, С₁-С₄-алкокси, С₁-С₄-галоалкокси, С₁-С₄-алкоксикарбонілу, гетероциклілу, фенілу;

R⁶, R⁷ водень, С₁-С₆-алкіл, С₁-С₆-галоалкіл, С₂-С₆-алкеніл, С₂-С₆-алкініл, С₁-С₆-алкокси, феніл-С₁-С₆-алкокси, феніл, феніл, заміщений галогеном, С₃-С₆-циклоалкіл, С₃-С₆-галоциклоалкіл, SO₂R⁸;

R⁸ С₁-С₆-алкіл, С₁-С₆-галоалкіл, С₂-С₆-алкеніл, С₂-С₆-алкініл, С₃-С₆-циклоалкіл, С₃-С₆-галоциклоалкіл, феніл; причому фенільна частина R⁸ може бути незаміщеною або заміщеною одним або декількома радикалами, вибраними з галогену, С₁-С₄-алкілу, С₁-С₄-галоалкілу, С₁-С₄-алкокси, С₁-С₄-галоалкокси, С₁-С₄-алкоксикарбонілу, гетероциклілу, фенілу;

і їх застосовні в сільському господарстві солі.

Крім того, об'єктом даного винаходу є застосування ізоксазоло[5,4-*b*]піридинів формули I як гербіцидів, тобто їх застосування для боротьби зі шкідливими рослинами.

Також даний винахід пропонує композиції, що містять щонайменше один ізоксазоло[5,4-*b*]піридин формули I і допоміжні речовини, звичайні для приготування засобів захисту рослин.

Крім того, даний винахід пропонує спосіб боротьби з небажаною рослинністю, при якому гербіцидно ефективною кількістю щонайменше одного ізоксазоло[5,4-*b*]піридину формули I впливають на рослини, їх насіння і/або їх місце розповсюдження. Застосування може здійснюватися до, під час і/або після, переважно під час і/або після проростання небажаних рослин.

Крім того, винахід відноситься до способів одержання ізоксазоло[5,4-*b*]піридинів формули I.

Далі варіанти здійснення даного винаходу є очевидними з формули винаходу, опису і прикладів. Зрозуміло, що зазначені вище й пояснювані ще надалі ознаки об'єкту згідно з винаходом застосовуються не тільки в наведеній кожного разу комбінації, а також в інших комбінаціях, не виходячи за межі винаходу.

Як використовуються тут, поняття "регулювання" і "боротьба" є синонімами.

Як використовуються тут, поняття "небажана рослинність", "бур'яни" і "шкідливі рослини" є синонімами.

Якщо ізоксазоло[5,4-*b*]піридини формули I, описані тут, здатні утворювати геометричні ізомери, наприклад *E/Z* ізомери, то в композиціях згідно з винаходом можливо використовувати як чисті ізомери, так і їх суміші.

Якщо ізоксазоло[5,4-*b*]піридини формули I, описані тут, мають один або більше центрів хіральності і, як наслідок, існують у вигляді енантіомерів або діастереомерів, то в композиціях згідно з винаходом можливо використовувати як чисті енантіомери й діастереомери, так і їх суміші.

Поняття, що використовують для органічних груп при визначенні змінних, наприклад, вираз "алкіл", представляють собою збірні поняття, які представляють окремих членів цих груп органічних одиниць.

Префікс С_x-С_y вказує кількість можливих атомів вуглецю в окремому випадку.

галоген: фтор, хлор, бром або йод, зокрема фтор, хлор або бром;

алкіл і алкільні частини складених груп, такі як алкокси, алкіламіно, алкілтіо, алкоксикарбоніл: насичені нерозгалужені або розгалужені вуглеводневі радикали, що мають від 1 до 10 атомів вуглецю, переважно С₁-С₆-алкіл або С₁-С₄-алкіл, такий як метил, етил, пропіл, 1-метилетил, бутіл, 1-метилпропіл, 2-метилпропіл, 1,1-диметиламіно, пентил, 1-метилбутил, 2-метилбутил, 3-метилбутил, 2,2-диметилпропіл, 1-етилпропіл, гексил, 1,1-диметилпропіл, 1,2-диметилпропіл, 1-метилпентил, 2-метилпентил, 3-метилпентил, 4-метилпентил, 1,1-диметилбутил, 1,2-диметилбутил, 1,3-диметилбутил, 2,2-диметилбутил, 2,3-диметилбутил, 3,3-диметилбутил, 1-етилбутил, 2-етилбутил, 1,1,2-триметилпропіл, 1,2,2-триметилпропіл, 1-етил-1-метилпропіл і 1-етил-2-метилпропіл; гептил, октил, 2-етилгексил і їх позиційні ізомери; ноніл, децил і їх позиційні ізомери;

галоалкіл: нерозгалужені або розгалужені алкільні групи, що мають від 1 до 10 атомів вуглецю (як зазначено вище), переважно С₁-С₆-галоалкіл або С₁-С₄-галоалкіл, де деякі або всі атоми водню в цих групах заміщені атомами галогену, зазначеними вище. В одному варіанті здійснення, алкільні групи заміщені щонайменше один раз або повністю окремим атомом галогену, переважно фтором, хлором або бромом. В іншому варіанті здійснення, алкільні групи частково або повністю галогеновані різними атомами галогену; у випадку заміщень різними атомами галогенів, переважною є комбінація хлору і фтору. Особлива перевага надається (С₁-

C₃)-галоалкілу, більш переважно (C₁-C₂)-галоалкілу, такому як хлорметил, бромметил, дихлорметил, трихлорметил, фторметил, дифторметил, трифторметил, хлорфторметил, дихлорфторметил, хлордифторметил, 1-хлоретил, 1-брометил, 1-фторетил, 2-фторетил, 2,2-дифторетил, 2,2,2-трифторетил, 2-хлор-2-фторетил, 2-хлор-2,2-дифторетил, 2,2-дихлор-2-фторетил, 2,2,2-трихлоретил, пентафторетил або 1,1,1-трифторпроп-2-іл;

алкеніл і також алкенільні частини складених груп, такі як алкенілокси: ненасичені нерозгалужені або розгалужені вуглеводневі радикали, що мають від 2 до 10 атомів вуглецю і один подвійний зв'язок в будь-якому положенні. Відповідно до винаходу, може бути переважним застосування малих алкенільних груп, таких як (C₂-C₆)-алкеніл; з іншого боку, також може бути переважним використання великих алкенільних груп, таких як (C₅-C₈)-алкеніл. Прикладами C₂-C₆-алкенільних груп є: етеніл, 1-пропеніл, 2-пропеніл, 1-метилетеніл, 1-бутеніл, 2-бутеніл, 3-бутеніл, 1-метил-1-пропеніл, 2-метил-1-пропеніл, 1-метил-2-пропеніл, 2-метил-2-пропеніл, 1-пентеніл, 2-пентеніл, 3-пентеніл, 4-пентеніл, 1-метил-1-бутеніл, 2-метил-1-бутеніл, 3-метил-1-бутеніл, 1-метил-2-бутеніл, 2-метил-2-бутеніл, 3-метил-2-бутеніл, 1-метил-3-бутеніл, 2-метил-3-бутеніл, 3-метил-3-бутеніл, 1,1-диметил-2-пропеніл, 1,2-диметил-1-пропеніл, 1,2-диметил-2-пропеніл, 1-етил-1-пропеніл, 1-етил-2-пропеніл, 1-гексеніл, 2-гексеніл, 3-гексеніл, 4-гексеніл, 5-гексеніл, 1-метил-1-пентеніл, 2-метил-1-пентеніл, 3-метил-1-пентеніл, 4-метил-1-пентеніл, 1-метил-2-пентеніл, 2-метил-2-пентеніл, 3-метил-2-пентеніл, 4-метил-2-пентеніл, 1-метил-3-пентеніл, 2-метил-3-пентеніл, 3-метил-3-пентеніл, 4-метил-3-пентеніл, 1-метил-4-пентеніл, 2-метил-4-пентеніл, 3-метил-4-пентеніл, 4-метил-4-пентеніл, 1,1-диметил-2-бутеніл, 1,1-диметил-3-бутеніл, 1,2-диметил-1-бутеніл, 1,2-диметил-2-бутеніл, 1,2-диметил-3-бутеніл, 1,3-диметил-1-бутеніл, 1,3-диметил-2-бутеніл, 1,3-диметил-3-бутеніл, 2,2-диметил-3-бутеніл, 2,3-диметил-1-бутеніл, 2,3-диметил-2-бутеніл, 2,3-диметил-3-бутеніл, 3,3-диметил-1-бутеніл, 3,3-диметил-2-бутеніл, 1-етил-1-бутеніл, 1-етил-2-бутеніл, 1-етил-3-бутеніл, 2-етил-1-бутеніл, 2-етил-2-бутеніл, 2-етил-3-бутеніл, 1,1,2-триметил-2-пропеніл, 1-етил-1-метил-2-пропеніл, 1-етил-2-метил-1-пропеніл і 1-етил-2-метил-2-пропеніл;

алкініл і алкінільні частини в складених групах: нерозгалужені або розгалужені вуглеводневі групи, що мають від 2 до 10 атомів вуглецю і один або два потрійних зв'язки в будь-якому положенні, наприклад C₂-C₆-алкініл, такий як етиніл, 1-пропініл, 2-пропініл, 1-бутиніл, 2-бутиніл, 3-бутиніл, 1-метил-2-пропініл, 1-пентиніл, 2-пентиніл, 3-пентиніл, 4-пентиніл, 1-метил-2-бутиніл, 1-метил-3-бутиніл, 2-метил-3-бутиніл, 3-метил-1-бутиніл, 1,1-диметил-2-пропініл, 1-етил-2-пропініл, 1-гексиніл, 2-гексиніл, 3-гексиніл, 4-гексиніл, 5-гексиніл, 1-метил-2-пентиніл, 1-метил-3-пентиніл, 1-метил-4-пентиніл, 2-метил-3-пентиніл, 2-метил-4-пентиніл, 3-метил-1-пентиніл, 3-метил-4-пентиніл, 4-метил-1-пентиніл, 4-метил-2-пентиніл, 1,1-диметил-2-бутиніл, 1,1-диметил-3-бутиніл, 1,2-диметил-3-бутиніл, 2,2-диметил-3-бутиніл, 3,3-диметил-1-бутиніл, 1-етил-2-бутиніл, 1-етил-3-бутиніл, 2-етил-3-бутиніл і 1-етил-1-метил-2-пропініл;

циклоалкіл і також циклоалкільні частини в складених групах: моно- або біциклічні насичені вуглеводневі групи, що мають від 3 до 10, зокрема від 3 до 6, вуглецевих кільцевих членів. Прикладами для C₃-C₆-циклоалкілу є: циклопропіл, циклобутил, циклопентил, циклогексил, циклогептил або циклооктил. Приклади біциклічних радикалів включають біцикло[2.2.1]гептил, біцикло[3.1.1]гептил, біцикло[2.2.2]октил і біцикло[3.2.1]октил;

галоциклоалкіл і галоциклоалкільні частини в складених групах: моноциклічні насичені вуглеводневі групи, що мають від 3 до 10 вуглецевих кільцевих членів (як зазначено вище), в яких деякі або всі атоми водню можуть бути заміщені атомами галогену, зазначеними вище, зокрема фтором, хлором і бромом;

циклоалкеніл: моноциклічні мононенасичені вуглеводневі групи, що мають від 3 до 10, від 3 до 8, від 3 до 6, переважно від 5 до 6, вуглецевих кільцевих членів, такі як циклопентен-1-іл, циклопентен-3-іл, циклогексен-1-іл, циклогексен-3-іл, циклогексен-4-іл і т. п.;

алкокси: алкільна група, як визначено вище, яка зв'язана через кисень, що переважно має від 1 до 10, більш переважно від 1 до 6 або від 1 до 4 атомів вуглецю. Прикладами є: метокси, етокси, n-пропокси, 1-метилетокси, бутокси, 1-метилпропокси, 2-метилпропокси або 1,1-диметилетокси, а також, наприклад, пентокси, 1-метилбутокси, 2-метилбутокси, 3-метилбутокси, 1,1-диметилпропокси, 1,2-диметилпропокси, 2,2-диметилпропокси, 1-етилпропокси, гексокси, 1-метилпентокси, 2-метилпентокси, 3-метилпентокси, 4-метилпентокси, 1,1-диметилбутокси, 1,2-диметилбутокси, 1,3-диметилбутокси, 2,2-диметилбутокси, 2,3-диметилбутокси, 3,3-диметилбутокси, 1-етилбутокси, 2-етилбутокси, 1,1,2-триметилпропокси, 1,2,2-триметилпропокси, 1-етил-1-метилпропокси або 1-етил-2-метилпропокси;

галоалкокси: алкокси як визначено вище, де деякі або всі атоми водню в цих групах заміщені атомами галогену, як описано вище під галоалкілом, зокрема фтором, хлором або бромом. Прикладами є OCH₂F, OCHF₂, OCF₃, OCH₂Cl, OCHCl₂, OCCl₃, хлорфторметокси,

- дихлорфторметокси, хлордифторметокси, 2-фторетокси, 2-хлоретокси, 2-брометокси, 2-йодетокси, 2,2-дифторетокси, 2,2,2-трифторетокси, 2-хлор-2-фторетокси, 2-хлор-2,2-дифторетокси, 2,2-дихлор-2-фторетокси, 2,2,2-трихлоретокси, OC_2F_5 , 2-фторпропокси, 3-фторпропокси, 2,2-дифторпропокси, 2,3-дифторпропокси, 2-хлорпропокси, 3-хлорпропокси, 2,3-дихлорпропокси, 2-бромпропокси, 3-бромпропокси, 3,3,3-трифторпропокси, 3,3,3-трихлорпропокси, $\text{OCH}_2\text{-C}_2\text{F}_5$, $\text{OCF}_2\text{-C}_2\text{F}_5$, 1-(CH_2F)-2-фторетокси, 1-(CH_2Cl)-2-хлоретокси, 1-(CH_2Br)-2-брометокси, 4-фторбутокси, 4-хлорбутокси, 4-бромбутокси або нонафторбутокси; і також 5-фторпентокси, 5-хлорпентокси, 5-бромпентокси, 5-йодпентокси, ундекафторпентокси, 6-фторгексокси, 6-хлоргексокси, 6-бромгексокси, 6-йодгексокси або додекафторгексокси;
- арил: від 6 до 10-членне, ароматичне вуглецеве кільце з 6, 7, 8, 9 або 10 атомами вуглецю. Прикладами переважного арилу є феніл або нафтил;
- гетероцикл: 5-, 6-, 7-, 8-, 9- або 10-членний насичене, частково ненасичене або ароматичне моноциклічне кільце або біциклічна кільцева система, яка містить 1, 2, 3 або 4 гетероатоми з групи, що складається з O, N і S як кільцеві члени, і крім того, можуть містити одну або дві CO, SO, SO_2 групи як кільцеві члени, причому даний гетероцикл може бути приєднаний через атом вуглецю або, якщо є, через атом азоту. Зокрема:
- трьох-, п'яти- або шестичленний насичений або частково ненасичений гетероцикл, що містить один, два, три або чотири гетероатоми з групи, що складається з O, N і S як кільцеві члени: наприклад моноциклічні насичені або частково ненасичені гетероцикли, які, на додаток до вуглецевих кільцевих членів, включають один, два або три атоми азоту і/або один атом кисню або сірки або один або два атоми кисню і/або сірки, наприклад азиридин, оксиран, 2-тетрагідрофураніл, 3-тетрагідрофураніл, 2-тетрагідротієніл, 3-тетрагідротієніл, 2-піролідиніл, 3-піролідиніл, 3-ізоксазолідиніл, 4-ізоксазолідиніл, 5-ізоксазолідиніл, 3-ізотіазолідиніл, 4-ізотіазолідиніл, 5-ізотіазолідиніл, 3-піразолідиніл, 4-піразолідиніл, 5-піразолідиніл, 2-оксазолідиніл, 4-оксазолідиніл, 5-оксазолідиніл, 2-тіазолідиніл, 4-тіазолідиніл, 5-тіазолідиніл, 2-імідазолідиніл, 4-імідазолідиніл, 1,2,4-оксадіазолідин-3-іл, 1,2,4-оксадіазолідин-5-іл, 1,2,4-тіадіазолідин-3-іл, 1,2,4-тіадіазолідин-5-іл, 1,2,4-тріазолідин-3-іл, 1,3,4-оксадіазолідин-2-іл, 1,3,4-тіадіазолідин-2-іл, 1,3,4-тріазолідин-2-іл, 2,3-дигідрофур-2-іл, 2,3-дигідрофур-3-іл, 2,4-дигідрофур-2-іл, 2,4-дигідрофур-3-іл, 2,3-дигідротієн-2-іл, 2,3-дигідротієн-3-іл, 2,4-дигідротієн-2-іл, 2,4-дигідротієн-3-іл, 2-піролін-2-іл, 2-піролін-3-іл, 3-піролін-2-іл, 3-піролін-3-іл, 2-ізоксазолін-3-іл, 3-ізоксазолін-3-іл, 4-ізоксазолін-3-іл, 2-ізоксазолін-4-іл, 3-ізоксазолін-4-іл, 4-ізоксазолін-4-іл, 2-ізоксазолін-5-іл, 3-ізоксазолін-5-іл, 4-ізоксазолін-5-іл, 2-ізотіазолін-3-іл, 3-ізотіазолін-3-іл, 4-ізотіазолін-3-іл, 2-ізотіазолін-4-іл, 3-ізотіазолін-4-іл, 4-ізотіазолін-4-іл, 2-ізотіазолін-5-іл, 3-ізотіазолін-5-іл, 4-ізотіазолін-5-іл, 2,3-дигідропіразол-1-іл, 2,3-дигідропіразол-2-іл, 2,3-дигідропіразол-3-іл, 2,3-дигідропіразол-4-іл, 2,3-дигідропіразол-5-іл, 3,4-дигідропіразол-1-іл, 3,4-дигідропіразол-3-іл, 3,4-дигідропіразол-4-іл, 3,4-дигідропіразол-5-іл, 4,5-дигідропіразол-1-іл, 4,5-дигідропіразол-3-іл, 4,5-дигідропіразол-4-іл, 4,5-дигідропіразол-5-іл, 2,3-дигідрооксазол-2-іл, 2,3-дигідрооксазол-3-іл, 2,3-дигідрооксазол-4-іл, 2,3-дигідрооксазол-5-іл, 3,4-дигідрооксазол-2-іл, 3,4-дигідрооксазол-3-іл, 3,4-дигідрооксазол-4-іл, 3,4-дигідрооксазол-5-іл, 3,4-дигідрооксазол-2-іл, 3,4-дигідрооксазол-3-іл, 3,4-дигідрооксазол-4-іл, 2-піперидиніл, 3-піперидиніл, 4-піперидиніл, 1,3-діоксан-5-іл, 2-тетрагідропіраніл, 4-тетрагідропіраніл, 2-тетрагідротієніл, 3-гексагідропіридазиніл, 4-гексагідропіридазиніл, 2-гексагідропіримідиніл, 4-гексагідропіримідиніл, 5-гексагідропіримідиніл, 2-пиперазинил, 1,3,5-гексагідротріазин-2-іл і 1,2,4-гексагідротріазин-3-іл, а також відповідні -іліденові радикали;
 - семичленний насичений або частково ненасичений гетероцикл, що містить один, два, три або чотири гетероатоми з групи, що складається з O, N і S як кільцеві члени: наприклад моно- і біциклічні гетероцикли, що мають 7 кільцевих членів, які на додаток до вуглецевих кільцевих членів, включають один, два або три атоми азоту і/або один атом кисню або сірки або один або два атоми кисню і/або сірки, наприклад тетра- і гексагідроазепініл, такий як 2,3,4,5-тетрагідро[1H]азепін-1-, -2-, -3-, -4-, -5-, -6- або -7-іл, 3,4,5,6-тетрагідро[2H]азепін-2-, -3-, -4-, -5-, -6- або -7-іл, 2,3,4,7-тетрагідро[1H]азепін-1-, -2-, -3-, -4-, -5-, -6- або -7-іл, 2,3,6,7-тетрагідро[1H]азепін-1-, -2-, -3-, -4-, -5-, -6- або -7-іл, гексагідроазепін-1-, -2-, -3- або -4-іл, тетра- і гексагідрооксепініл, такий як 2,3,4,5-тетрагідро[1H]оксепін-2-, -3-, -4-, -5-, -6- або -7-іл, 2,3,4,7-тетрагідро[1H]оксепін-2-, -3-, -4-, -5-, -6- або -7-іл, 2,3,6,7-тетрагідро[1H]оксепін-2-, -3-, -4-, -5-, -6- або -7-іл, гексагідроазепін-1-, -2-, -3- або -4-іл, тетра- і гексагідро-1,3-діазепініл, тетра- і гексагідро-1,4-діазепініл, тетра- і гексагідро-1,3-оксазепініл, тетра- і гексагідро-1,4-оксазепініл, тетра- і гексагідро-1,3-діоксепініл, тетра- і гексагідро-1,4-діоксепініл і відповідні -іліденові радикали;
 - п'яти- або шестичленний ароматичний гетероцикл (=гетероароматичний радикал), який містить один, два, три або чотири гетероатоми з групи, що складається з кисню, азоту й сірки,

наприклад 5-членний гетероарил, який приєднаний через вуглець і містить від одного до трьох атомів азоту або один або два атоми азоту і один атом сірки або кисню як кільцеві члени, такий як 2-фурил, 3-фурил, 2-тієніл, 3-тієніл, 2-піроліл, 3-піроліл, 3-ізоксазоліл, 4-ізоксазоліл, 5-ізоксазоліл, 3-ізотіазоліл, 4-ізотіазоліл, 5-ізотіазоліл, 3-піразоліл, 4-піразоліл, 5-піразоліл, 2-оксазоліл, 4-оксазоліл, 5-оксазоліл, 2-тіазоліл, 4-тіазоліл, 5-тіазоліл, 2-імідазоліл, 4-імідазоліл, 1,2,4-оксадіазол-3-іл, 1,2,4-оксадіазол-5-іл, 1,2,4-тіадіазол-3-іл, 1,2,4-тіадіазол-5-іл, 1,2,4-тріазол-3-іл, 1,3,4-оксадіазол-2-іл, 1,3,4-тіадіазол-2-іл і 1,3,4-тріазол-2-іл; 5-членний гетероарил, який приєднаний через азот і містить від одного до трьох атомів азоту як кільцеві члени, такий як пірол-1-іл, піразол-1-іл, імідазол-1-іл, 1,2,3-тріазол-1-іл і 1,2,4-тріазол-1-іл; 6-членний гетероарил, який містить один, два або три атоми азоту як кільцеві члени, такий як піридин-2-іл, піридин-3-іл, піридин-4-іл, 3-піридазиніл, 4-піридазиніл, 2-піримідиніл, 4-піримідиніл, 5-піримідиніл, 2-піразиніл, 1,3,5-тріазин-2-іл і 1,2,4-тріазин-3-іл;

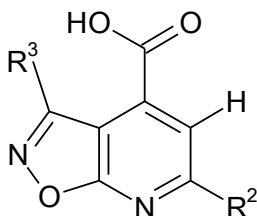
Ізоксазоло[5,4-b]піридини формули I також можуть знаходитися у вигляді N-оксидів і/або їх застосовних в сільському господарстві солей, природа даної солі, як правило, не має значення. Загалом, придатними солями є солі тих катіонів або кислотно-адитивні солі тих кислот, катіони яких, відповідно, аніони яких не знижують гербіцидну дію ізоксазоло[5,4-b]піридинів формули I.

Придатними катіонами, зокрема, є іони лужних металів, переважно літію, натрію або калію, лужноземельних металів, переважно кальцію або магнію, і перехідних металів, переважно марганцю, міді, цинку або заліза. Рівним чином, можливо застосовувати як катіон амоній, де, при бажанні, від одного до чотирьох атомів водню можуть бути заміщені C₁-C₄-алкілом, гідрокси-C₁-C₄-алкілом, C₁-C₄-алкокси-C₁-C₄-алкілом, гідрокси-C₁-C₄-алкокси-C₁-C₄-алкілом, фенілом або бензилом, переважно амоній, диметиламоній, діізопропіламоній, тетраметиламоній, тетрабутиламоній, 2-(2-гідроксіет-1-окси)ет-1-иламоній, ді(2-гідроксіет-1-іл)амоній, триметилбензиламоній. Іншими придатними є іони фосфонію, іони сульфонію, переважно три(C₁-C₄-алкіл)сульфонію або іони сульфоксонію, переважно три(C₁-C₄-алкіл)сульфоксонію.

Аніонами придатних кислотно-адитивних солей в першу чергу є хлорид, бромід, фторид, гідросульфат, сульфат, дигідрофосфат, гідрофосфат, нітрат, гідрокарбонат, карбонат, гексафторосилікат, гексафторофосфат, бензоат і аніони C₁-C₄-алканових кислот, переважно формиат, ацетат, пропіонат і бутират або трифторацетат.

Загалом, ізоксазоло[5,4-b]піридини формули I є придатними як гербіциди.

Ізоксазоло[5,4-b]піридинові сполуки формули I.a (формула I.a відповідає формулі I, причому R¹ означає водень, X означає OR⁴ і R⁴ означає водень)



I.a

або їх застосовні в сільському господарстві солі зокрема є застосовними як гербіциди.

Переважними формами здійснення ізоксазоло[5,4-b]піридинових сполук формули I.a є сполуки від 1.a.1 до 1.a.152 згідно з таблицею 1, причому кожний рядок таблиці 1 представляє одну сполуку формули I:

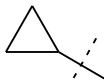
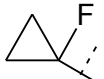
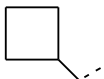

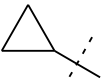
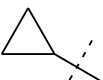
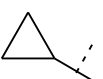
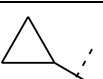
Таблиця 1

Сполуки ізоксазоло[5,4-b]піридину від 1.a.1 до 1.a.152

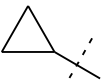
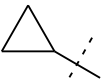
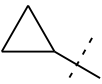
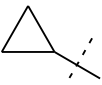
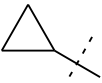
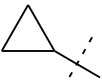
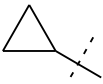
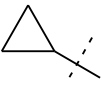
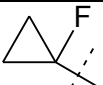

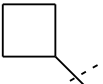

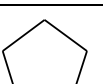
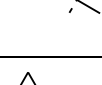





№	R ²	R ³
1.a.1.	CH ₃	H
1.a.2.	CH ₃	CH ₃
1.a.3.	CH ₃	CH ₂ CH ₃
1.a.4.	CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃
1.a.5.	CH ₃	CH(CH ₃) ₂
1.a.6.	CH ₃	OCH(CH ₃) ₂
1.a.7.	CH ₃	CH ₂ C(CH ₃) ₃
1.a.8.	CH ₃	C(CH ₃) ₃
1.a.9.	CH ₃	OC(CH ₃) ₃

Таблиця 1

Сполуки ізоксазоло[5,4-b]піридину від 1.a.1 до 1.a.152

№	R ²	R ³
1.a.10.	CH ₃	
1.a.11.	CH ₃	
1.a.12.	CH ₃	
1.a.13.	CH ₃	
1.a.14.	CH ₃	C ₆ H ₅
1.a.15.	CH ₃	2-Cl-C ₆ H ₄
1.a.16.	CH ₃	2-F-C ₆ H ₄
1.a.17.	CH ₃	2-CH ₃ O-C ₆ H ₄
1.a.18.	CH ₃	2-CF ₃ -C ₆ H ₄
1.a.19.	CH ₃	3-Cl-C ₆ H ₄
1.a.20.	CH ₃	3-F-C ₆ H ₄
1.a.21.	CH ₃	3-CH ₃ O-C ₆ H ₄
1.a.22.	CH ₃	3-CF ₃ -C ₆ H ₄
1.a.23.	CH ₃	4-Cl-C ₆ H ₄
1.a.24.	CH ₃	4-F-C ₆ H ₄
1.a.25.	CH ₃	4-CH ₃ O-C ₆ H ₄
1.a.26.	CH ₃	4-CF ₃ -C ₆ H ₄
1.a.27.	CH ₃	2-Cl,3-Cl-C ₆ H ₃
1.a.28.	CH ₃	2-Cl,3-F-C ₆ H ₃
1.a.29.	CH ₃	2-F,3-Cl-C ₆ H ₃
1.a.30.	CH ₃	2-F,3-F-C ₆ H ₃
1.a.31.	CH ₃	2-Cl,4-Cl-C ₆ H ₃
1.a.32.	CH ₃	2-Cl,4-F-C ₆ H ₃
1.a.33.	CH ₃	2-F,4-Cl-C ₆ H ₃
1.a.34.	CH ₃	2-F,4-F-C ₆ H ₃
1.a.35.	CH ₃	3-Cl,5-Cl-C ₆ H ₃
1.a.36.	CH ₃	3-Cl,5-F-C ₆ H ₃
1.a.37.	CH ₃	3-F,5-Cl-C ₆ H ₃
1.a.38.	CH ₃	3-F,5-F-C ₆ H ₃
1.a.39.		H
1.a.40.		CH ₃
1.a.41.		CH ₂ CH ₃
1.a.42.		CH ₂ CH ₂ CH ₃

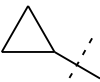
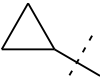
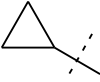
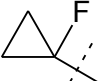
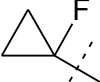
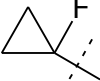
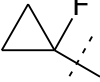
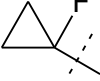
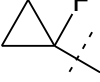


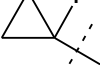
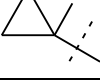
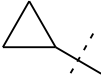
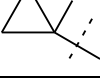
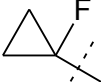
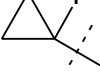

Сполуки ізоксазоло[5,4-*b*]піридину від 1.а.1 до 1.а.152

№	R ²	R ³
1.а.43.		CH(CH ₃) ₂
1.а.44.		CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
1.а.45.		CH ₂ CH(CH ₃) ₂
1.а.46.		C(CH ₃) ₃
1.а.47.		CF ₃
1.а.48.		
1.а.49.		
1.а.50.		
1.а.51.		
1.а.52.		C ₆ H ₅
1.а.53.		2-Cl-C ₆ H ₄
1.а.54.		2-F-C ₆ H ₄
1.а.55.		2-CH ₃ O-C ₆ H ₄
1.а.56.		2-CF ₃ -C ₆ H ₄
1.а.57.		3-Cl-C ₆ H ₄

Сполуки ізоксазоло[5,4-*b*]піридину від 1.а.1 до 1.а.152

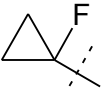
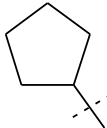
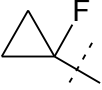
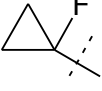



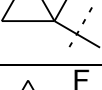


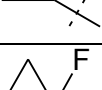


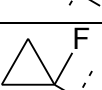
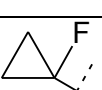

№	R ²	R ³
1.а.58.		3-F-C ₆ H ₄
1.а.59.		3-CH ₃ O-C ₆ H ₄
1.а.60.		3-CF ₃ -C ₆ H ₄
1.а.61.		4-Cl-C ₆ H ₄
1.а.62.		4-F-C ₆ H ₄
1.а.63.		4-CH ₃ O-C ₆ H ₄
1.а.64.		4-CF ₃ -C ₆ H ₄
1.а.65.		2-Cl,3-Cl-C ₆ H ₃
1.а.66.		2-Cl,3-F-C ₆ H ₃
1.а.67.		2-F,3-Cl-C ₆ H ₃
1.а.68.		2-F,3-F-C ₆ H ₃
1.а.69.		2-Cl,4-Cl-C ₆ H ₃
1.а.70.		2-Cl,4-F-C ₆ H ₃
1.а.71.		2-F,4-Cl-C ₆ H ₃
1.а.72.		2-F,4-F-C ₆ H ₃
1.а.73.		3-Cl,5-Cl-C ₆ H ₃

Сполуки ізоксазоло[5,4-*b*]піридину від 1.а.1 до 1.а.152

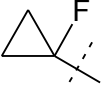
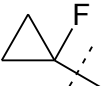
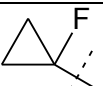
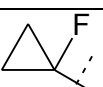
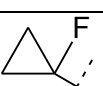
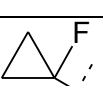
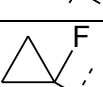
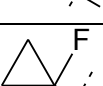


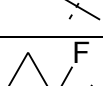
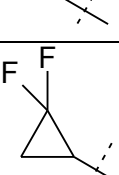
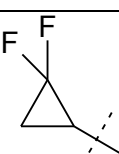
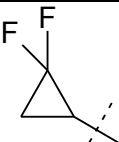
№	R ²	R ³
1.а.74.		3-Cl,5-F-C ₆ H ₃
1.а.75.		3-F,5-Cl-C ₆ H ₃
1.а.76.		3-F,5-F-C ₆ H ₃
1.а.77.		H
1.а.78.		CH ₃
1.а.79.		CH ₂ CH ₃
1.а.80.		CH ₂ CH ₂ CH ₃
1.а.81.		CH(CH ₃) ₂
1.а.82.		CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
1.а.83.		CH ₂ CH(CH ₃) ₂
1.а.84.		C(CH ₃) ₃
1.а.85.		CF ₃
1.а.86.		
1.а.87.		
1.а.88.		

Таблиця 1

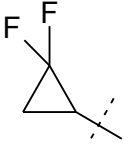
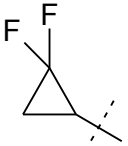
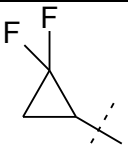
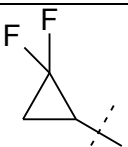
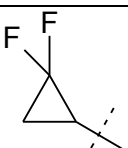
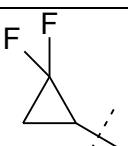
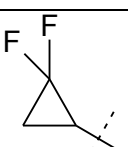
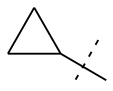
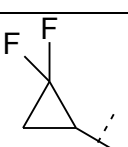

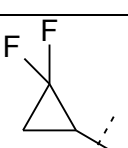
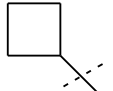
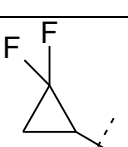
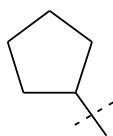
Сполуки ізоксазоло[5,4-*b*]піридину від 1.а.1 до 1.а.152

№	R ²	R ³
1.a.89.		
1.a.90.		C ₆ H ₅
1.a.91.		2-Cl-C ₆ H ₄
1.a.92.		2-F-C ₆ H ₄
1.a.93.		2-CH ₃ O-C ₆ H ₄
1.a.94.		2-CF ₃ -C ₆ H ₄
1.a.95.		3-Cl-C ₆ H ₄
1.a.96.		3-F-C ₆ H ₄
1.a.97.		3-CH ₃ O-C ₆ H ₄
1.a.98.		3-CF ₃ -C ₆ H ₄
1.a.99.		4-Cl-C ₆ H ₄
1.a.100.		4-F-C ₆ H ₄
1.a.101.		4-CH ₃ O-C ₆ H ₄
1.a.102.		4-CF ₃ -C ₆ H ₄
1.a.103.		2-Cl,3-Cl-C ₆ H ₃

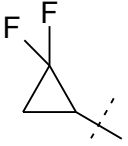
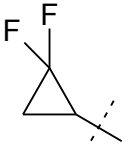
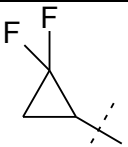
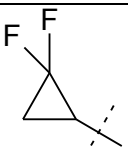
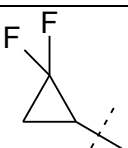
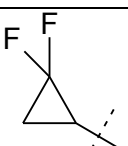
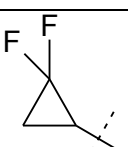
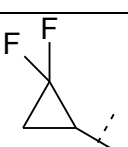
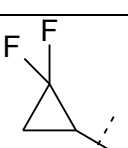
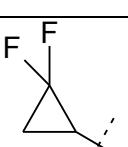
Сполуки ізоксазоло[5,4-*b*]піридину від 1.а.1 до 1.а.152

№	R ²	R ³
1.а.104.		2-Cl,3-F-C ₆ H ₃
1.а.105.		2-F,3-Cl-C ₆ H ₃
1.а.106.		2-F,3-F-C ₆ H ₃
1.а.107.		2-Cl,4-Cl-C ₆ H ₃
1.а.108.		2-Cl,4-F-C ₆ H ₃
1.а.109.		2-F,4-Cl-C ₆ H ₃
1.а.110.		2-F,4-F-C ₆ H ₃
1.а.111.		3-Cl,5-Cl-C ₆ H ₃
1.а.112.		3-Cl,5-F-C ₆ H ₃
1.а.113.		3-F,5-Cl-C ₆ H ₃
1.а.114.		3-F,5-F-C ₆ H ₃
1.а.115.		H
1.а.116.		CH ₃
1.а.117.		CH ₂ CH ₃

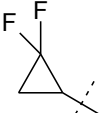
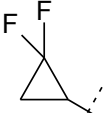
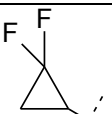
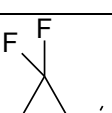
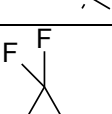
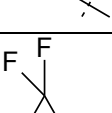
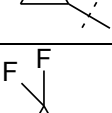
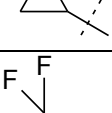
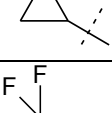
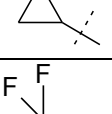
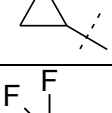
Сполуки ізоксазоло[5,4-b]піридину від 1.а.1 до 1.а.152

№	R ²	R ³
I.a.118.		CH ₂ CH ₂ CH ₃
I.a.119.		CH(CH ₃) ₂
I.a.120.		CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
I.a.121.		CH ₂ CH(CH ₃) ₂
I.a.122.		C(CH ₃) ₃
I.a.123.		CF ₃
I.a.124.		
I.a.125.		
I.a.126.		
I.a.127.		

Сполуки ізоксазоло[5,4-*b*]піридину від 1.а.1 до 1.а.152

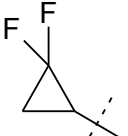
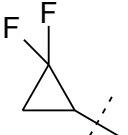
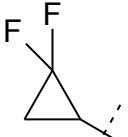
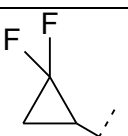
№	R ²	R ³
1.а.128.		C ₆ H ₅
1.а.129.		2-Cl-C ₆ H ₄
1.а.130.		2-F-C ₆ H ₄
1.а.131.		2-CH ₃ O-C ₆ H ₄
1.а.132.		2-CF ₃ -C ₆ H ₄
1.а.133.		3-Cl-C ₆ H ₄
1.а.134.		3-F-C ₆ H ₄
1.а.135.		3-CH ₃ O-C ₆ H ₄
1.а.136.		3-CF ₃ -C ₆ H ₄
1.а.137.		4-Cl-C ₆ H ₄

Сполуки ізоксазоло[5,4-*b*]піридину від 1.а.1 до 1.а.152

№	R ²	R ³
1.а.138.		4-F-C ₆ H ₄
1.а.139.		4-CH ₃ O-C ₆ H ₄
1.а.140.		4-CF ₃ -C ₆ H ₄
1.а.141.		2-Cl,3-Cl-C ₆ H ₃
1.а.142.		2-Cl,3-F-C ₆ H ₃
1.а.143.		2-F,3-Cl-C ₆ H ₃
1.а.144.		2-F,3-F-C ₆ H ₃
1.а.145.		2-Cl,4-Cl-C ₆ H ₃
1.а.146.		2-Cl,4-F-C ₆ H ₃
1.а.147.		2-F,4-Cl-C ₆ H ₃
1.а.148.		2-F,4-F-C ₆ H ₃

Таблиця 1

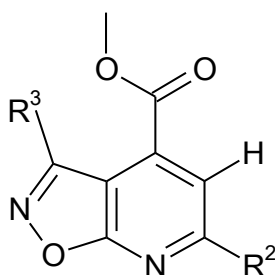
Сполуки ізоксазоло[5,4-*b*]піридину від 1.а.1 до 1.а.152

№	R ²	R ³
I.a.149.		3-Cl,5-Cl-C ₆ H ₃
I.a.150.		3-Cl,5-F-C ₆ H ₃
I.a.151.		3-F,5-Cl-C ₆ H ₃
I.a.152.		3-F,5-F-C ₆ H ₃

Крім того, як гербіциди зокрема є застосовними наступні ізоксазоло[5,4-*b*]піридинові сполуки формули I:

Таблиця 2: Ізоксазоло[5,4-*b*]піридинові сполуки від I.b.1 до I.b.152

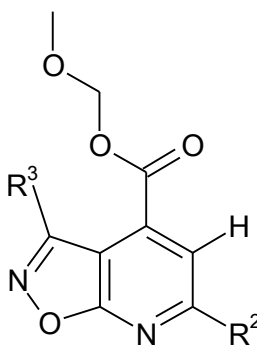
- 5 Сполуки від 1.b.1 до 1.b.152, які відрізняються від ізоксазоло[5,4-*b*]піридинових сполук від I.a.1 до I.a.152 згідно з таблицею 1 тільки відносно змінної R⁴, яка представляє собою CH₃.



I.b

- 10 Таблиця 3: Ізоксазоло[5,4-*b*]піридинові сполуки від I.c.1 до I.c.152

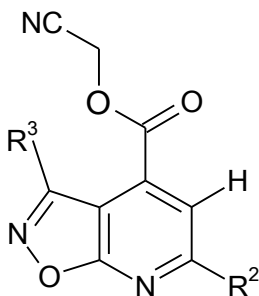
Сполуки від 1.c.1 до 1.c.152, які відрізняються від ізоксазоло[5,4-*b*]піридинових сполук від I.a.1 до I.a.152 згідно з таблицею 1 тільки відносно змінної R⁴, яка представляє собою CH₂OCH₃.



I.c

Таблиця 4: Ізоксазоло[5,4-*b*]піридинові сполуки від I.d.1 до I.d.152

Сполуки від I.d.1 до I.d.152, які відрізняються від ізоксазоло[5,4-*b*]піридинових сполук від I.a.1 до I.a.152 згідно з таблицею 1 тільки відносно змінної R^4 , яка представляє собою CH_2CN .



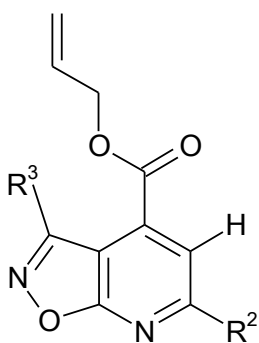
I.d

5

Таблиця 5: Ізоксазоло[5,4-*b*]піридинові сполуки від I.e.1 до I.e.152

Сполуки від I.e.1 до I.e.152, які відрізняються від ізоксазоло[5,4-*b*]піридинових сполук від I.a.1 до I.a.152 згідно з таблицею 1 тільки відносно змінної R^4 , яка представляє собою $\text{CH}_2\text{CH}=\text{CH}_2$.

10

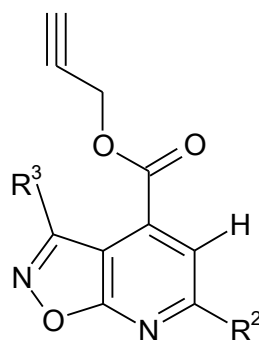


I.e

Таблиця 6: Ізоксазоло[5,4-*b*]піридинові сполуки від I.f.1 до I.f.152

Сполуки від I.f.1 до I.f.152, які відрізняються від ізоксазоло[5,4-*b*]піридинових сполук від I.a.1 до I.a.152 згідно з таблицею 1 тільки відносно змінної R^4 , яка представляє собою $\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$.

15



I.f

20 Відповідно до переважного варіанту здійснення винаходу перевага також надається тим ізоксазоло[5,4-*b*]піридиновим сполукам формули I, в яких R^1 означає водень, галоген, $\text{C}_1\text{-C}_6$ -алкіл, $\text{C}_1\text{-C}_6$ -галоалкіл; Зокрема переважними є ті ізоксазоло[5,4-*b*]піридинові сполуки формули I, в якій R^1 означає водень.

25 Відповідно до іншого переважного варіанту здійснення винаходу, перевага також надається тим ізоксазоло[5,4-*b*]піридиновим сполукам формули I, в якій R^2 означає водень, $\text{C}_1\text{-C}_6$ -алкіл, $\text{C}_1\text{-C}_6$ -галоалкіл, $\text{C}_1\text{-C}_6$ -гідроксіалкіл, $\text{C}_3\text{-C}_6$ -циклоалкіл, $\text{C}_3\text{-C}_6$ -галоциклоалкіл, $\text{C}_2\text{-C}_6$ -алкеніл, $\text{C}_2\text{-C}_6$ -алкініл; і зокрема тим ізоксазоло[5,4-*b*]піридиновим сполукам формули I, в якій

R^2 означає C_1 - C_6 -алкіл, C_1 - C_6 -галоалкіл, C_1 - C_6 -гідроксіалкіл, C_3 - C_6 -циклоалкіл, C_3 - C_6 -галоциклоалкіл, C_2 - C_6 -алкеніл, C_2 - C_6 -алкініл.

Зокрема більш переважними є ті ізоксазоло[5,4-b]піридинові сполуки формули I, в якій R^2 означає C_3 - C_6 -циклоалкіл або C_3 - C_6 -галоциклоалкіл. Найбільш переважними є ті ізоксазоло[5,4-b]піридинові сполуки формули I, в якій R^2 означає циклопропіл або 1-фторциклопропіл.

Відповідно до іншого переважного варіанту здійснення винаходу, перевага також надається тим ізоксазоло[5,4-b]піридиновим сполукам формули I, в якій

R^3 означає C_1 - C_6 -алкіл, C_1 - C_6 -галоалкіл, C_3 - C_6 -циклоалкіл- C_1 - C_6 -алкіл, C_3 - C_6 -галоциклоалкіл- C_1 - C_6 -алкіл, C_3 - C_6 -циклоалкіл, C_3 - C_6 -галоциклоалкіл, C_1 - C_4 -алкіл- C_3 - C_6 -циклоалкіл, C_1 - C_6 -алкокси, C_1 - C_6 -галоалкокси, феніл; причому фенільні частини R^3 можуть бути незаміщеними або заміщеними одним або декількома радикалами, вибраними з галогену, гідрокси, нітро, ціано, C_1 - C_4 -алкіл, C_1 - C_4 -галоалкіл, C_1 - C_4 -алкокси- C_1 - C_4 -алкіл, C_3 - C_6 -циклоалкіл, C_2 - C_6 -алкеніл, C_2 - C_6 -алкініл, C_1 - C_4 -алкокси, C_1 - C_4 -галоалкокси, C_1 - C_4 -алкоксикарбоніл, C_1 - C_4 -алкілтіо, C_1 - C_4 -алкілсульфініл, C_1 - C_4 -алкілсульфоніл, аміно, C_1 - C_4 -алкіламіно, N,N-ді-(C_1 - C_4)-алкіламіно, гетероцикліл, феніл;

Зокрема переважними є ті ізоксазоло[5,4-b]піридинові сполуки формули I, в якій R^3 означає C_1 - C_6 -алкіл, C_1 - C_6 -галоалкіл, C_3 - C_6 -циклоалкіл- C_1 - C_6 -алкіл, C_3 - C_6 -галоциклоалкіл- C_1 - C_6 -алкіл, C_3 - C_6 -циклоалкіл, C_3 - C_6 -галоциклоалкіл, C_1 - C_4 -алкіл- C_3 - C_6 -циклоалкіл, C_1 - C_6 -алкокси, C_1 - C_6 -галоалкокси;

Відповідно до іншого переважного варіанту здійснення винаходу, перевага також надається тим ізоксазоло[5,4-b]піридиновим сполукам формули I, в якій

X означає OR^4 .

Відповідно до іншого переважного варіанту здійснення винаходу, перевага також надається тим ізоксазоло[5,4-b]піридиновим сполукам формули I, в якій,

R^4 означає водень, C_1 - C_6 -алкіл, C_1 - C_6 -галоалкіл, C_1 - C_6 -ціаноалкіл, C_1 - C_6 -алкокси- C_1 - C_6 -алкіл, C_1 - C_6 -галоалкокси- C_1 - C_6 -алкіл, C_2 - C_6 -алкеніл, C_2 - C_6 -галоалкеніл, C_2 - C_6 -алкініл.

Зокрема переважними є ті ізоксазоло[5,4-b]піридинові сполуки формули I, в якій R^4 означає водень, метил, етил, n-пропіл, i-пропіл, n-бутил, 1-метилпропіл, 2-метилпропіл, трет.-бутил; найбільш переважними є ті ізоксазоло[5,4-b]піридинові сполуки формули I, в якій R^4 означає водень;

Відповідно до іншого переважного варіанту здійснення винаходу, перевага також надається тим ізоксазоло[5,4-b]піридиновим сполукам формули I, в якій

X означає SR^5 .

Відповідно до іншого переважного варіанту здійснення винаходу, перевага також надається тим ізоксазоло[5,4-b]піридиновим сполукам формули I, в якій,

R^5 означає водень, C_1 - C_6 -алкіл, C_1 - C_6 -галоалкіл, C_1 - C_6 -ціаноалкіл, C_1 - C_6 -алкокси- C_1 - C_6 -алкіл, C_1 - C_6 -галоалкокси- C_1 - C_6 -алкіл, C_2 - C_6 -алкеніл, C_2 - C_6 -галоалкеніл, C_2 - C_6 -алкініл.

Зокрема переважними є ті ізоксазоло[5,4-b]піридинові сполуки формули I, в якій R^5 означає водень, C_1 - C_6 -алкіл, C_1 - C_6 -галоалкіл, феніл- C_1 - C_6 -алкіл; Найбільш переважними є ті ізоксазоло[5,4-b]піридинові сполуки формули I, в якій R^5 означає C_1 - C_6 -алкіл, феніл- C_1 - C_6 -алкіл;

Зокрема застосовними як гербіциди є ті ізоксазоло[5,4-b]піридинові сполуки формули I, в якій

R^1 означає водень;

R^2 означає водень, C_1 - C_6 -алкіл, C_1 - C_6 -галоалкіл, C_1 - C_6 -гідроксіалкіл, C_3 - C_6 -циклоалкіл, C_3 - C_6 -галоциклоалкіл, C_2 - C_6 -алкеніл, C_2 - C_6 -алкініл;

R^3 означає водень, галоген, гідрокси, C_1 - C_6 -алкіл, C_1 - C_6 -галоалкіл, C_1 - C_6 -гідроксіалкіл, C_1 - C_6 -алкокси- C_1 - C_6 -алкіл, C_1 - C_6 -галоалкокси- C_1 - C_6 -алкіл, C_3 - C_6 -циклоалкіл- C_1 - C_6 -алкіл, C_3 - C_6 -галоциклоалкіл- C_1 - C_6 -алкіл, C_3 - C_6 -циклоалкіл, C_3 - C_6 -галоциклоалкіл, C_1 - C_4 -алкіл- C_3 - C_6 -циклоалкіл, C_3 - C_6 -циклоалкеніл, C_3 - C_6 -галоциклоалкеніл, феніл- C_1 - C_6 -алкіл, гетероцикліл- C_1 - C_6 -алкіл, C_2 - C_6 -алкеніл, C_2 - C_6 -галоалкеніл, C_2 - C_6 -алкініл, C_2 - C_6 -галоалкініл, C_1 - C_6 -алкокси, C_1 - C_6 -галоалкокси, C_1 - C_6 -алкілтіо, C_1 - C_6 -галоалкілтіо, аміно, C_1 - C_6 -алкіламіно, N,N-ді-(C_1 - C_6)-алкіламіно, гетероцикліл, феніл; причому гетероциклільні й фенільні частини R^3 можуть бути незаміщеними або заміщеними одним або декількома радикалами, вибраними з галогену, гідрокси, нітро, ціано, C_1 - C_4 -алкілу, C_1 - C_4 -галоалкілу, C_1 - C_4 -алкокси- C_1 - C_4 -алкілу, C_3 - C_6 -циклоалкілу, C_2 - C_6 -алкенілу, C_2 - C_6 -алкінілу, C_1 - C_4 -алкокси, C_1 - C_4 -галоалкокси, C_1 - C_4 -алкоксикарбонілу, C_1 - C_4 -алкілтіо, C_1 - C_4 -алкілсульфінілу, C_1 - C_4 -алкілсульфонілу, аміно, C_1 - C_4 -алкіламіно, N,N-ді-(C_1 - C_4)-алкіламіно, гетероциклілу, фенілу;

X означає OR^4 ;

R^4 означає водень, C_1 - C_6 -алкіл, C_1 - C_6 -галоалкіл, C_1 - C_6 -гідроксіалкіл, C_1 - C_6 -ціаноалкіл, C_1 - C_6 -алкокси- C_1 - C_6 -алкіл, C_1 - C_6 -алкокси- C_1 - C_6 -алкокси- C_1 - C_6 -алкіл, C_1 - C_6 -галоалкокси- C_1 - C_6 -алкіл, C_2 -

C_6 -алкенилокси- C_1 - C_6 -алкіл, C_2 - C_6 -галоалкенилокси- C_1 - C_6 -алкіл, C_1 - C_6 -алкоксикарбоніл- C_1 - C_6 -алкіл, амінокарбоніл- C_1 - C_6 -алкіл, C_1 - C_6 -алкіл-амінокарбоніл- C_1 - C_6 -алкіл, N,N-ді-(C_1 - C_6 -алкіл)-амінокарбоніл- C_1 - C_6 -алкіл, [N-(C_3 - C_6 -циклоалкіл- C_1 - C_6 -алкіл), N-(C_1 - C_6 -алкіл)]-амінокарбоніл- C_1 - C_6 -алкіл, C_1 - C_6 -алкокси-амінокарбоніл- C_1 - C_6 -алкіл, C_2 - C_6 -алкеніл, C_2 - C_6 -галоалкеніл, C_2 - C_6 -алкініл- C_2 - C_6 -алкеніл, C_2 - C_6 -алкініл, C_2 - C_6 -галоалкініл, гетероцикліл, феніл, гетероциклілкарбоніл, фенілкарбоніл, гетероциклілкарбоніл- C_1 - C_6 -алкіл, фенілкарбоніл- C_1 - C_6 -алкіл, гетероцикліл- C_1 - C_6 -алкіл, феніл- C_1 - C_6 -алкіл; причому фенільні й гетероциклільні частини R^4 і R^5 можуть бути незаміщеними або заміщеними одним або декількома радикалами, вибраними з галогену, C_1 - C_4 -алкілу, C_1 - C_4 -галоалкілу, C_1 - C_4 -алкокси, C_1 - C_4 -галоалкоксиа, C_1 - C_4 -алкоксикарбонілу, гетероциклілу, фенілу;

і їх застосовні в сільському господарстві солі;

Зокрема придатними як гербіциди є ті ізоксазола[5,4-b]піридинові сполуки формули I, в якій R^1 означає водень;

R^2 означає водень, C_1 - C_6 -алкіл, C_1 - C_6 -галоалкіл, C_1 - C_6 -гідроксіалкіл, C_3 - C_6 -циклоалкіл, C_3 - C_6 -галоциклоалкіл, C_2 - C_6 -алкеніл, C_2 - C_6 -алкініл;

R^3 означає C_1 - C_6 -алкіл, C_1 - C_6 -галоалкіл, C_3 - C_6 -циклоалкіл- C_1 - C_6 -алкіл, C_3 - C_6 -галоциклоалкіл- C_1 - C_6 -алкіл, C_3 - C_6 -циклоалкіл, C_3 - C_6 -галоциклоалкіл, C_1 - C_4 -алкіл- C_3 - C_6 -циклоалкіл, C_1 - C_6 -алкокси, C_1 - C_6 -галоалкокси, феніл; причому фенільні частини R^3 можуть бути незаміщеними або заміщеними одним або декількома радикалами, вибраними з галогену, гідрокси, нітро, ціано, C_1 - C_4 -алкілу, C_1 - C_4 -галоалкілу, C_1 - C_4 -алкокси- C_1 - C_4 -алкілу, C_3 - C_6 -циклоалкілу, C_2 - C_6 -алкенілу, C_2 - C_6 -алкінілу, C_1 - C_4 -алкокси, C_1 - C_4 -галоалкокси, C_1 - C_4 -алкоксикарбонілу, C_1 - C_4 -алкілтію, C_1 - C_4 -алкілсульфінілу, C_1 - C_4 -алкілсульфонілу, аміно, C_1 - C_4 -алкіламіно, N,N-ді-(C_1 - C_4)-алкіламіно, гетероциклілу, фенілу;

X означає OR^4 ;

R^4 означає водень, C_1 - C_6 -алкіл, C_1 - C_6 -галоалкіл, C_1 - C_6 -гідроксіалкіл, C_1 - C_6 -ціаноалкіл, C_1 - C_6 -алкокси- C_1 - C_6 -алкіл, C_1 - C_6 -алкокси- C_1 - C_6 -алкокси- C_1 - C_6 -алкіл, C_1 - C_6 -галоалкокси- C_1 - C_6 -алкіл, C_2 - C_6 -алкенилокси- C_1 - C_6 -алкіл, C_2 - C_6 -галоалкенилокси- C_1 - C_6 -алкіл, C_1 - C_6 -алкоксикарбоніл- C_1 - C_6 -алкіл, амінокарбоніл- C_1 - C_6 -алкіл, C_1 - C_6 -алкіл-амінокарбоніл- C_1 - C_6 -алкіл, N,N-ді-(C_1 - C_6 -алкіл)-амінокарбоніл- C_1 - C_6 -алкіл, [N-(C_3 - C_6 -циклоалкіл- C_1 - C_6 -алкіл), N-(C_1 - C_6 -алкіл)]-амінокарбоніл- C_1 - C_6 -алкіл, C_1 - C_6 -алкокси-амінокарбоніл- C_1 - C_6 -алкіл, C_2 - C_6 -алкеніл, C_2 - C_6 -галоалкеніл, C_2 - C_6 -алкініл- C_2 - C_6 -алкеніл, C_2 - C_6 -алкініл, C_2 - C_6 -галоалкініл, гетероцикліл, феніл, гетероциклілкарбоніл, фенілкарбоніл, гетероциклілкарбоніл- C_1 - C_6 -алкіл, фенілкарбоніл- C_1 - C_6 -алкіл, гетероцикліл- C_1 - C_6 -алкіл, феніл- C_1 - C_6 -алкіл; причому фенільні й гетероциклільні частини R^4 і R^5 можуть бути незаміщеними або заміщеними одним або декількома радикалами, вибраними з галогену, C_1 - C_4 -алкіл, C_1 - C_4 -галоалкіл, C_1 - C_4 -алкокси, C_1 - C_4 -галоалкокси, C_1 - C_4 -алкоксикарбонілу, гетероциклілу, фенілу;

і їх застосовні в сільському господарстві солі;

Зокрема придатними як гербіциди є ті ізоксазола[5,4-b]піридинові сполуки формули I, в якій R^1 означає водень;

R^2 означає водень, C_1 - C_6 -алкіл, C_1 - C_6 -галоалкіл, C_1 - C_6 -гідроксіалкіл, C_3 - C_6 -циклоалкіл, C_3 - C_6 -галоциклоалкіл, C_2 - C_6 -алкеніл, C_2 - C_6 -алкініл;

R^3 означає C_1 - C_6 -алкіл, C_1 - C_6 -галоалкіл, C_3 - C_6 -циклоалкіл- C_1 - C_6 -алкіл, C_3 - C_6 -галоциклоалкіл- C_1 - C_6 -алкіл, C_3 - C_6 -циклоалкіл, C_3 - C_6 -галоциклоалкіл, C_1 - C_4 -алкіл- C_3 - C_6 -циклоалкіл, C_1 - C_6 -алкокси, C_1 - C_6 -галоалкокси, феніл; причому фенільні частини R^3 можуть бути незаміщеними або заміщеними одним або декількома радикалами, вибраними з галогену, гідрокси, нітро, ціано, C_1 - C_4 -алкілу, C_1 - C_4 -галоалкілу, C_1 - C_4 -алкокси- C_1 - C_4 -алкіл, C_3 - C_6 -циклоалкілу, C_2 - C_6 -алкеніл, C_2 - C_6 -алкініл, C_1 - C_4 -алкокси, C_1 - C_4 -галоалкокси, C_1 - C_4 -алкоксикарбонілу, C_1 - C_4 -алкілтію, C_1 - C_4 -алкілсульфініл, C_1 - C_4 -алкілсульфонілу, аміно, C_1 - C_4 -алкіламіно, N,N-ді-(C_1 - C_4)-алкіламіно, гетероциклілу, фенілу;

X означає OR^4 ;

R^4 означає водень, C_1 - C_6 -алкіл, C_1 - C_6 -галоалкіл, C_1 - C_6 -ціаноалкіл, C_1 - C_6 -алкокси- C_1 - C_6 -алкі

алкокси, С₁-С₆-галоалкокси, феніл; причому фенільні частини R³ можуть бути незаміщеними або заміщеними одним або декількома радикалами, вибраними з галогену, гідрокси, нітро, ціано, С₁-С₄-алкілу, С₁-С₄-галоалкілу, С₁-С₄-алкокси-С₁-С₄-алкілу, С₃-С₆-циклоалкілу, С₂-С₆-алкенілу, С₂-С₆-алкінілу, С₁-С₄-алкокси, С₁-С₄-галоалкокси, С₁-С₄-алкоксикарбонілу, С₁-С₄-алкілтію, С₁-С₄-алкілсульфінілу, С₁-С₄-алкілсульфонілу, аміно, С₁-С₄-алкіламіно, N,N-ді-(С₁-С₄)-алкіламіно, гетероциклілу, фенілу;

X означає SR⁵;

R⁵ означає водень, С₁-С₆-алкіл, С₁-С₆-галоалкіл, феніл-С₁-С₆-алкіл; is найбільш переважно С₁-С₆-алкіл, феніл-С₁-С₆-алкіл;

і їх застосовні в сільському господарстві солі;

Зокрема придатними як гербіциди є ті ізоксазоло[5,4-b]піридинові сполуки формули I, в якій R¹ означає водень;

R² означає С₃-С₆-циклоалкіл, С₃-С₆-галоциклоалкіл; найбільш переважно циклопропіл або 1-фторциклопропіл;

R³ означає водень, галоген, гідрокси, С₁-С₆-алкіл, С₁-С₆-галоалкіл, С₁-С₆-гідроксіалкіл, С₁-С₆-алкокси-С₁-С₆-алкіл, С₁-С₆-галоалкокси-С₁-С₆-алкіл, С₃-С₆-циклоалкіл-С₁-С₆-алкіл, С₃-С₆-галоциклоалкіл-С₁-С₆-алкіл, С₃-С₆-циклоалкіл, С₃-С₆-галоциклоалкіл, С₁-С₄-алкіл-С₃-С₆-циклоалкіл, С₃-С₆-циклоалкеніл, С₃-С₆-галоциклоалкеніл, феніл-С₁-С₆-алкіл, гетероцикліл-С₁-С₆-алкіл, С₂-С₆-алкеніл, С₂-С₆-галоалкеніл, С₂-С₆-алкініл, С₂-С₆-галоалкініл, С₁-С₆-алкокси, С₁-С₆-галоалкокси, С₁-С₆-алкілтію, С₁-С₆-галоалкілтію, аміно, С₁-С₆-алкіламіно, N,N-ді-(С₁-С₆)-алкіламіно, гетероцикліл, феніл; причому гетероциклільні й фенільні частини R³ можуть бути незаміщеними або заміщеними одним або декількома радикалами, вибраними з галогену, гідрокси, нітро, ціано, С₁-С₄-алкілу, С₁-С₄-галоалкілу, С₁-С₄-алкокси-С₁-С₄-алкілу, С₃-С₆-циклоалкілу, С₂-С₆-алкенілу, С₂-С₆-алкінілу, С₁-С₄-алкокси, С₁-С₄-галоалкокси, С₁-С₄-алкоксикарбонілу, С₁-С₄-алкілтію, С₁-С₄-алкілсульфінілу, С₁-С₄-алкілсульфонілу, аміно, С₁-С₄-алкіламіно, N,N-ді-(С₁-С₄)-алкіламіно, гетероциклілу, фенілу;

X означає OR⁴;

R⁴ означає водень, С₁-С₆-алкіл, С₁-С₆-галоалкіл, С₁-С₆-гідроксіалкіл, С₁-С₆-ціаноалкіл, С₁-С₆-алкокси-С₁-С₆-алкіл, С₁-С₆-алкокси-С₁-С₆-алкокси-С₁-С₆-алкіл, С₁-С₆-галоалкокси-С₁-С₆-алкіл, С₂-С₆-алкенілокси-С₁-С₆-алкіл, С₂-С₆-галоалкенілокси-С₁-С₆-алкіл, С₁-С₆-алкоксикарбоніл-С₁-С₆-алкіл, амінокарбоніл-С₁-С₆-алкіл, С₁-С₆-алкіл-амінокарбоніл-С₁-С₆-алкіл, N,N-ді-(С₁-С₆-алкіл)-амінокарбоніл-С₁-С₆-алкіл, [N-(С₃-С₆-циклоалкіл-С₁-С₆-алкіл), N-(С₁-С₆-алкіл)]-амінокарбоніл-С₁-С₆-алкіл, С₁-С₆-алкокси-амінокарбоніл-С₁-С₆-алкіл, С₂-С₆-алкеніл, С₂-С₆-галоалкеніл, С₂-С₆-алкініл-С₂-С₆-алкеніл, С₂-С₆-алкініл, С₂-С₆-галоалкініл, гетероцикліл, феніл, гетероциклілкарбоніл, фенілкарбоніл, гетероциклілкарбоніл-С₁-С₆-алкіл, фенілкарбоніл-С₁-С₆-алкіл, гетероцикліл-С₁-С₆-алкіл, феніл-С₁-С₆-алкіл; причому фенільні і гетероциклільні частини R⁴ і R⁵ можуть бути незаміщеними або заміщеними одним або декількома радикалами, вибраними з галогену, С₁-С₄-алкілу, С₁-С₄-галоалкілу, С₁-С₄-алкокси, С₁-С₄-галоалкокси, С₁-С₄-алкоксикарбонілу, гетероциклілу, фенілу; найбільш переважно водень;

і їх застосовні в сільському господарстві солі;

Зокрема є придатними як гербіциди ті ізоксазоло[5,4-b]піридинові сполуки формули I, в якій

R¹ означає водень;

R² означає С₃-С₆-циклоалкіл, С₃-С₆-галоциклоалкіл; найбільш переважно циклопропіл або 1-фторциклопропіл;

R³ означає С₁-С₆-алкіл, С₁-С₆-галоалкіл, С₃-С₆-циклоалкіл-С₁-С₆-алкіл, С₃-С₆-галоциклоалкіл-С₁-С₆-алкіл, С₃-С₆-циклоалкіл, С₃-С₆-галоциклоалкіл, С₁-С₄-алкіл-С₃-С₆-циклоалкіл, С₁-С₆-алкокси, С₁-С₆-галоалкокси, феніл; причому фенільні частини R³ можуть бути незаміщеними або заміщеними одним або декількома радикалами, вибраними з галогену, гідрокси, нітро, ціано, С₁-С₄-алкілу, С₁-С₄-галоалкілу, С₁-С₄-алкокси-С₁-С₄-алкілу, С₃-С₆-циклоалкілу, С₂-С₆-алкенілу, С₂-С₆-алкінілу, С₁-С₄-алкокси, С₁-С₄-галоалкокси, С₁-С₄-алкоксикарбонілу, С₁-С₄-алкілтію, С₁-С₄-алкілсульфінілу, С₁-С₄-алкілсульфонілу, аміно, С₁-С₄-алкіламіно, N,N-ді-(С₁-С₄)-алкіламіно, гетероциклілу, фенілу;

X означає OR⁴;

R⁴ означає водень, С₁-С₆-алкіл, С₁-С₆-галоалкіл, С₁-С₆-ціаноалкіл, С₁-С₆-алкокси-С₁-С₆-алкіл, С₁-С₆-галоалкокси-С₁-С₆-алкіл, С₂-С₆-алкеніл, С₂-С₆-галоалкеніл, С₂-С₆-алкініл; найбільш переважно водень;

і їх застосовні в сільському господарстві солі;

Найбільш придатними як гербіциди є ті ізоксазоло[5,4-b]піридинові сполуки формули I, в якій

R¹ означає водень;

R² означає циклопропіл;

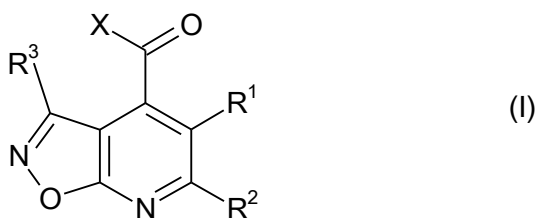
R^3 означає водень, галоген, гідрокси, C_1 - C_6 -алкіл, C_1 - C_6 -галоалкіл, C_1 - C_6 -гідроксіалкіл, C_1 - C_6 -алкокси- C_1 - C_6 -алкіл, C_1 - C_6 -галоалкокси- C_1 - C_6 -алкіл, C_3 - C_6 -циклоалкіл- C_1 - C_6 -алкіл, C_3 - C_6 -галоциклоалкіл- C_1 - C_6 -алкіл, C_3 - C_6 -циклоалкіл, C_3 - C_6 -галоциклоалкіл, C_1 - C_4 -алкіл- C_3 - C_6 -циклоалкіл, C_3 - C_6 -циклоалкеніл, C_3 - C_6 -галоциклоалкеніл, феніл- C_1 - C_6 -алкіл, гетероцикліл- C_1 - C_6 -алкіл, C_2 - C_6 -алкеніл, C_2 - C_6 -галоалкеніл, C_2 - C_6 -алкініл, C_2 - C_6 -галоалкініл, C_1 - C_6 -алкокси, C_1 - C_6 -галоалкокси, C_1 - C_6 -алкілтіо, C_1 - C_6 -галоалкілтіо, аміно, C_1 - C_6 -алкіламіно, N,N -ді- (C_1-C_6) -алкіламіно, гетероцикліл, феніл; причому гетероциклільні й фенільні частини R^3 можуть бути незаміщеними або заміщеними одним або декількома радикалами, вибраними з галогену, гідрокси, нітро, ціано, C_1 - C_4 -алкілу, C_1 - C_4 -галоалкілу, C_1 - C_4 -алкокси- C_1 - C_4 -алкілу, C_3 - C_6 -циклоалкілу, C_2 - C_6 -алкеніл, C_2 - C_6 -алкінілу, C_1 - C_4 -алкокси, C_1 - C_4 -галоалкокси, C_1 - C_4 -алкоксикарбонілу, C_1 - C_4 -алкілтіо, C_1 - C_4 -алкілсульфінілу, C_1 - C_4 -алкілсульфонілу, аміно, C_1 - C_4 -алкіламіно, N,N -ді- (C_1-C_4) -алкіламіно, гетероциклілу, фенілу;

X означає OR^4 ;

R^4 означає водень;

і їх застосовні в сільському господарстві солі;

Незважаючи на те, що ізоксазоло[5,4- b]піридинові сполуки є відомими з рівня техніки, окремі ізоксазоло[5,4- b]піридинові сполуки формули I є новими. Відповідно, об'єктом даного винаходу також є ізоксазоло[5,4- b]піридинові сполуки формули I



в якій

R^1 означає водень, галоген, C_1 - C_6 -алкіл, C_1 - C_6 -галоалкіл;

R^2 означає водень, C_1 - C_6 -алкіл, C_1 - C_6 -галоалкіл, C_1 - C_6 -гідроксіалкіл, C_3 - C_6 -циклоалкіл, C_3 - C_6 -галоциклоалкіл, C_2 - C_6 -алкеніл, C_2 - C_6 -алкініл;

R^3 водень, галоген, гідрокси, C_1 - C_6 -алкіл, C_1 - C_6 -галоалкіл, C_1 - C_6 -гідроксіалкіл, C_1 - C_6 -алкокси- C_1 - C_6 -алкіл, C_1 - C_6 -галоалкокси- C_1 - C_6 -алкіл, C_3 - C_6 -циклоалкіл- C_1 - C_6 -алкіл, C_3 - C_6 -галоциклоалкіл- C_1 - C_6 -алкіл, C_3 - C_6 -циклоалкіл, C_3 - C_6 -галоциклоалкіл, C_1 - C_4 -алкіл- C_3 - C_6 -циклоалкіл, C_3 - C_6 -циклоалкеніл, C_3 - C_6 -галоциклоалкеніл, феніл- C_1 - C_6 -алкіл, гетероцикліл- C_1 - C_6 -алкіл, C_2 - C_6 -алкеніл, C_2 - C_6 -галоалкеніл, C_2 - C_6 -алкініл, C_2 - C_6 -галоалкініл, C_1 - C_6 -алкокси, C_1 - C_6 -галоалкокси, C_1 - C_6 -алкілтіо, C_1 - C_6 -галоалкілтіо, аміно, C_1 - C_6 -алкіламіно, N,N -ді- (C_1-C_6) -алкіламіно, гетероцикліл, феніл; причому гетероциклільні й фенільні частини R^3 можуть бути незаміщеними або заміщеними одним або декількома радикалами, вибраними з галогену, гідрокси, нітро, ціано, C_1 - C_4 -алкілу, C_1 - C_4 -галоалкілу, C_1 - C_4 -алкокси- C_1 - C_4 -алкілу, C_3 - C_6 -циклоалкілу, C_2 - C_6 -алкенілу, C_2 - C_6 -алкінілу, C_1 - C_4 -алкокси, C_1 - C_4 -галоалкокси, C_1 - C_4 -алкоксикарбонілу, C_1 - C_4 -алкілтіо, C_1 - C_4 -алкілсульфінілу, C_1 - C_4 -алкілсульфонілу, аміно, C_1 - C_4 -алкіламіно, N,N -ді- (C_1-C_4) -алкіламіно, гетероциклілу, фенілу;

X означає OR^4 ;

R^4 означає водень, C_1 - C_6 -алкіл, C_1 - C_6 -галоалкіл, C_1 - C_6 -ціаноалкіл, C_1 - C_6 -алкокси- C_1 - C_6 -алкіл, C_1 - C_6 -галоалкокси- C_1 - C_6 -алкіл, C_2 - C_6 -алкеніл, C_2 - C_6 -галоалкеніл, C_2 - C_6 -алкініл;

і їх застосовні в сільському господарстві солі за винятком ізоксазоло[5,4- b]піридинових сполук формули I, в якій

R^1 означає водень, R^2 означає циклопропіл, R^3 означає CH_3 , X означає OR^4 і R^4 означає водень, C_1 - C_6 -алкіл, ціанометил, або 2-Cl-2-пропен-1-іл; і

R^1 означає водень, R^2 означає циклопропіл, R^3 означає $CH_2C(CH_3)_3$, $(CH_2)_2CH_3$, $CH(CH_3)_2$, $C(CH_3)_3$, циклопропіл, феніл, 2-F-феніл, 4-F-феніл, 4-метилфеніл, 4-метоксифеніл, 2-фуран-іл, 1,3,5-триметил-1H-піразол-4-іл, 1-етил-5-метил-1H-піразол-4-іл, X означає OR^4 і R^4 означає водень, метил або етил; і

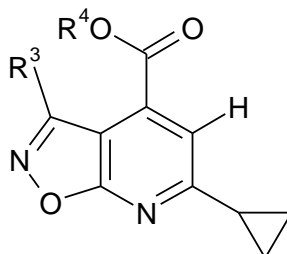
R^1 означає водень, R^2 означає метил, R^3 означає CH_3 , $CH_2C(CH_3)_3$, $(CH_2)_2CH_3$, $CH(CH_3)_2$, $C(CH_3)_3$, циклопропіл, феніл, 4-метилфеніл, 4-метоксифеніл, 3-метоксифеніл, 4-фторфеніл, 3,4-дихлорфеніл, 2-фуран-іл, 1,3,5-триметил-1H-піразол-4-іл, 1-етил-5-метил-1H-піразол-4-іл, X означає OR^4 і R^4 означає водень, метил або етил; і

R^1 означає водень, R^2 означає етил, R^3 означає CH_3 , $(\text{CH}_2)_2\text{CH}_3$, $\text{CH}(\text{CH}_3)_2$, $\text{CH}_2\text{C}(\text{CH}_3)_3$, циклопропіл, 1,3,5-триметил-1H-піразол-4-іл, X означає OR^4 і R^4 означає водень, метил або етил; і

R^1 означає водень, R^2 означає і-пропіл, R^3 означає CH_3 , $\text{CH}_2\text{C}(\text{CH}_3)_3$, $(\text{CH}_2)_2\text{CH}_3$, $\text{CH}(\text{CH}_3)_2$, $\text{C}(\text{CH}_3)_3$, циклопропіл, феніл, 3-метоксифеніл, 2-фуран-іл; X означає OR^4 і R^4 означає водень, метил або етил; і

R^1 означає хлор, R^2 означає метил, циклопропіл, R^3 означає метил, X означає OR^4 і R^4 означає водень або метил.

Об'єктом даного винаходу також є ізоксазоло[5,4-b]піридинові сполуки формули I,



в якій

R^1 означає водень;

R^2 означає циклопропіл;

R^3 означає водень, галоген, гідрокси, C_1 - C_6 -алкіл, C_1 - C_6 -галоалкіл, C_1 - C_6 -гідроксіалкіл, C_1 - C_6 -алкокси- C_1 - C_6 -алкіл, C_1 - C_6 -галоалкокси- C_1 - C_6 -алкіл, C_3 - C_6 -циклоалкіл- C_1 - C_6 -алкіл, C_3 - C_6 -галоциклоалкіл- C_1 - C_6 -алкіл, C_3 - C_6 -циклоалкіл, C_3 - C_6 -галоциклоалкіл, C_1 - C_4 -алкіл- C_3 - C_6 -циклоалкіл, C_3 - C_6 -циклоалкеніл, C_3 - C_6 -галоциклоалкеніл, феніл- C_1 - C_6 -алкіл, гетероцикліл- C_1 - C_6 -алкіл, C_2 - C_6 -алкеніл, C_2 - C_6 -галоалкеніл, C_2 - C_6 -алкініл, C_2 - C_6 -галоалкініл, C_1 - C_6 -алкокси, C_1 - C_6 -галоалкокси, C_1 - C_6 -алкілтіо, C_1 - C_6 -галоалкілтіо, аміно, C_1 - C_6 -алкіламіно, N,N-ді-(C_1 - C_6)-алкіламіно, гетероцикліл, феніл; причому гетероциклільні й фенільні частини R^3 можуть бути незаміщеними або заміщеними одним або декількома радикалами, вибраними з галогену, гідрокси, нітро, ціано, C_1 - C_4 -алкілу, C_1 - C_4 -галоалкілу, C_1 - C_4 -алкокси- C_1 - C_4 -алкілу, C_3 - C_6 -циклоалкілу, C_2 - C_6 -алкенілу, C_2 - C_6 -алкініл, C_1 - C_4 -алкокси, C_1 - C_4 -галоалкокси, C_1 - C_4 -алкоксикарбонілу, C_1 - C_4 -алкілтіо, C_1 - C_4 -алкілсульфінілу, C_1 - C_4 -алкілсульфонілу, аміно, C_1 - C_4 -алкіламіно, N,N-ді-(C_1 - C_4)-алкіламіно, гетероциклілу, фенілу;

X означає OR^4 ;

R^4 означає водень, C_1 - C_6 -алкіл, C_1 - C_6 -галоалкіл, C_1 - C_6 -гідроксіалкіл, C_1 - C_6 -ціаноалкіл, C_1 - C_6 -алкокси- C_1 - C_6 -алкіл, C_1 - C_6 -алкокси- C_1 - C_6 -алкокси- C_1 - C_6 -алкіл, C_1 - C_6 -галоалкокси- C_1 - C_6 -алкіл, C_2 - C_6 -алкенілокси- C_1 - C_6 -алкіл, C_2 - C_6 -галоалкенілокси- C_1 - C_6 -алкіл, C_1 - C_6 -алкоксикарбоніл- C_1 - C_6 -алкіл, амінокарбоніл- C_1 - C_6 -алкіл, C_1 - C_6 -алкіл-амінокарбоніл- C_1 - C_6 -алкіл, N,N-ді-(C_1 - C_6 -алкіл)-амінокарбоніл- C_1 - C_6 -алкіл, [N-(C_3 - C_6 -циклоалкіл- C_1 - C_6 -алкіл), N-(C_1 - C_6 -алкіл)]-амінокарбоніл- C_1 - C_6 -алкіл, C_1 - C_6 -алкокси-амінокарбоніл- C_1 - C_6 -алкіл, C_2 - C_6 -алкеніл, C_2 - C_6 -галоалкеніл, C_2 - C_6 -алкініл- C_2 - C_6 -алкеніл, C_2 - C_6 -алкініл, C_2 - C_6 -галоалкініл, гетероцикліл, феніл, гетероциклілкарбоніл, фенілкарбоніл, гетероциклілкарбоніл- C_1 - C_6 -алкіл, фенілкарбоніл- C_1 - C_6 -алкіл, гетероцикліл- C_1 - C_6 -алкіл, феніл- C_1 - C_6 -алкіл; причому фенільні і гетероциклільні частини R^4 можуть бути незаміщеними або заміщеними одним або декількома радикалами, вибраними з галогену, C_1 - C_4 -алкілу, C_1 - C_4 -галоалкілу, C_1 - C_4 -алкокси, C_1 - C_4 -галоалкокси, C_1 - C_4 -алкоксикарбонілу, гетероциклілу, фенілу; найбільш переважно водень;

і їх застосовні в сільському господарстві солі; за винятком:

- Ізоксазоло[5,4-b]піридин-4-карбонова кислота, 6-циклопропіл-3-метил-2-(2,3-дигідро-1H-індол-1-іл)-1-метил-2-оксоетиловий ефір;

- Ізоксазоло[5,4-b]піридин-4-карбонова кислота, 6-циклопропіл-3-(2-фторфеніл)-метиловий ефір;

- Ізоксазоло[5,4-b]піридин-4-карбонова кислота, 6-циклопропіл-3-метил-2-[4-(метоксикарбоніл)-3,5-диметил-1H-пірол-2-іл]-1-метил-2-оксоетиловий ефір;

- Ізоксазоло[5,4-b]піридин-4-карбонова кислота, 6-циклопропіл-3-метил-(3-метил-2-хінокалініл)метиловий ефір;

- Ізоксазоло[5,4-b]піридин-4-карбонова кислота, 6-циклопропіл-3-метил-2-(2-метокси-4-метилфеніл)-2-оксоетиловий ефір;

- Ізоксазоло[5,4-b]піридин-4-карбонова кислота, 6-циклопропіл-3-метил-[5-(2-фураніл)-3-ізоксазоліл]метиловий ефір;

- Ізоксазоло[5,4-b]піридин-4-карбонова кислота, 6-циклопропіл-3-метил-2-(4-етоксифенокс)етилловий ефір;
- Ізоксазоло[5,4-b]піридин-4-карбонова кислота, 6-циклопропіл-3-метил-1-(5-феніл-1,3,4-оксадіазол-2-іл)етилловий ефір;
- 5 - Ізоксазоло[5,4-b]піридин-4-карбонова кислота, 6-циклопропіл-3-метил-2-(5-етил-2-тієніл)-2-оксоетилловий ефір;
- Ізоксазоло[5,4-b]піридин-4-карбонова кислота, 6-циклопропіл-3-метил-2-хлор-2-пропен-1-іловий ефір;
- Ізоксазоло[5,4-b]піридин-4-карбонова кислота, 3,6-дициклопропіл;
- 10 - Ізоксазоло[5,4-b]піридин-4-карбонова кислота, 6-циклопропіл-3-метил-2-(3,4-дигідро-1(2H)-хінолініл)-1-метил-2-оксоетилловий ефір;
- Ізоксазоло[5,4-b]піридин-4-карбонова кислота, 6-циклопропіл-3-метил-2-(3,4-диметоксифеніл)-2-оксоетилловий ефір;
- Ізоксазоло[5,4-b]піридин-4-карбонова кислота, 6-циклопропіл-3-метил-2-(3,4-дигідро-2(1H)-ізохінолініл)-1-метил-2-оксоетилловий ефір;
- 15 - Ізоксазоло[5,4-b]піридин-4-карбонова кислота, 6-циклопропіл-3-(1-етил-5-метил-1H-піразол-4-іл)-, метилловий ефір;
- Ізоксазоло[5,4-b]піридин-4-карбонова кислота, 6-циклопропіл-3-метил-2-(4-метоксифеніл)-1-метил-2-оксоетилловий ефір;
- 20 - Ізоксазоло[5,4-b]піридин-4-карбонова кислота, 6-циклопропіл-3-метил-[2-(3-тієніл)-4-тіазоліл]метилловий ефір;
- Ізоксазоло[5,4-b]піридин-4-карбонова кислота, 6-циклопропіл-3-(4-фторфеніл)-, метилловий ефір;
- Ізоксазоло[5,4-b]піридин-4-карбонова кислота, 6-циклопропіл-3-метил-2-піридинілметилловий ефір;
- 25 - Ізоксазоло[5,4-b]піридин-4-карбонова кислота, 6-циклопропіл-3-метил-2-(3-фтор-4-метоксифеніл)-2-оксоетилловий ефір;
- Ізоксазоло[5,4-b]піридин-4-карбонова кислота, 6-циклопропіл-3-метил-2-(4-фторфеніл)-1-метил-2-оксоетилловий ефір;
- 30 - Ізоксазоло[5,4-b]піридин-4-карбонова кислота, 6-циклопропіл-3-метил-2-оксо-2-(пентиламіно)етилловий ефір;
- Ізоксазоло[5,4-b]піридин-4-карбонова кислота, 6-циклопропіл-3-метил-(5-бром-2-метоксифеніл)метилловий ефір;
- Ізоксазоло[5,4-b]піридин-4-карбонова кислота, 6-циклопропіл-3-метил-1-метил-2-оксо-2-фенілетилловий ефір;
- 35 - Ізоксазоло[5,4-b]піридин-4-карбонова кислота, 6-циклопропіл-3-метил-1-метил-2-[(1-метилетил)аміно]-2-оксоетилловий ефір;
- Ізоксазоло[5,4-b]піридин-4-карбонова кислота, 6-циклопропіл-3-(4-метоксифеніл)-, метилловий ефір;
- 40 - Ізоксазоло[5,4-b]піридин-4-карбонова кислота, 6-циклопропіл-3-метил-(6-хлор-3-піридиніл)метилловий ефір;
- Ізоксазоло[5,4-b]піридин-4-карбонова кислота, 6-циклопропіл-3-метил-2-аміно-1-метил-2-оксоетилловий ефір;
- Ізоксазоло[5,4-b]піридин-4-карбонова кислота, 6-циклопропіл-3-метил-(2-хлор-6-фторфеніл)метилловий ефір;
- 45 - Ізоксазоло[5,4-b]піридин-4-карбонова кислота, 6-циклопропіл-3-метил-2-(2-бромфеніл)-2-оксоетилловий ефір;
- Ізоксазоло[5,4-b]піридин-4-карбонова кислота, 6-циклопропіл-3-метил-2-(1,1-диметилетокси)-2-оксоетилловий ефір;
- 50 - Ізоксазоло[5,4-b]піридин-4-карбонова кислота, 6-циклопропіл-3-метил-2-[2,5-диметил-1-(3-метилбутил)-1H-пірол-3-іл]-2-оксоетилловий ефір;
- Ізоксазоло[5,4-b]піридин-4-карбонова кислота, 6-циклопропіл-3-метил-2-(2,4-дигідроксифеніл)-2-оксоетилловий ефір;
- Ізоксазоло[5,4-b]піридин-4-карбонова кислота, 6-циклопропіл-3-метил-2-[2-(дифторметокси)-5-метилфеніл]-2-оксоетилловий ефір;
- 55 - Ізоксазоло[5,4-b]піридин-4-карбонова кислота, 6-циклопропіл-3-метил-2-(3-метил-2-бензофураніл)-2-оксоетилловий ефір;
- Ізоксазоло[5,4-b]піридин-4-карбонова кислота, 6-циклопропіл-3-метил-2-(2-метоксифеніл)-2-оксоетилловий ефір;
- 60 - Ізоксазоло[5,4-b]піридин-4-карбонова кислота, 6-циклопропіл-3-метил-2-(5-метил-2-тієніл)-

2-оксоетиловий ефір;

- Ізоксазоло[5,4-b]піридин-4-карбонова кислота, 6-циклопропіл-3-метил-2-оксо-2-(2,3,4,5-тетраметилфеніл)етиловий ефір;

5 - Ізоксазоло[5,4-b]піридин-4-карбонова кислота, 6-циклопропіл-3-метил-[5-(2-тієніл)-1,3,4-оксадіазол-2-іл]метиловий ефір;

- Ізоксазоло[5,4-b]піридин-4-карбонова кислота, 6-циклопропіл-3-(4-метилфеніл)-, метиловий ефір;

- Ізоксазоло[5,4-b]піридин-4-карбонова кислота, 6-циклопропіл-3-метил-(3-фтор-4-метоксифеніл)метиловий ефір;

10 - Ізоксазоло[5,4-b]піридин-4-карбонова кислота, 6-циклопропіл-3-метил-(7-метил-4-оксо-4Н-піридо[1,2-а]піримідин-2-іл)метиловий ефір;

- Ізоксазоло[5,4-b]піридин-4-карбонова кислота, 6-циклопропіл-3-метил-2-(4-метоксифеніл)етиловий ефір;

15 - Ізоксазоло[5,4-b]піридин-4-карбонова кислота, 6-циклопропіл-3-(1,3,5-триметил-1Н-піразол-4-іл);

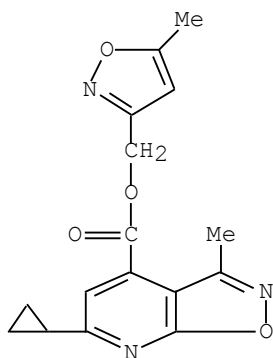
- Ізоксазоло[5,4-b]піридин-4-карбонова кислота, 6-циклопропіл-3-метил-(1-бутил-1Н-тетразол-5-іл)метиловий ефір;

- Ізоксазоло[5,4-b]піридин-4-карбонова кислота, 6-циклопропіл-3-метил-2-(1Н-індол-3-іл)-1-метил-2-оксоетиловий ефір;

20 - Ізоксазоло[5,4-b]піридин-4-карбонова кислота, 6-циклопропіл-3-метил-2-бензоксазолілметиловий ефір;

- Ізоксазоло[5,4-b]піридин-4-карбонова кислота, 6-циклопропіл-3-метил-1-метилетиловий ефір;

25 - Ізоксазоло[5,4-b]піридин-4-карбонова кислота, 6-циклопропіл-3-метил-2-[(1-метилбутил)аміно]-2-оксоетиловий ефір;



;

30 - Ізоксазоло[5,4-b]піридин-4-карбонова кислота, 6-циклопропіл-3-метил-ціанометиловий ефір;

- Ізоксазоло[5,4-b]піридин-4-карбонова кислота, 6-циклопропіл-3-метил-[3-(метоксикарбоніл)-2-фураніл]метиловий ефір;

- Ізоксазоло[5,4-b]піридин-4-карбонова кислота, 6-циклопропіл-3-метил-(3-метил-5-ізоксазоліл)метиловий ефір;

35 - Ізоксазоло[5,4-b]піридин-4-карбонова кислота, 6-циклопропіл-3-метил-(5-хлор-1,2,3-тіадіазол-4-іл)метиловий ефір;

- Ізоксазоло[5,4-b]піридин-4-карбонова кислота, 6-циклопропіл-3-(1,1-диметиламіно);

- Ізоксазоло[5,4-b]піридин-4-карбонова кислота, 6-циклопропіл-3-метил-2-[(1,5-диметилгексил)аміно]-2-оксоетиловий ефір;

40 - Ізоксазоло[5,4-b]піридин-4-карбонова кислота, 6-циклопропіл-3-феніл-, метиловий ефір;

- Ізоксазоло[5,4-b]піридин-4-карбонова кислота, 6-циклопропіл-3-метил-2-(2-оксо-1-імідазолідиніл)-2-оксоетиловий ефір;

- Ізоксазоло[5,4-b]піридин-4-карбонова кислота, 6-циклопропіл-3-(4-метоксифеніл);

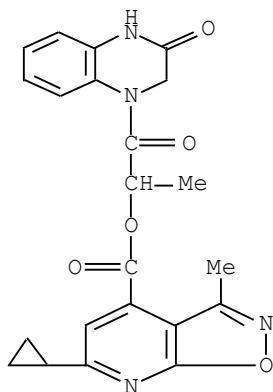
45 - Ізоксазоло[5,4-b]піридин-4-карбонова кислота, 6-циклопропіл-3-метил-2-метокси-2-оксоетиловий ефір;

- Ізоксазоло[5,4-b]піридин-4-карбонова кислота, 6-циклопропіл-3-метил-2-(2,4-диметоксифеніл)-2-оксоетиловий ефір;

- Ізоксазоло[5,4-b]піридин-4-карбонова кислота, 6-циклопропіл-3-метил-4-(2-оксо-1-

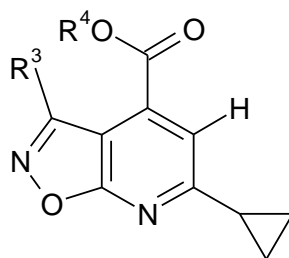
піролідині)феніловий ефір;

- Ізоксазоло[5,4-*b*]піридин-4-карбонова кислота, 3,6-дициклопропіл-, метиловий ефір;
- Ізоксазоло[5,4-*b*]піридин-4-карбонова кислота, 3,6-дициклопропіл-, етиловий ефір;
- Ізоксазоло[5,4-*b*]піридин-4-карбонова кислота, 6-циклопропіл-3-метил-(3,5-диметил-4-ізоксазоліл)метиловий ефір;



;

- Ізоксазоло[5,4-*b*]піридин-4-карбонова кислота, 6-циклопропіл-3-метил-[3-(2-тієніл)-1,2,4-оксадіазол-5-іл]метиловий ефір;
 - Ізоксазоло[5,4-*b*]піридин-4-карбонова кислота, 6-циклопропіл-3-(1,3,5-триметил-1Н-піразол-4-іл)-, метиловий ефір;
 - Ізоксазоло[5,4-*b*]піридин-4-карбонова кислота, 6-циклопропіл-3-метил-2,3-дихлорфеніловий ефір;
 - Ізоксазоло[5,4-*b*]піридин-4-карбонова кислота, 6-циклопропіл-3-метил-(8-метилімідазо[1,2-*a*]піридин-2-іл)метиловий ефір;
 - Ізоксазоло[5,4-*b*]піридин-4-карбонова кислота, 6-циклопропіл-3-метил-(2-етил-4-тіазоліл)метиловий ефір;
 - Ізоксазоло[5,4-*b*]піридин-4-карбонова кислота, 6-циклопропіл-3-(2,2-диметилпропіл);
 - Ізоксазоло[5,4-*b*]піридин-4-карбонова кислота, 6-циклопропіл-3-(2,2-диметилпропіл) -, метиловий ефір;
 - Ізоксазоло[5,4-*b*]піридин-4-карбонова кислота, 6-циклопропіл-3-(2,2-диметилпропіл) -, етиловий ефір;
 - Ізоксазоло[5,4-*b*]піридин-4-карбонова кислота, 6-циклопропіл-3-пропіл;
 - Ізоксазоло[5,4-*b*]піридин-4-карбонова кислота, 6-циклопропіл-3-пропіл-, метиловий ефір;
 - Ізоксазоло[5,4-*b*]піридин-4-карбонова кислота, 6-циклопропіл-3-пропіл-, етиловий ефір;
 - Ізоксазоло[5,4-*b*]піридин-4-карбонова кислота, 6-циклопропіл-3-(2-фураніл);
 - Ізоксазоло[5,4-*b*]піридин-4-карбонова кислота, 6-циклопропіл-3-(2-фураніл)-, метиловий ефір;
 - Ізоксазоло[5,4-*b*]піридин-4-карбонова кислота, 6-циклопропіл-3-(2-фураніл)-, етиловий ефір;
 - Ізоксазоло[5,4-*b*]піридин-4-карбонова кислота, 6-циклопропіл-3-феніл;
 - Ізоксазоло[5,4-*b*]піридин-4-карбонова кислота, 6-циклопропіл-3-феніл-, етиловий ефір
 - Ізоксазоло[5,4-*b*]піридин-4-карбонова кислота, 6-циклопропіл-3-метил;
 - Ізоксазоло[5,4-*b*]піридин-4-карбонова кислота, 6-циклопропіл-3-метил-, метиловий ефір;
 - Ізоксазоло[5,4-*b*]піридин-4-карбонова кислота, 6-циклопропіл-3-метил-, етиловий ефір;
 - Ізоксазоло[5,4-*b*]піридин-4-карбонова кислота, 6-циклопропіл-3-(1-метилетил);
 - Ізоксазоло[5,4-*b*]піридин-4-карбонова кислота, 6-циклопропіл-3-(1-метилетил)-, метиловий ефір;
 - Ізоксазоло[5,4-*b*]піридин-4-карбонова кислота, 6-циклопропіл-3-(1-метилетил)-, етиловий ефір;
- У переважному варіанті здійснення, об'єктом даного винаходу також є ізоксазоло[5,4-*b*]піридинові сполуки формули I



в якій

R^1 означає водень;

5 R^2 означає циклопропіл;

R^3 означає водень, галоген, гідрокси, C_1 - C_6 -алкіл, C_1 - C_6 -галоалкіл, C_1 - C_6 -гідроксіалкіл, C_1 - C_6 -алкокси- C_1 - C_6 -алкіл, C_1 - C_6 -галоалкокси- C_1 - C_6 -алкіл, C_3 - C_6 -циклоалкіл- C_1 - C_6 -алкіл, C_3 - C_6 -галоциклоалкіл- C_1 - C_6 -алкіл, C_3 - C_6 -циклоалкеніл, C_3 - C_6 -галоциклоалкеніл, C_1 - C_4 -алкіл- C_3 - C_6 -циклоалкіл, C_3 - C_6 -циклоалкеніл, C_3 - C_6 -галоциклоалкеніл, феніл- C_1 - C_6 -алкіл, гетероцикліл- C_1 - C_6 -алкіл, C_2 - C_6 -алкеніл, C_2 - C_6 -галоалкеніл, C_2 - C_6 -алкініл, C_2 - C_6 -галоалкініл, C_1 - C_6 -алкокси, C_1 - C_6 -галоалкокси, C_1 - C_6 -алкілтіо, C_1 - C_6 -галоалкілтіо, аміно, C_1 - C_6 -алкіламіно, N,N -ді-(C_1 - C_6)-алкіламіно, гетероцикліл, феніл; причому гетероциклільні й фенільні частини R^3 можуть бути незаміщеними або заміщеними одним або декількома радикалами, вибраними з галогену, гідрокси, нітро, ціано, C_1 - C_4 -алкілу, C_1 - C_4 -галоалкілу, C_1 - C_4 -алкокси- C_1 - C_4 -алкілу, C_3 - C_6 -циклоалкілу, C_2 - C_6 -алкенілу, C_2 - C_6 -алкінілу, C_1 - C_4 -алкокси, C_1 - C_4 -галоалкокси, C_1 - C_4 -алкоксикарбонілу, C_1 - C_4 -алкілтіо, C_1 - C_4 -алкілсульфінілу, C_1 - C_4 -алкілсульфонілу, аміно, C_1 - C_4 -алкіламіно, N,N -ді-(C_1 - C_4)-алкіламіно, гетероциклілу, фенілу;

X означає OR^4 ;

20 R^4 означає водень, C_1 - C_6 -алкіл, C_1 - C_6 -галоалкіл, C_1 - C_6 -ціаноалкіл, C_1 - C_6 -алкокси- C_1 - C_6 -алкіл, C_1 - C_6 -галоалкокси- C_1 - C_6 -алкіл, C_2 - C_6 -алкеніл, C_2 - C_6 -галоалкеніл, C_2 - C_6 -алкініл;

і їх застосовні в сільському господарстві солі; за винятком:

- Ізоксазоло[5,4- b]піридин-4-карбонова кислота, 6-циклопропіл-3-(2-фторфеніл)-метиловий ефір;

25 - Ізоксазоло[5,4- b]піридин-4-карбонова кислота, 6-циклопропіл-3-метил-2-хлор-2-пропен-1-іловий ефір;

- Ізоксазоло[5,4- b]піридин-4-карбонова кислота, 3,6-дициклопропіл;

- Ізоксазоло[5,4- b]піридин-4-карбонова кислота, 6-циклопропіл-3-(1-етил-5-метил-1Н-піразол-4-іл)-, метиловий ефір;

30 - Ізоксазоло[5,4- b]піридин-4-карбонова кислота, 6-циклопропіл-3-(4-фторфеніл)-, метиловий ефір;

- Ізоксазоло[5,4- b]піридин-4-карбонова кислота, 6-циклопропіл-3-(4-метоксифеніл)-, метиловий ефір;

35 - Ізоксазоло[5,4- b]піридин-4-карбонова кислота, 6-циклопропіл-3-(4-метилфеніл)-, метиловий ефір;

- Ізоксазоло[5,4- b]піридин-4-карбонова кислота, 6-циклопропіл-3-(1,3,5-триметил-1Н-піразол-4-іл);

- Ізоксазоло[5,4- b]піридин-4-карбонова кислота, 6-циклопропіл-3-метил-1-метилетиловий ефір;

40 - Ізоксазоло[5,4- b]піридин-4-карбонова кислота, 6-циклопропіл-3-метил-ціанометиловий ефір;

- Ізоксазоло[5,4- b]піридин-4-карбонова кислота, 6-циклопропіл-3-(1,1-диметиламіно);

- Ізоксазоло[5,4- b]піридин-4-карбонова кислота, 6-циклопропіл-3-феніл-, метиловий ефір;

- Ізоксазоло[5,4- b]піридин-4-карбонова кислота, 6-циклопропіл-3-(4-метоксифеніл);

45 - Ізоксазоло[5,4- b]піридин-4-карбонова кислота, 3,6-дициклопропіл-, метиловий ефір;

- Ізоксазоло[5,4- b]піридин-4-карбонова кислота, 3,6-дициклопропіл-, етиловий ефір;

- Ізоксазоло[5,4- b]піридин-4-карбонова кислота, 6-циклопропіл-3-(1,3,5-триметил-1Н-піразол-4-іл)-, метиловий ефір;

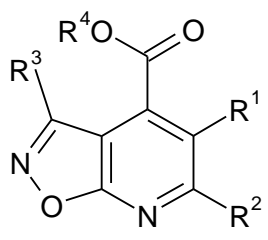
- Ізоксазоло[5,4- b]піридин-4-карбонова кислота, 6-циклопропіл-3-(2,2-диметилпропіл);

50 - Ізоксазоло[5,4- b]піридин-4-карбонова кислота, 6-циклопропіл-3-(2,2-диметилпропіл) -, метиловий ефір;

- Ізоксазоло[5,4- b]піридин-4-карбонова кислота, 6-циклопропіл-3-(2,2-диметилпропіл) -, етиловий ефір;

- Ізоксазоло[5,4-*b*]піридин-4-карбонова кислота, 6-циклопропіл-3-пропіл;
- Ізоксазоло[5,4-*b*]піридин-4-карбонова кислота, 6-циклопропіл-3-пропіл-, метиловий ефір;
- Ізоксазоло[5,4-*b*]піридин-4-карбонова кислота, 6-циклопропіл-3-пропіл-, етиловий ефір;
- Ізоксазоло[5,4-*b*]піридин-4-карбонова кислота, 6-циклопропіл-3-(2-фураніл);
- 5 - Ізоксазоло[5,4-*b*]піридин-4-карбонова кислота, 6-циклопропіл-3-(2-фураніл)-, метиловий ефір;
- Ізоксазоло[5,4-*b*]піридин-4-карбонова кислота, 6-циклопропіл-3-(2-фураніл)-, етиловий ефір;
- Ізоксазоло[5,4-*b*]піридин-4-карбонова кислота, 6-циклопропіл-3-феніл;
- 10 - Ізоксазоло[5,4-*b*]піридин-4-карбонова кислота, 6-циклопропіл-3-феніл-, етиловий ефір
- Ізоксазоло[5,4-*b*]піридин-4-карбонова кислота, 6-циклопропіл-3-метил;
- Ізоксазоло[5,4-*b*]піридин-4-карбонова кислота, 6-циклопропіл-3-метил-, метиловий ефір;
- Ізоксазоло[5,4-*b*]піридин-4-карбонова кислота, 6-циклопропіл-3-метил-, етиловий ефір;
- Ізоксазоло[5,4-*b*]піридин-4-карбонова кислота, 6-циклопропіл-3-(1-метилетил);
- 15 - Ізоксазоло[5,4-*b*]піридин-4-карбонова кислота, 6-циклопропіл-3-(1-метилетил)-, метиловий ефір;
- Ізоксазоло[5,4-*b*]піридин-4-карбонова кислота, 6-циклопропіл-3-(1-метилетил)-, етиловий ефір;

Крім того, об'єктом даного винаходу також є ізоксазоло[5,4-*b*]піридинові сполуки формули I



в якій

R^1 означає галоген;

25 R^2 водень, C_1 - C_6 -алкіл, C_1 - C_6 -галоалкіл, C_1 - C_6 -гідроксіалкіл, C_3 - C_6 -циклоалкіл, C_3 - C_6 -галоциклоалкіл, C_2 - C_6 -алкеніл, C_2 - C_6 -алкініл;

R^3 означає водень, галоген, гідрокси, C_1 - C_6 -алкіл, C_1 - C_6 -галоалкіл, C_1 - C_6 -гідроксіалкіл, C_1 - C_6 -алкокси- C_1 - C_6 -алкіл, C_1 - C_6 -галоалкокси- C_1 - C_6 -алкіл, C_3 - C_6 -циклоалкіл- C_1 - C_6 -алкіл, C_3 - C_6 -галоциклоалкіл- C_1 - C_6 -алкіл, C_3 - C_6 -циклоалкіл, C_3 - C_6 -галоциклоалкіл, C_1 - C_4 -алкіл- C_3 - C_6 -циклоалкіл, C_3 - C_6 -циклоалкеніл, C_3 - C_6 -галоциклоалкеніл, феніл- C_1 - C_6 -алкіл, гетероцикліл- C_1 - C_6 -алкіл, C_2 - C_6 -алкеніл, C_2 - C_6 -галоалкеніл, C_2 - C_6 -алкініл, C_2 - C_6 -галоалкініл, C_1 - C_6 -алкокси, C_1 - C_6 -галоалкокси, C_1 - C_6 -алкілтіо, C_1 - C_6 -галоалкілтіо, аміно, C_1 - C_6 -алкіламіно, N,N -ді-(C_1 - C_6)-алкіламіно, гетероцикліл, феніл; причому гетероциклільні й фенільні частини R^3 можуть бути незаміщеними або заміщеними одним або декількома радикалами, вибраними з галогену, гідрокси, нітро, ціано, C_1 - C_4 -алкілу, C_1 - C_4 -галоалкілу, C_1 - C_4 -алкокси- C_1 - C_4 -алкілу, C_3 - C_6 -циклоалкілу, C_2 - C_6 -алкенілу, C_2 - C_6 -алкінілу, C_1 - C_4 -алкокси, C_1 - C_4 -галоалкокси, C_1 - C_4 -алкоксикарбонілу, C_1 - C_4 -алкілтіо, C_1 - C_4 -алкілсульфінілу, C_1 - C_4 -алкілсульфонілу, аміно, C_1 - C_4 -алкіламіно, N,N -ді-(C_1 - C_4)-алкіламіно, гетероциклілу, фенілу;

X означає OR^4

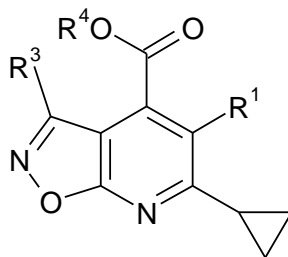
40 R^4 означає водень, C_1 - C_6 -алкіл, C_1 - C_6 -галоалкіл, C_1 - C_6 -гідроксіалкіл, C_1 - C_6 -ціаноалкіл, C_1 - C_6 -алкокси- C_1 - C_6 -алкіл, C_1 - C_6 -алкокси- C_1 - C_6 -алкокси- C_1 - C_6 -алкіл, C_1 - C_6 -галоалкокси- C_1 - C_6 -алкіл, C_2 - C_6 -алкенілокси- C_1 - C_6 -алкіл, C_2 - C_6 -галоалкенілокси- C_1 - C_6 -алкіл, C_1 - C_6 -алкоксикарбоніл- C_1 - C_6 -алкіл, амінокарбоніл- C_1 - C_6 -алкіл, C_1 - C_6 -алкіл-амінокарбоніл- C_1 - C_6 -алкіл, N,N -ді-(C_1 - C_6 -алкіл)-амінокарбоніл- C_1 - C_6 -алкіл, $[N-(C_3-C_6$ -циклоалкіл- C_1 - C_6 -алкіл), $N-(C_1$ - C_6 -алкіл)]-амінокарбоніл- C_1 - C_6 -алкіл, C_1 - C_6 -алкокси-амінокарбоніл- C_1 - C_6 -алкіл, C_2 - C_6 -алкеніл, C_2 - C_6 -галоалкеніл, C_2 - C_6 -алкініл- C_2 - C_6 -алкеніл, C_2 - C_6 -алкініл, C_2 - C_6 -галоалкініл, гетероцикліл, феніл, гетероциклілкарбоніл, фенілкарбоніл, гетероциклілкарбоніл- C_1 - C_6 -алкіл, фенілкарбоніл- C_1 - C_6 -алкіл, гетероцикліл- C_1 - C_6 -алкіл, феніл- C_1 - C_6 -алкіл; причому фенільні і гетероциклільні частини R^4 і R^5 можуть бути незаміщеними або заміщеними одним або декількома радикалами, вибраними з галогену, C_1 - C_4 -алкілу, C_1 - C_4 -галоалкілу, C_1 - C_4 -алкокси, C_1 - C_4 -галоалкокси, C_1 - C_4 -алкоксикарбонілу, гетероциклілу, фенілу; найбільш переважно водень;

і їх застосовні в сільському господарстві солі; за винятком:

- Ізоксазоло [5,4-*b*]піридин-4-карбонова кислота, 5-хлор-6-циклопропіл-3-метил;

- Ізоксазоло[5,4-b]піридин-4-карбонова кислота, 5-хлор-6-циклопропіл-3-метил-, метиловий ефір;
 - Ізоксазоло[5,4-b]піридин-4-карбонова кислота, 5-хлор-3,5-диметил;
 Крім того, об'єктом даного винаходу також є ізоксазоло[5,4-b]піридинові сполуки формули I

5



в якій

10 R^1 означає гідроксил, C_1 - C_6 -алкіл, C_1 - C_6 -галоалкіл, C_1 - C_6 -алкокси- C_1 - C_6 -алкіл, C_3 - C_6 -циклоалкіл, C_3 - C_6 -галоциклоалкіл, C_2 - C_6 -алкеніл, C_2 - C_6 -алкініл, C_1 - C_6 -алкокси, C_1 - C_6 -галоалкокси, феніл, феніл- C_1 - C_4 -алкіл;

R^2 означає циклопропіл;

15 R^3 означає водень, галоген, гідрокси, C_1 - C_6 -алкіл, C_1 - C_6 -галоалкіл, C_1 - C_6 -гідроксіалкіл, C_1 - C_6 -алкокси- C_1 - C_6 -алкіл, C_1 - C_6 -галоалкокси- C_1 - C_6 -алкіл, C_3 - C_6 -циклоалкіл- C_1 - C_6 -алкіл, C_3 - C_6 -галоциклоалкіл- C_1 - C_6 -алкіл, C_3 - C_6 -циклоалкіл, C_3 - C_6 -галоциклоалкіл, C_1 - C_4 -алкіл- C_3 - C_6 -циклоалкіл, C_3 - C_6 -циклоалкеніл, C_3 - C_6 -галоциклоалкеніл, феніл- C_1 - C_6 -алкіл, гетероцикліл- C_1 - C_6 -алкіл, C_2 - C_6 -алкеніл, C_2 - C_6 -галоалкеніл, C_2 - C_6 -алкініл, C_2 - C_6 -галоалкініл, C_1 - C_6 -алкокси, C_1 - C_6 -галоалкокси, C_1 - C_6 -алкілтіо, C_1 - C_6 -галоалкілтіо, аміно, C_1 - C_6 -алкіламіно, N,N-ді-(C_1 - C_6 -алкіламіно, гетероцикліл, феніл; причому гетероциклільні й фенільні частини R^3 можуть бути
 20 незаміщеними або заміщеними одним або декількома радикалами, вибраними з галогену, гідрокси, нітро, ціано, C_1 - C_4 -алкілу, C_1 - C_4 -галоалкілу, C_1 - C_4 -алкокси- C_1 - C_4 -алкілу, C_3 - C_6 -циклоалкілу, C_2 - C_6 -алкеніл, C_2 - C_6 -алкінілу, C_1 - C_4 -алкокси, C_1 - C_4 -галоалкокси, C_1 - C_4 -алкоксикарбонілу, C_1 - C_4 -алкілтіо, C_1 - C_4 -алкілсульфінілу, C_1 - C_4 -алкілсульфонілу, аміно, C_1 - C_4 -алкіламіно, N,N-ді-(C_1 - C_4 -алкіламіно, гетероциклілу, фенілу;

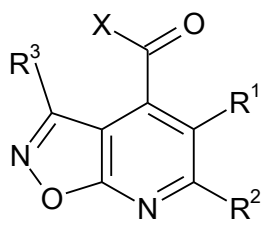
25 X означає OR^4

R^4 означає водень, C_1 - C_6 -алкіл, C_1 - C_6 -галоалкіл, C_1 - C_6 -гідроксіалкіл, C_1 - C_6 -ціаноалкіл, C_1 - C_6 -алкокси- C_1 - C_6 -алкіл, C_1 - C_6 -алкокси- C_1 - C_6 -алкокси- C_1 - C_6 -алкіл, C_1 - C_6 -галоалкокси- C_1 - C_6 -алкіл, C_2 - C_6 -алкенілокси- C_1 - C_6 -алкіл, C_2 - C_6 -галоалкенілокси- C_1 - C_6 -алкіл, C_1 - C_6 -алкоксикарбоніл- C_1 - C_6 -алкіл, амінокарбоніл- C_1 - C_6 -алкіл, C_1 - C_6 -алкіл-амінокарбоніл- C_1 - C_6 -алкіл, N,N-ді-(C_1 - C_6 -алкіл)-амінокарбоніл- C_1 - C_6 -алкіл, [N-(C_3 - C_6 -циклоалкіл- C_1 - C_6 -алкіл), N-(C_1 - C_6 -алкіл)]-амінокарбоніл- C_1 - C_6 -алкіл, C_1 - C_6 -алкокси-амінокарбоніл- C_1 - C_6 -алкіл, C_2 - C_6 -алкеніл, C_2 - C_6 -галоалкеніл, C_2 - C_6 -алкініл, C_2 - C_6 -галоалкініл, гетероцикліл, феніл, гетероциклілкарбоніл, фенілкарбоніл, гетероциклілкарбоніл- C_1 - C_6 -алкіл, фенілкарбоніл- C_1 - C_6 -алкіл, гетероцикліл- C_1 - C_6 -алкіл, феніл- C_1 - C_6 -алкіл; причому фенільні і гетероциклільні частини
 35 R^4 і R^5 можуть бути незаміщеними або заміщеними одним або декількома радикалами, вибраними з галогену, C_1 - C_4 -алкілу, C_1 - C_4 -галоалкілу, C_1 - C_4 -алкокси, C_1 - C_4 -галоалкокси, C_1 - C_4 -алкоксикарбонілу, гетероциклілу, фенілу; найбільш переважно водень;

і їх застосовні в сільському господарстві солі.

Крім того, об'єктом даного винаходу також є ізоксазоло[5,4-b]піридинові сполуки формули I

40



в якій

45 R^1 означає водень, галоген, C_1 - C_6 -алкіл, C_1 - C_6 -галоалкіл;

R^2 означає водень, C_1 - C_6 -алкіл, C_1 - C_6 -галоалкіл, C_1 - C_6 -гідроксіалкіл, C_3 - C_6 -циклоалкіл, C_3 - C_6 -галоциклоалкіл, C_2 - C_6 -алкеніл, C_2 - C_6 -алкініл;

R^3 водень, галоген, гідрокси, C_1 - C_6 -алкіл, C_1 - C_6 -галоалкіл, C_1 - C_6 -гідроксіалкіл, C_1 - C_6 -алкокси- C_1 - C_6 -алкіл, C_1 - C_6 -галоалкокси- C_1 - C_6 -алкіл, C_3 - C_6 -циклоалкіл- C_1 - C_6 -алкіл, C_3 - C_6 -галоциклоалкіл- C_1 - C_6 -алкіл, C_3 - C_6 -циклоалкіл, C_3 - C_6 -галоциклоалкіл, C_1 - C_4 -алкіл- C_3 - C_6 -циклоалкіл, C_3 - C_6 -циклоалкеніл, C_3 - C_6 -галоциклоалкеніл, феніл- C_1 - C_6 -алкіл, гетероцикліл- C_1 - C_6 -алкіл, C_2 - C_6 -алкеніл, C_2 - C_6 -галоалкеніл, C_2 - C_6 -алкініл, C_2 - C_6 -галоалкініл, C_1 - C_6 -алкокси, C_1 - C_6 -галоалкокси, C_1 - C_6 -алкілтіо, C_1 - C_6 -галоалкілтіо, аміно, C_1 - C_6 -алкіламіно, N,N-ді-(C_1 - C_6)-алкіламіно, гетероцикліл, феніл; причому гетероциклільні й фенільні частини R^3 можуть бути незаміщеними або заміщеними одним або декількома радикалами, вибраними з галогену, гідрокси, нітро, ціано, C_1 - C_4 -алкілу, C_1 - C_4 -галоалкілу, C_1 - C_4 -алкокси- C_1 - C_4 -алкілу, C_3 - C_6 -циклоалкілу, C_2 - C_6 -алкенілу, C_2 - C_6 -алкінілу, C_1 - C_4 -алкокси, C_1 - C_4 -галоалкокси, C_1 - C_4 -алкоксикарбонілу, C_1 - C_4 -алкілтіо, C_1 - C_4 -алкілсульфінілу, C_1 - C_4 -алкілсульфонілу, аміно, C_1 - C_4 -алкіламіно, N,N-ді-(C_1 - C_4)-алкіламіно, гетероциклілу, фенілу;

X означає OR^4 , SR^5 ;

R^4 означає водень, C_1 - C_6 -алкіл, C_1 - C_6 -галоалкіл, C_1 - C_6 -ціаноалкіл, C_1 - C_6 -алкокси- C_1 - C_6 -алкіл, C_1 - C_6 -галоалкокси- C_1 - C_6 -алкіл, C_2 - C_6 -алкеніл, C_2 - C_6 -галоалкеніл, C_2 - C_6 -алкініл;

і їх застосовні в сільському господарстві солі; за винятком:

- Ізоксазоло[5,4-b]піридин-4-карбонова кислота, 6-циклопропіл-3-(2-фторфеніл)-метиловий ефір;

- Ізоксазоло[5,4-b]піридин-4-карбонова кислота, 6-циклопропіл-3-метил-2-хлор-2-пропен-1-іловий ефір;

- Ізоксазоло[5,4-b]піридин-4-карбонова кислота, 3,6-дициклопропіл;

- Ізоксазоло[5,4-b]піридин-4-карбонова кислота, 6-циклопропіл-3-(1-етил-5-метил-1H-піразол-4-іл)-, метиловий ефір;

- Ізоксазоло[5,4-b]піридин-4-карбонова кислота, 6-циклопропіл-3-(4-фторфеніл)-, метиловий ефір;

- Ізоксазоло[5,4-b]піридин-4-карбонова кислота, 6-циклопропіл-3-(4-метоксифеніл)-, метиловий ефір;

- Ізоксазоло[5,4-b]піридин-4-карбонова кислота, 6-циклопропіл-3-(4-метилфеніл)-, метиловий ефір;

- Ізоксазоло[5,4-b]піридин-4-карбонова кислота, 6-циклопропіл-3-(1,3,5-триметил-1H-піразол-4-іл);

- Ізоксазоло[5,4-b]піридин-4-карбонова кислота, 6-циклопропіл-3-метил-метиловий ефір;

- Ізоксазоло[5,4-b]піридин-4-карбонова кислота, 6-циклопропіл-3-метил-1-метилетиловий ефір;

- Ізоксазоло[5,4-b]піридин-4-карбонова кислота, 6-циклопропіл-3-метил-ціанометиловий ефір;

- Ізоксазоло[5,4-b]піридин-4-карбонова кислота, 6-циклопропіл-3-(1,1-диметиламіно);

- Ізоксазоло[5,4-b]піридин-4-карбонова кислота, 6-циклопропіл-3-феніл-, метиловий ефір;

- Ізоксазоло[5,4-b]піридин-4-карбонова кислота, 6-циклопропіл-3-(4-метоксифеніл);

- Ізоксазоло[5,4-b]піридин-4-карбонова кислота, 3,6-дициклопропіл-, метиловий ефір;

- Ізоксазоло[5,4-b]піридин-4-карбонова кислота, 6-циклопропіл-3-(1,3,5-триметил-1H-піразол-4-іл)-, метиловий ефір;

- Ізоксазоло[5,4-b]піридин-4-карбонова кислота, 6-циклопропіл-3-(2,2-диметилпропіл);

- Ізоксазоло[5,4-b]піридин-4-карбонова кислота, 6-циклопропіл-3-пропіл;

- Ізоксазоло[5,4-b]піридин-4-карбонова кислота, 6-циклопропіл-3-(2-фураніл);

- Ізоксазоло[5,4-b]піридин-4-карбонова кислота, 6-циклопропіл-3-феніл;

- Ізоксазоло[5,4-b]піридин-4-карбонова кислота, 6-циклопропіл-3-метил;

- Ізоксазоло[5,4-b]піридин-4-карбонова кислота, 6-циклопропіл-3-(1-метилетил);

- Ізоксазоло[5,4-b]піридин-4-карбонова кислота, 3,6-диметил;

- Ізоксазоло[5,4-b]піридин-4-карбонова кислота, 6-метил-3-пропіл;

- Ізоксазоло[5,4-b]піридин-4-карбонова кислота, 6-метил-3-(1-метилетил);

- Ізоксазоло[5,4-b]піридин-4-карбонова кислота, 6-метил-3-(1,1-диметиламіно);

- Ізоксазоло[5,4-b]піридин-4-карбонова кислота, 6-метил-3-(2,2-диметилпропіл);

- Ізоксазоло[5,4-b]піридин-4-карбонова кислота, 6-метил-3-циклопропіл;

- Ізоксазоло[5,4-b]піридин-4-карбонова кислота, 6-метил-3-феніл;

- Ізоксазоло[5,4-b]піридин-4-карбонова кислота, 6-метил-3-(4-метилфеніл);

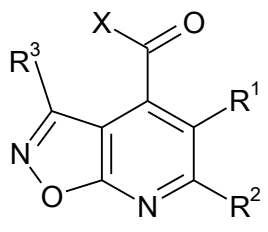
- Ізоксазоло[5,4-b]піридин-4-карбонова кислота, 6-метил-3-(3-метоксифеніл);

- Ізоксазоло[5,4-b]піридин-4-карбонова кислота, 6-метил-3-(4-метоксифеніл);

- Ізоксазоло[5,4-b]піридин-4-карбонова кислота, 6-метил-3-(4-фторфеніл);

- Ізоксазоло[5,4-b]піридин-4-карбонова кислота, 6-метил-3-(3,4-дихлорфеніл);

- Ізоксазоло[5,4-*b*]піридин-4-карбонова кислота, 6-метил-3-(2-фураніл);
 - Ізоксазоло[5,4-*b*]піридин-4-карбонова кислота, 6-метил-3-(1,3,5-триметил-1Н-піразол-4-іл);
 - Ізоксазоло[5,4-*b*]піридин-4-карбонова кислота, 6-метил-3-(1-етил-5-метил-1Н-піразол-4-іл);
 - Ізоксазоло[5,4-*b*]піридин-4-карбонова кислота, 6-етил-3-метил;
 - 5 - Ізоксазоло[5,4-*b*]піридин-4-карбонова кислота, 6-етил-3-пропіл;
 - Ізоксазоло[5,4-*b*]піридин-4-карбонова кислота, 6-етил-3-(1-метилетил);
 - Ізоксазоло[5,4-*b*]піридин-4-карбонова кислота, 6-етил-3-(2,2-диметилпропіл);
 - Ізоксазоло[5,4-*b*]піридин-4-карбонова кислота, 6-етил-3-циклопропіл;
 - Ізоксазоло[5,4-*b*]піридин-4-карбонова кислота, 6-етил-3-(1,3,5-триметил-1Н-піразол-4-іл);
 - 10 - Ізоксазоло[5,4-*b*]піридин-4-карбонова кислота, 6-(1-метилетил)-3-метил;
 - Ізоксазоло[5,4-*b*]піридин-4-карбонова кислота, 6-(1-метилетил)-3-пропіл;
 - Ізоксазоло[5,4-*b*]піридин-4-карбонова кислота, 3,6-бис(1-метилетил);
 - Ізоксазоло[5,4-*b*]піридин-4-карбонова кислота, 6-(1-метилетил)-3-(1,1-диметиламіно);
 - Ізоксазоло[5,4-*b*]піридин-4-карбонова кислота, 6-(1-метилетил)-3-(2,2-диметилпропіл);
 - 15 - Ізоксазоло[5,4-*b*]піридин-4-карбонова кислота, 6-(1-метилетил)-3-циклопропіл;
 - Ізоксазоло[5,4-*b*]піридин-4-карбонова кислота, 6-(1-метилетил)-3-феніл;
 - Ізоксазоло[5,4-*b*]піридин-4-карбонова кислота, 6-(1-метилетил)-3-(3-метоксифеніл);
 - Ізоксазоло[5,4-*b*]піридин-4-карбонова кислота, 6-(1-метилетил)-3-(2-фураніл);
 - Ізоксазоло[5,4-*b*]піридин-4-карбонова кислота, 5-хлор-6-циклопропіл-3-метил;
 - 20 - Ізоксазоло[5,4-*b*]піридин-4-карбонова кислота, 5-хлор-6-циклопропіл-3-метил-, метиловий ефір;
 - Ізоксазоло[5,4-*b*]піридин-4-карбонова кислота, 5-хлор-3,5-диметил;
- Крім того, об'єктом даного винаходу також є ізоксазоло[5,4-*b*]піридинові сполуки формули I



в якій

R^1 означає водень, галоген, C_1 - C_6 -алкіл, C_1 - C_6 -галоалкіл;

R^2 означає водень, C_1 - C_6 -алкіл, C_1 - C_6 -галоалкіл, C_1 - C_6 -гідроксіалкіл, C_3 - C_6 -циклоалкіл, C_3 - C_6 -галоциклоалкіл, C_2 - C_6 -алкеніл, C_2 - C_6 -алкініл;

R^3 водень, галоген, гідрокси, C_1 - C_6 -алкіл, C_1 - C_6 -галоалкіл, C_1 - C_6 -гідроксіалкіл, C_1 - C_6 -алкокси- C_1 - C_6 -алкіл, C_1 - C_6 -галоалкокси- C_1 - C_6 -алкіл, C_3 - C_6 -циклоалкіл- C_1 - C_6 -алкіл, C_3 - C_6 -галоциклоалкіл- C_1 - C_6 -алкіл, C_3 - C_6 -циклоалкіл, C_3 - C_6 -галоциклоалкіл, C_1 - C_4 -алкіл- C_3 - C_6 -циклоалкіл, C_3 - C_6 -циклоалкеніл, C_3 - C_6 -галоциклоалкеніл, феніл- C_1 - C_6 -алкіл, гетероцикліл- C_1 - C_6 -алкіл, C_2 - C_6 -алкеніл, C_2 - C_6 -галоалкеніл, C_2 - C_6 -алкініл, C_2 - C_6 -галоалкініл, C_1 - C_6 -алкокси, C_1 - C_6 -галоалкокси, C_1 - C_6 -алкілтію, C_1 - C_6 -галоалкілтію, аміно, C_1 - C_6 -алкіламіно, N,N -ді-(C_1 - C_6)-алкіламіно, гетероцикліл, феніл; причому гетероциклільні й фенільні частини R^3 можуть бути незаміщеними або заміщеними одним або декількома радикалами, вибраними з галогену, гідрокси, нітро, ціано, C_1 - C_4 -алкілу, C_1 - C_4 -галоалкілу, C_1 - C_4 -алкокси- C_1 - C_4 -алкілу, C_3 - C_6 -циклоалкілу, C_2 - C_6 -алкенілу, C_2 - C_6 -алкінілу, C_1 - C_4 -алкокси, C_1 - C_4 -галоалкокси, C_1 - C_4 -алкоксикарбонілу, C_1 - C_4 -алкілтію, C_1 - C_4 -алкілсульфінілу, C_1 - C_4 -алкілсульфонілу, аміно, C_1 - C_4 -алкіламіно, N,N -ді-(C_1 - C_4)-алкіламіно, гетероциклілу, фенілу;

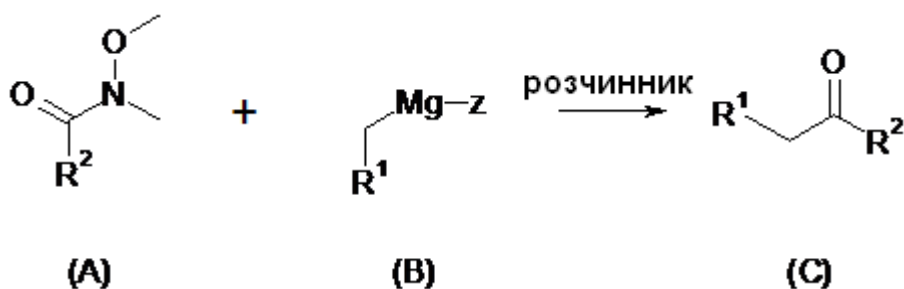
X означає OR^4 ;

R^4 означає водень;

і їх застосовні в сільському господарстві солі; за винятком:

- Ізоксазоло[5,4-*b*]піридин-4-карбонова кислота, 3,6-дициклопропіл;
- Ізоксазоло[5,4-*b*]піридин-4-карбонова кислота, 6-циклопропіл-3-(1,3,5-триметил-1Н-піразол-4-іл);
- Ізоксазоло[5,4-*b*]піридин-4-карбонова кислота, 6-циклопропіл-3-(1,1-диметиламіно);
- 50 - Ізоксазоло[5,4-*b*]піридин-4-карбонова кислота, 6-циклопропіл-3-(4-метоксифеніл);
- Ізоксазоло[5,4-*b*]піридин-4-карбонова кислота, 6-циклопропіл-3-(2,2-диметилпропіл);
- Ізоксазоло[5,4-*b*]піридин-4-карбонова кислота, 6-циклопропіл-3-пропіл;
- Ізоксазоло[5,4-*b*]піридин-4-карбонова кислота, 6-циклопропіл-3-(2-фураніл);
- Ізоксазоло[5,4-*b*]піридин-4-карбонова кислота, 6-циклопропіл-3-феніл;

- Ізоксазоло[5,4-b]піридин-4-карбонова кислота, 6-циклопропіл-3-метил;
- Ізоксазоло[5,4-b]піридин-4-карбонова кислота, 6-циклопропіл-3-(1-метилетил);
- Ізоксазоло[5,4-b]піридин-4-карбонова кислота, 3,6-диметил;
- Ізоксазоло[5,4-b]піридин-4-карбонова кислота, 6-метил-3-пропіл;
- 5 - Ізоксазоло[5,4-b]піридин-4-карбонова кислота, 6-метил-3-(1-метилетил);
- Ізоксазоло[5,4-b]піридин-4-карбонова кислота, 6-метил-3-(1,1-диметиламіно);
- Ізоксазоло[5,4-b]піридин-4-карбонова кислота, 6-метил-3-(2,2-диметилпропіл);
- Ізоксазоло[5,4-b]піридин-4-карбонова кислота, 6-метил-3-циклопропіл;
- Ізоксазоло[5,4-b]піридин-4-карбонова кислота, 6-метил-3-феніл;
- 10 - Ізоксазоло[5,4-b]піридин-4-карбонова кислота, 6-метил-3-(4-метилфеніл);
- Ізоксазоло[5,4-b]піридин-4-карбонова кислота, 6-метил-3-(3-метоксифеніл);
- Ізоксазоло[5,4-b]піридин-4-карбонова кислота, 6-метил-3-(4-метоксифеніл);
- Ізоксазоло[5,4-b]піридин-4-карбонова кислота, 6-метил-3-(4-фторфеніл);
- Ізоксазоло[5,4-b]піридин-4-карбонова кислота, 6-метил-3-(3,4-дихлорфеніл);
- 15 - Ізоксазоло[5,4-b]піридин-4-карбонова кислота, 6-метил-3-(2-фураніл);
- Ізоксазоло[5,4-b]піридин-4-карбонова кислота, 6-метил-3-(1,3,5-триметил-1Н-піразол-4-іл);
- Ізоксазоло[5,4-b]піридин-4-карбонова кислота, 6-метил-3-(1-етил-5-метил-1Н-піразол-4-іл);
- Ізоксазоло[5,4-b]піридин-4-карбонова кислота, 6-етил-3-метил;
- Ізоксазоло[5,4-b]піридин-4-карбонова кислота, 6-етил-3-пропіл;
- 20 - Ізоксазоло[5,4-b]піридин-4-карбонова кислота, 6-етил-3-(1-метилетил);
- Ізоксазоло[5,4-b]піридин-4-карбонова кислота, 6-етил-3-(2,2-диметилпропіл);
- Ізоксазоло[5,4-b]піридин-4-карбонова кислота, 6-етил-3-циклопропіл;
- Ізоксазоло[5,4-b]піридин-4-карбонова кислота, 6-етил-3-(1,3,5-триметил-1Н-піразол-4-іл);
- Ізоксазоло[5,4-b]піридин-4-карбонова кислота, 6-(1-метилетил)-3-метил;
- 25 - Ізоксазоло[5,4-b]піридин-4-карбонова кислота, 6-(1-метилетил)-3-пропіл;
- Ізоксазоло[5,4-b]піридин-4-карбонова кислота, 3,6-бис(1-метилетил);
- Ізоксазоло[5,4-b]піридин-4-карбонова кислота, 6-(1-метилетил)-3-(1,1-диметиламіно);
- Ізоксазоло[5,4-b]піридин-4-карбонова кислота, 6-(1-метилетил)-3-(2,2-диметилпропіл);
- Ізоксазоло[5,4-b]піридин-4-карбонова кислота, 6-(1-метилетил)-3-циклопропіл;
- 30 - Ізоксазоло[5,4-b]піридин-4-карбонова кислота, 6-(1-метилетил)-3-феніл;
- Ізоксазоло[5,4-b]піридин-4-карбонова кислота, 6-(1-метилетил)-3-(3-метоксифеніл);
- Ізоксазоло[5,4-b]піридин-4-карбонова кислота, 6-(1-метилетил)-3-(2-фураніл);
- Ізоксазоло[5,4-b]піридин-4-карбонова кислота, 5-хлор-6-циклопропіл-3-метил;
- Ізоксазоло[5,4-b]піридин-4-карбонова кислота, 5-хлор-3,5-диметил;
- 35 Ізоксазоло[5,4-b]піридини формули I згідно з винаходом можуть бути одержані стандартними способами органічної хімії, наприклад, наступними способами:



- 40 Сполука формули (C), де R¹ означає C₁-C₆-алкіл, C₁-C₆-галоалкіл, C₃-C₆-циклоалкіл, C₃-C₆-галоциклоалкіл, C₂-C₆-алкеніл, C₂-C₆-алкініл або феніл-C₁-C₆-алкіл, може бути одержана шляхом додавання сполуки формули (B), де Z означає галоген, в інертному органічному розчиннику при температурі від -100 °C до 30 °C, переважно при температурі від -80 °C до 0 °C, найбільш переважно при -78 °C, до сполуки формули (A) під атмосферою інертного газу такого
- 45 як аргон або азот. Реакційну суміш обробляють звичайним способом, наприклад, змішуванням з водою, розділенням фаз, екстракцією і, при необхідності, хроматографічним очищенням неочищеного продукту, переважно екстракцією.

- Придатними розчинниками є аліфатичні вуглеводні, такі як пентан, гексан, циклогексан і суміші C₅-C₈-алканів, ароматичні вуглеводні, такі як толуол, о-, m- і p-ксилол, галогеновані вуглеводні, такі як дихлорметан, 1,2-дихлоретан, хлороформ і хлорбензол, прості ефіри, такі як діетиловий ефір, діізопропіловий ефір, трет.-бутил-метиловий ефір, діоксан, анізол і
- 50

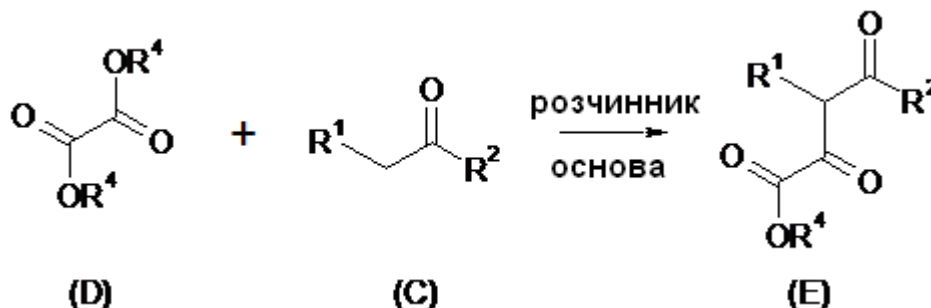
тетрагідрофуран, нітрили, такі як ацетонітрил і пропіонітрил, а також диметилсульфоксид, диметилформамід і N,N-диметилацетамід або N-метилпіролідон.

Особлива перевага надається тетрагідрофурану і діетиловому ефіру. Також можливо використовувати суміші зазначених вище розчинників.

5 Сполуки формули (A) є відомими з літературних джерел [Duncia, John V et al. Bioorganic & Medicinal Chemistry Letters 2008, 18(2), 576-585, і Gao, S. et al. Journal of the American Chemical Society 2010, 132(1), 371-383] або вони можуть бути одержані згідно з процитованими літературними джерелами і/або є комерційно доступними.

Сполуки формули (B) є комерційно доступними.

10 Сполука формули (C), де R² означає 1-фторциклопропіл і R¹ означає водень є відомою з літературних джерел [DE 4206917].



15 Сполука формули (E), де R⁴ означає C₁-C₆-алкіл і R¹ означає водень, C₁-C₆-алкіл, C₁-C₆-галоалкіл, C₃-C₆-циклоалкіл, C₃-C₆-галоциклоалкіл, C₂-C₆-алкеніл, C₂-C₆-алкініл або фенол-C₁-C₆-алкіл може бути одержана обробкою суміші сполуки (D) і (C) з придатною основою. Реакцію проводять в інертному органічному розчиннику при температурі від -100 °C до 100 °C, переважно при температурі від 0 °C до 80 °C. Реакційну суміш обробляють звичайним способом, наприклад, змішуванням з водою, розділенням фаз, екстракцією і, при необхідності, хроматографічним очищенням неочищеного продукту.

20 Придатними основами, загалом, є неорганічні сполуки, такі як гідроксиди лужних і лужноземельних металів, такі як гідроксид літію, гідроксид натрію, гідроксид калію і гідроксид кальцію, гідриди лужних і лужноземельних металів, такі як гідрид літію, гідрид натрію, гідрид калію і гідрид кальцію, карбонати лужних і лужноземельних металів, такі як карбонат літію, карбонат калію і карбонат кальцію, а також гідрокарбонати лужних металів, такі як гідрокарбонат натрію, алкоксиди лужних і лужноземельних металів, такі метилат натрію, етилат натрію, етилат калію, трет-бутилат калію, трет-пентоксид і диметоксимагній, і крім того, органічні основи, такі як третинні аміни, такі як триметиламін, триетиламін, діізопропілетиламін і N-метилпіперидин, піридини, заміщені піридини, такі як колідин, лутидин, N-метилморфолін і 4-диметиламінопіридин, а також біциклічні аміни.

Особлива перевага надається метилату натрію й етилату натрію.

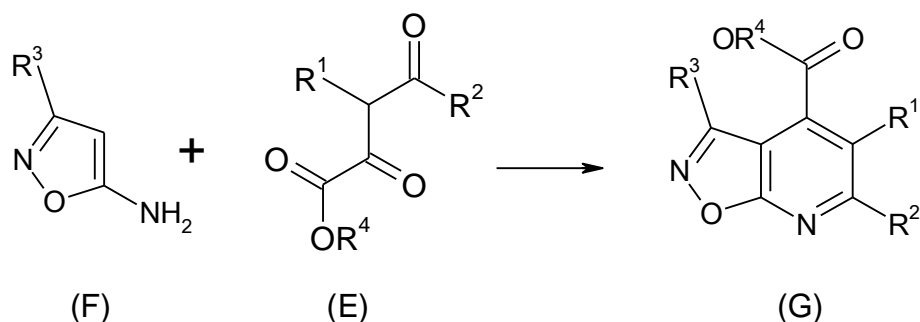
Основи, загалом, застосовують в еквімолярних кількостях або в надлишку.

35 Придатними розчинниками є прості ефіри, такі як діетиловий ефір, діізопропіловий ефір, трет.-бутил метиловий ефір, діоксан, анізол і тетрагідрофуран, нітрили, такі як ацетонітрил і пропіонітрил, спирти, такі як метанол, етанол, n-пропанол, ізопропанол, n-бутанол і трет.-бутанол, а також диметилсульфоксид, диметилформамід і N,N-диметилацетамід або N-метилпіролідон.

40 Особлива перевага надається метанолу або етанолу. Також можливо застосовувати суміші зазначених вище розчинників.

Придатні способи, необхідні для одержання сполуки формули (E), є відомими з літературних джерел [Breckner, L. et al., New J. Chem., 1999, 23, 437-446]. Субстрати, необхідні для одержання сполуки формули (E), є комерційно доступними.

45 Сполука формули (E) де R¹ означає галоген може бути одержана згідно з методами, відомими з літературних джерел [Cao, L. et al. Synlett 2009, 9, 1445-1448; Still, I. W. J. et al. Journal of Organic Chemistry 1981, 46(24), 4911-14 і Banks, R. E. et al. Journal of the Chemical Society, Chemical Communications 1994, 3, 343-344].



Сполука формули (G) може бути одержана змішуванням сполуки формули (E) і сполуки формули (F) в придатному розчиннику при температурі між 65 °C і 120 °C, найбільш переважно при 118 °C. Після завершення реакції реакційну суміш виливають на лід/воду. Утворену тверду речовину збирають фільтрацією й висушують під високим вакуумом.

Придатними розчинниками є

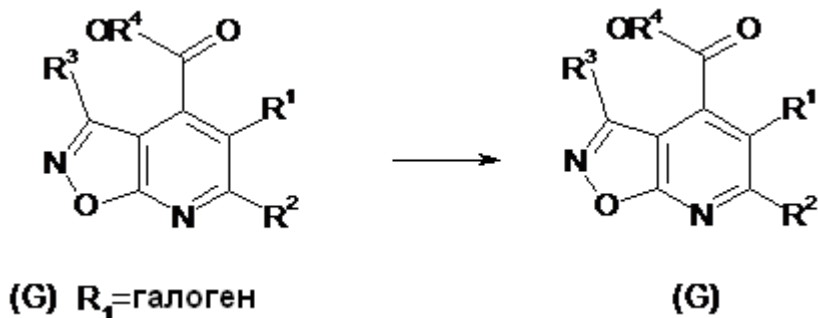
спирти, такі як метанол, етанол, n-пропанол, ізопропанол, n-бутанол і трет.-бутанол, вода, карбонові кислоти, такі як мурашина кислота, льодяна оцтова кислота, а також диметилсульфоксид, диметилформамід і N,N-диметилацетамід або N-метилпіролідон.

Особлива перевага надається льодяній оцтовій кислоті.

Також можливо використовувати суміші зазначених вище розчинників.

Подібні методи описані, наприклад, в Petrosyan, V. A. et al. Russ.Chem.Bull., Int.Ed., 2007, 56, 2186-2188.

Придатні способи, необхідні для одержання сполуки формули (F) є відомими з літературних джерел [Scott, K. R. European Journal of Medicinal Chemistry 2002, 37, 635-648, Mitsuhashi, K. Journal of Heterocyclic Chemistry, 1986, 23(5), 1535-8], EP 0220947, WO 2008034008, Dines, M. B. Tetrahedron Letters 1969, 54, 4817-4819; Koichi, M. Nitriles. IV. Synthesis of isoxazoles and pyrazoles from some three-carbon nitriles, Takeda Kenkyushoho 1971, 30(3), 475-92. Деякі зі сполук формули (F) є комерційно доступними.



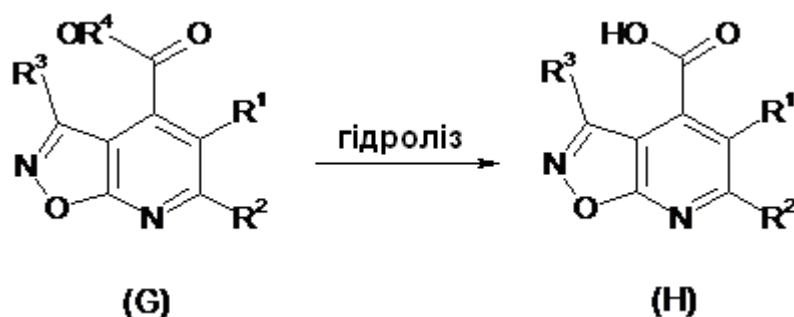
Сполука формули (G) де R^1 означає гідроксил, C_1 - C_6 -алкокси- C_1 - C_6 -алкіл, C_1 - C_6 -алкокси, C_1 - C_6 -галоалкокси може бути одержана зі сполуки формули (G) де R^1 означає галоген згідно з придатними способами, відомими з літературних джерел, наприклад: Dejardin, J. V. et. al. Bulletin de la Societe Chimique de France 1976, 3-4, Pt. 2, 530-532, Ouyang, X. et. al. Bioorganic & Medicinal Chemistry Letters 2005, 15(23), 5154-5159 і Magee, T. V. et. al. Journal of Medicinal Chemistry 2009, 52(23), 7446-7457.

Сполука формули (G) де R^1 означає водень і R^3 означає галоген може бути одержана змішуванням сполуки формули (G) де R^1 означає водень і R^3 означає OH з гідрогалогенідом піридину, кислотою (найбільш переважно H_3PO_4) і оксигалогенідом фосфору і її перемішують при температурі між 50 °C і 120 °C, найбільш переважно при 90 °C протягом 1-5 год. Надлишок оксигалогеніду фосфору випаровують під високим вакуумом. Реакційну суміш обробляють звичайним способом, наприклад, за допомогою додавання придатного розчинника і водного розчину гідрокарбонату лужного металу, розділенням фаз, екстракцією і, при необхідності, хроматографічним очищенням неочищеного продукту.

Придатними розчинниками є етилацетат, дихлорметан, діетиловий ефір, хлороформ, трет.-бутилметиловий ефір, діізопропіловий ефір. Придатними гідрокарбонатами лужних металів є гідрокарбонат натрію, гідрокарбонат калію, гідрокарбонат кальцію.

Сполука формули (G) де R^1 означає водень і R^3 означає C_1 - C_6 -алкокси може бути одержана шляхом додавання C_1 - C_6 -алкілового спирту і сполуки формули (G) де R^1 означає водень і R^3 означає OH до попередньо приготовленого перемішаного розчину ді- C_1 - C_6 -алкіл азодикарбоксилату й тріарилфосфіну (найбільш переважно трифенілфосфіну) в придатном розчиннику (переважно тетрагідрофурані) при температурі між -20°C і 25°C , найбільш переважно при 0°C . Реакцію проводять при температурі між -20°C до 100°C , переважно при температурі між 40°C і 80°C . Реакційну суміш обробляють звичайним способом, наприклад, шляхом видалення розчинника під вакуумом і хроматографічним очищенням неочищеного продукту.

Придатними розчинниками є прості ефіри, такі як діетиловий ефір, діізопропіловий ефір, трет.-бутил-метиловий ефір, діоксан, анізол і тетрагідрофуран. Особлива перевага надається тетрагідрофурану й діетиловому ефіру. Також можливо використовувати суміші зазначених вище розчинників.



Сполука формули (H) може бути одержана зі сполуки формули (G) шляхом гідролізу в присутності придатної кислоти або основного каталізатора в придатному розчиннику при температурах між 0°C і 80°C , найбільш переважно при 25°C , при звичайному нагріванні або при мікрохвильовому випромінненні [див., наприклад, Carrigan, C. N. J. Med. Chem. 2002, 45, 2260-2276 і Ghosh, P. Journal of Teaching and Research in Chemistry 2008, 15(2), 54-57].

Придатними кислотними каталізаторами є:

неорганічні кислоти, такі як фтористоводнева кислота, соляна кислота, бромисто-воднева кислота, перхлорна кислота, сірчана кислота.

Особлива перевага надається соляній кислоті й сірчаній кислоті.

Загалом, кислоти використовують в каталітичних кількостях, тим не менш, також вони можуть використовуватися в еквімолярних кількостях або в надлишку.

Придатними основними каталізаторами є:

Гідроксиди лужних і лужноземельних металів, такі як гідроксид літію, гідроксид натрію, гідроксид калію і гідроксид кальцію.

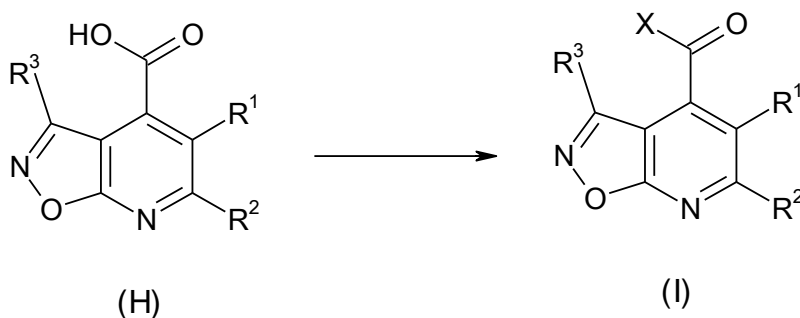
Особлива перевага надається гідроксидам металів, таким як гідроксид натрію.

Загалом, основи застосовують в каталітичних кількостях, тим не менш, також вони можуть використовуватися в еквімолярних кількостях або в надлишку.

Придатними розчинниками є прості ефіри, такі як діетиловий ефір, діізопропіловий ефір, трет.-бутилметиловий ефір, діоксан, анізол і тетрагідрофуран, вода, спирти, такі як метанол, етанол, n-пропанол, ізопропанол, n-бутанол і трет.-бутанол, а також диметилсульфоксид.

Особлива перевага надається тетрагідрофурану.

Також можливо використовувати суміші зазначених вище розчинників.



Сполука формули (H) може бути етерифікована, тіоетерифікована, перетворена в амід або галогенангідрид, переважно хлорангідрид, сполуки формули (I), де X означає OR^4 (див., наприклад, Arnab, P. et. al. *Angewandte Chemie, International Edition* 2010, 49(8), 1492-1495), SR^5 (див., наприклад, Silvestri, M. A. et. al. *Journal of Medicinal Chemistry* 2004, 47(12), 3149-3162), NR^6R^7 (див., наприклад, Kuhn, B. et. al. *Journal of Medicinal Chemistry* 2010, 53(6), 2601-2611) при стандартних умовах.

Ізоксазоло[5,4-b]піридини формули I є придатними як гербіциди. Вони є придатними як такі або як відповідним чином приготовлена композиція (гербіцидна композиція). Як використовуються в даній заявці, поняття "приготовлена композиція" і "гербіцидна композиція" є синонімами.

Гербіцидні композиції, що містять ізоксазоло[5,4-b]піридини формули I, дуже ефективно регулюють рослинність на несільськогосподарських площах, зокрема при високих нормах застосування. Вони діють проти широколистяних бур'янів і трав'янистих бур'янів в зернових культурах, таких як пшениця, рис, кукурудза, соя і бавовник, не заподіюючи будь-якої суттєвої шкоди зерновим культурам. Головним чином, цей ефект спостерігається при низьких нормах витрати.

Залежно від відповідного способу застосування, ізоксазоло[5,4-b]піридини формули I або композиції, що їх містять додатково можуть використовуватися в цілому ряді інших культурних рослин для знищення небажано рослинності. Придатними є, наприклад, наступні культури:

Allium cepa, *Ananas comosus*, *Arachis hypogaea*, *Asparagus officinalis*, *Avena sativa*, *Beta vulgaris* spec. altissima, *Beta vulgaris* spec. rapa, *Brassica napus* var. napus, *Brassica napus* var. napobrassica, *Brassica rapa* var. silvestris, *Brassica oleracea*, *Brassica nigra*, *Camellia sinensis*, *Carthamus tinctorius*, *Carya illinoensis*, *Citrus limon*, *Citrus sinensis*, *Coffea arabica* (*Coffea canephora*, *Coffea liberica*), *Cucumis sativus*, *Cynodon dactylon*, *Daucus carota*, *Elaeis guineensis*, *Fragaria vesca*, *Glycine max*, *Gossypium hirsutum*, (*Gossypium arboreum*, *Gossypium herbaceum*, *Gossypium vitifolium*), *Helianthus annuus*, *Hevea brasiliensis*, *Hordeum vulgare*, *Humulus lupulus*, *Ipomoea batatas*, *Juglans regia*, *Lens culinaris*, *Linum usitatissimum*, *Lycopersicon lycopersicum*, *Malus spec.*, *Manihot esculenta*, *Medicago sativa*, *Musa spec.*, *Nicotiana tabacum* (*N.rustica*), *Olea europaea*, *Oryza sativa*, *Phaseolus lunatus*, *Phaseolus vulgaris*, *Picea abies*, *Pinus spec.*, *Pistacia vera*, *Pisum sativum*, *Prunus avium*, *Prunus persica*, *Pyrus communis*, *Prunus armeniaca*, *Prunus cerasus*, *Prunus dulcis* і *Prunus domestica*, *Ribes sylvestre*, *Ricinus communis*, *Saccharum officinarum*, *Secale cereale*, *Sinapis alba*, *Solanum tuberosum*, *Sorghum bicolor* (s. vulgare), *Theobroma cacao*, *Trifolium pratense*, *Triticum aestivum*, *Triticale*, *Triticum durum*, *Vicia faba*, *Vitis vinifera* і *Zea mays*.

Придатними зерновими культурами є наступні: *Arachis hypogaea*, *Beta vulgaris* spec. altissima, *Brassica napus* var. napus, *Brassica oleracea*, *Citrus limon*, *Citrus sinensis*, *Coffea arabica* (*Coffea canephora*, *Coffea liberica*), *Cynodon dactylon*, *Glycine max*, *Gossypium hirsutum*, (*Gossypium arboreum*, *Gossypium herbaceum*, *Gossypium vitifolium*), *Helianthus annuus*, *Hordeum vulgare*, *Juglans regia*, *Lens culinaris*, *Linum usitatissimum*, *Lycopersicon lycopersicum*, *Malus spec.*, *Medicago sativa*, *Nicotiana tabacum* (*N.rustica*), *Olea europaea*, *Oryza sativa*, *Phaseolus lunatus*, *Phaseolus vulgaris*, *Pistacia vera*, *Pisum sativum*, *Prunus dulcis*, *Saccharum officinarum*, *Secale cereale*, *Solanum tuberosum*, *Sorghum bicolor* (s. vulgare), *Triticale*, *Triticum aestivum*, *Triticum durum*, *Vicia faba*, *Vitis vinifera* і *Zea mays*.

Ізоксазоло[5,4-b]піридини формули I згідно з винаходом також можуть використовуватися в генетично модифікованих рослинах. Поняття "генетично модифіковані рослини" слід розуміти як рослини, генетичний матеріал яких був змінений таким чином з використанням технологій рекомбінантної ДНК, який в природних умовах не може бути одержаний швидко шляхом схрещування, мутацій або природної рекомбінації. Типово, один або декілька генів інтегруються в генетичний матеріал генетично модифікованої рослини для того щоб покращити деякі властивості рослини. Подібні генетичні зміни також включають посттрансляційні модифікації білка(ів), олігопептидів або поліпептидів, наприклад, за допомогою глікозилування або приєднання полімерів, таких як пренильовані, ацетиловані або фарнезилувані частини або ПЕГ частини.

Рослини, які були модифіковані завдяки вирощуванню, мутагенезу або генній інженерії, наприклад, набули стійкості до застосування певних класів гербіцидів, таких як ауксинові гербіциди, такі як дикамба або 2,4-D, відбілювальні гербіциди, такі як інгібітори гідроксифенілпіруват-діоксигенази (HPPD) або інгібітори фітоендесатурази (PDS), інгібітори ацетолактат-синтази (ALS), такі як, наприклад, сульфонілсечовини, інгібітори енолпірувілшкімат-3-фосфат-синтази (EPSP), такі як, наприклад, гліфосат, інгібітори глутамінсинтетази (GS), такі як, наприклад, глюфосинат, інгібітори біосинтезу ліпідів, такі як,

наприклад, інгібітори ацетил-CoA-карбоксилази (ACCase), або оксинілові гербіциди (наприклад, бромоксиніл або іюксиніл) в результаті звичайних методів вирощування або генної інженерії; далі були одержані культурні рослини, які завдяки різним методам генної інженерії є стійкими до багатьох класів гербіцидів, наприклад, стійкими до гліфосату і глюфосинату, або до гліфосату і до гербіциду іншого класу, таким як ALS-інгібітори, HPPD-інгібітори, ауксинові гербіциди і ACCase-інгібітори. Ці технології стійкості до гербіцидів описані, наприклад, в Pest Management Science 61, 2005, 246; 61, 2005, 258; 61, 2005, 277; 61, 2005, 269; 61, 2005, 286; 64, 2008, 326; 64, 2008, 332; Weed Science 57, 2009, 108; Australian Journal of Agricultural Research 58, 2007, 708; Science 316, 2007, 1185; і в процитованих там посиланнях. Завдяки звичайним методам вирощування (мутагенезу) деякі культурні рослини набули стійкості до гербіцидів, наприклад, ріпак Clearfield® (Canola, BASF SE, Німеччина), який має стійкість до імідазолінонів, наприклад, імазамоксу або соняшник ExpressSun® (DuPont, США), який має стійкість до сульфонілсечовин, як, наприклад, трибенурону. За допомогою методів генної інженерії були культивовані культурні рослини, такі як соєві боби, бавовник, кукурудза, буряк і ріпак, які є стійкими до гліфосату або глюфосинату, деякі з них знаходяться в розробці або є в продажі під торговими найменуваннями RoudupReady® (стійкі до гліфосату, Monsanto, США), Cultivance® (стійкі до імідазолінону, BASF SE, Німеччина) і Liberty Link® (стійкі до глюфосинату, Bayer CropScience, Німеччина).

Далі також включені рослини, які з використанням технологій рекомбінантної ДНК здатні синтезувати один або декілька інсектицидних білків, особливо відомих з роду бактерій *Bacillus*, зокрема *Bacillus thuringiensis*, такі як δ -ендотоксини, наприклад, CryIA(b), CryIA(c), CryIF, CryIF(a2), CryIIA(b), CryIIIA, CryIIIB(b1) або Cry9c; вегетативні інсектицидні білки (VIP), наприклад, VIP1, VIP2, VIP3 або VIP3A; інсектицидні білки колонізованих бактеріями нематод, наприклад, види *Photorhabdus* або види *Xenorhabdus*; токсини, що продукуються тваринами, такі як скорпіонові, павукові, осині токсини, або інші притаманні кохам нейротоксини; токсини, що продукуються грибами, такі як токсини стрептомицетів; рослинні лектини, такі як горохові або ячмінні лектини; аглютиніни; інгібітори протеїнази, такі як інгібітори трипсину, інгібітори серинпротеази, пататин, цистатин або папінові інгібітори; рибосом-інактивуючі білки (РІБ), такі як рицин, РІБ кукурудзи, абрин, луфін, сапорин або бріюдин; ферменти метаболізму стероїдів, такі як 3-гідроксистероїд-оксидаза, екдистероїд-IDP-глікозил-трансфераза, холестерінооксидаза, інгібітори екдизону або HMG-CoA-редуктаза; блокатори іонних каналів, такі як інгібітори натрієвих або кальцієвих каналів; естераза ювенільного гормону; рецептори діуретичного гормону (гелікокінінові рецептори); стилбенсинтаза, бібензилсинтаза, хітиназа і глюканаза. В контексті даного винаходу ці інсектицидні білки або токсини слід явно розуміти також як претоксини, гібридні білки, укорочені або по-іншому модифіковані білки. Гібридні білки відрізняються новою комбінацією областей білків (див., наприклад, WO 02/015701). Інші приклади подібних токсинів або генетично змінених рослин, здатних синтезувати такі токсини, розкриті в EP-A 374 753, WO 93/007278, WO 95/34656, EP-A 427 529, EP-A 451 878, WO 03/18810 і WO 03/52073. Методи одержання таких генетично модифікованих рослин звичайно відомі спеціалісту в даній галузі техніки і описані, наприклад, в зазначених вище публікаціях. Велика кількість зазначених раніше токсинів надають рослинам, які їх виробляють, стійкість до шкідників з усіх таксономічних класів артроподів, зокрема, проти жуків (Coeloptera), двокрилих комах (Diptera), і лускокрилих (Lepidoptera) і нематод (Nematoda). Ці інсектицидні білки, що містяться в генетично модифікованих рослинах, надають рослинам, які їх виробляють, стійкість до тваринних шкідників з усіх таксономічних класів артроподів, зокрема, проти жуків (Coeloptera), двокрилих комах (Diptera), і лускокрилих (Lepidoptera) і нематод (Nematoda). Генетично модифіковані рослини, здатні синтезувати один або декілька інсектицидних білків описані, наприклад, в зазначених вище публікаціях, і деякі з них є комерційно доступними такі як YieldGard® (сорт кукурудзи, які виробляють токсин Cry1Ab), YieldGard® Plus (сорт кукурудзи, які виробляють токсини Cry1Ab і Cry3Bb1), Starlink® (сорт кукурудзи, які виробляють токсин Cry9c), Herculex® RW (сорт кукурудзи, які виробляють токсини Cry34Ab1, Cry35Ab1 і фермент фосфінотрицин-N-ацетилтрансфераза [PAT]); NuCOTN® 33B (сорт бавовнику, які виробляють токсин Cry1Ac), Bollgard® I (сорт бавовнику, які виробляють токсин Cry1Ac), Bollgard® II (сорт бавовнику, які виробляють токсини Cry1Ac і Cry2Ab2); VIPCOT® (сорт бавовнику, які виробляють VIP токсини); NewLeaf® (сорт картоплі, які виробляють токсин Cry3A); Bt-Xtra®, NatureGard®, KnockOut®, BiteGard®, Protecta®, Bt11 (наприклад, Agrisure® CB) і Bt176 від Syngenta Seeds SAS, Франція, (сорт кукурудзи, які виробляють токсин Cry1Ab і PAT фермент), MIR604 від Syngenta Seeds SAS, Франція (сорт кукурудзи, які виробляють модифіковану версію токсину Cry3A, див. WO 03/018810), MON 863 від Monsanto Europe S.A., Бельгія (сорт кукурудзи, які виробляють токсин Cry3Bb1), IPC 531 від Monsanto Europe S.A., Бельгія (сорт

бавовнику, які виробляють модифіковану версію токсину Cry1Ac) і 1507 від Pioneer Overseas Corporation, Бельгія (сорт кукурудзи, які виробляють токсин Cry1F і PAT фермент).

Далі також включені рослини, які з використанням технологій рекомбінантної ДНК здатні синтезувати один або декілька білків, які викликають підвищену стійкість або опірність до бактеріальних, вірусних або грибкових патогенів. Прикладами подібних білків є так звані "патогенез-залежні білки" (PR білки, див., наприклад, EP-A 392 225), резистентні гени до захворювань рослин (наприклад, сорт картоплі, які виражають резистентність генів, діючих проти *Phytophthora infestans* виведені з мексиканської дикої картоплі *Solanum bulbocastanum*) або T4-лізозим (наприклад, сорт картоплі, які здатні синтезувати ці білки з підвищеною стійкістю до бактерій, таких як *Erwinia amylovora*). Методи одержання таких генетично модифікованих рослин звичайно відомі спеціалісту в даній галузі техніки і описані, наприклад, в зазначених вище публікаціях.

Далі також включені рослини, які з використанням технологій рекомбінантної ДНК здатні синтезувати один або декілька білків для підвищення продуктивності (наприклад, біомаси, врожаю зерна, вмісту крохмалю, олії або білка), стійкості до посухи, засоленості або інших обмежувальних факторів навколишнього середовища або опірності таких рослин відносно шкідників і грибкових, бактеріальних і вірусних патогенів.

Далі також включені рослини, які завдяки технологіям рекомбінантної ДНК містять змінену кількість речовин, що містяться або нових речовин, особливо для покращення харчування людей і тварин, наприклад, олійні зернові культури, які виробляють оздоровчі довголанцюгові омега-3-жирні кислоти або мононенасичені омега-9-жирні кислоти (наприклад, Nexera® ріпак, DOW Agro Sciences, Канада).

Далі також включені рослини, які завдяки технологіям рекомбінантної ДНК містять змінену кількість речовин, що містяться або нових речовин, особливо, для покращення продукування сировини, наприклад, картопля, яка виробляє підвищені кількості амілопектину (наприклад, картопля Amflora®, BASF SE, Німеччина).

Більш того, було винайдено, що ізоксазол[5,4-*b*]піридини формули I також є придатними для дефоліації і/або десикації частин рослин, для чого є придатними культурні рослини, такі як бавовник, картопля, ріпак олійний, сояшник, соєві боби або боби польові, зокрема бавовник. У зв'язку з цим були створені композиції для десикації і/або дефоліації рослин, способи одержання цих композицій і методи десикації і/або дефоліації рослин з використанням ізоксазол[5,4-*b*]піридинів формули I.

Як десиканти ізоксазол[5,4-*b*]піридини формули I зокрема є придатними для висушування надземних частин культурних рослин, таких як картопля, рапс, сояшник і соєві боби, а також зернових культур. Це дає можливість здійснювати повністю механічний збір врожаю цих важливих культур.

До того ж економічний інтерес представляє полегшення збирання врожаю, яке уможливлюється за допомогою сконцентрованого у часі опадання або зниження зчеплення з деревом у citrusових плодів, оливках й інших видів і сортів насінневих, кісточкових плодів і горіхоплідних. Той же самий механізм, тобто, сприяння утворенню розділової тканини між плодовою або листяною і стебловою частиною рослин є також важливим для добре контрольованого видалення листя технічних культур, зокрема бавовнику.

Крім того, скорочення часового інтервалу, за який дозрівають окремі рослини бавовнику, приводить до підвищеної якості волокна після збирання врожаю.

Ізоксазол[5,4-*b*]піридини формули I, або гербіцидні композиції, що містять ізоксазол[5,4-*b*]піридини формули I, можуть застосовуватися, наприклад, у формі водних розчинів, призначених для безпосереднього обприскування, порошоків, суспензій, також висококонцентрованих водяних, олійних або інших суспензій або дисперсій, емульсій, олійних дисперсій, паст, тонких порошоків, препаратів для опудрювання, або гранулятів шляхом обприскування, дрібнокрапельного обприскування, обпилення, розпорошування, поливу або обробки посівного матеріалу або змішування з посівним матеріалом. Форми застосування залежать від цілей використання; в будь-якому випадку повинний бути забезпечений максимально тонкий і рівномірний розподіл діючих речовин відповідно до винаходу.

Гербіцидні композиції містять гербіцидно ефективну кількість щонайменше одного ізоксазол[5,4-*b*]піридину формули I і допоміжні засоби, звичайні для приготування засобів захисту рослин.

Прикладами допоміжних засобів, звичайних для приготування засобів захисту рослин, є інертні допоміжні засоби, тверді носії, поверхнево-активні речовини (такі як диспергатори, захисні колоїди, емульгатори, змочувальні агенти і активатори адгезії), органічні й неорганічні

загусники, бактерициди, антифризи, антиспінювачі при необхідності барвники і клеї для композицій для посівного матеріалу.

Спеціаліст в даній галузі техніки добре знає рецептуру для таких складів.

Прикладами згущувачів (тобто сполук, які надають композиції модифікованої плинності, тобто високу в'язкість в стані спокою і низьку в'язкість в рухомому стані) є полісахариди, такі як ксантанова смола (Kelzan® from Kelco), Rhodopol® 23 (Rhone Poulenc) або Veegum® (від R.T. Vanderbilt), а також органічні і неорганічні шаруваті мінерали, такі як Attaclay® (від Engelhardt).

Прикладами антиспінювачів є силіконові емульсії (такі як, наприклад, Silikon® SRE, від Wacker або Rhodorsil® від Rhodia), довголанцюгові спирти, кислоти жирного ряду, солі кислот жирного ряду, фторорганічні сполуки і їх суміші.

Бактерициди можуть додаватися стабілізації водних гербіцидних складів. Прикладами бактерицидів є бактерициди на основі дихлорофену й хеміформалю бензилового спирту (Proxel® від ICI або Acticide® RS від Thor Chemie і Kathon® MK від Rohm & Haas), а також похідні ізотіазолінону, такі як алкілізотіазолінони і бензізотіазолінони (Acticide® MBS від Thor Chemie).

Прикладами антифризів є етиленгліколь, пропіленгліколь, сечовина або гліцерин.

Придатними барвниками є як малорозчинні в воді пігменти, так і розчинні в воді барвники. Як приклади, слід перерахувати відомі під назвами Rhodamin B, C. I. пігмент червоний 112 і C. I. сольвент червоний 1, пігмент синій 15:4, пігмент синій 15:3, пігмент синій 15:2, пігмент синій 15:1, пігмент синій 80, пігмент жовтий 1, пігмент жовтий 13, пігмент червоний 48:2, пігмент червоний 48:1, пігмент червоний 57:1, пігмент червоний 53:1, пігмент оранжевий 43, пігмент оранжевий 34, пігмент оранжевий 5, пігмент зелений 36, пігмент зелений 7, пігмент білий 6, пігмент коричневий 25, основний фіолетовий 10, основний фіолетовий 49, кислотний червоний 51, кислотний червоний 52, кислотний червоний 14, кислотний синій 9, кислотний жовтий 23, основний червоний 10, основний червоний 108.

Прикладами клеїв є полівінілпіролідон, полівінілацетат, полівініловий спирт і тилез.

Придатними інертними допоміжними речовинами є, наприклад, наступні:

фракції мінеральних олій від середньої до високої точок кипіння, такі, як гас і дизельна олія, далі кам'яновугільні олії, а також олії рослинного або масла тваринного походження, аліфатичні, циклічні або ароматичні вуглеводні, наприклад, парафіни, тетрагідронафталін, алкіловані нафталіни або їх похідні, алкіловані бензоли і їх похідні, спирти, такі як метанол, етанол, пропанол, бутанол, циклогексанол, кетони, такі як циклогексанон або сильно полярні розчинники, наприклад, аміни, такі як N-метилпіролідон або вода.

Придатні носії включають рідкі й тверді носії.

Рідкі носії включають, наприклад, безводні розчинники, такі як циклічні і ароматичні вуглеводні, наприклад, парафіни, тетрагідронафталін, алкіловані нафталіни або їх похідні, алкіловані бензоли і їх похідні, спирти, такі як метанол, етанол, пропанол, бутанол, циклогексанол, кетони, такі як циклогексанон або сильно полярні розчинники, наприклад, аміни, такі як N-метилпіролідон або вода, а також їх суміші.

Тверді носії включають мінеральні землі, такі як діоксиди кремнію, силікагелі, силікати, тальк, каолін, вапняк, вапно, крейда, болюс, льос, глина, доломіт, діатомова земля, сульфат кальцію, сульфат магнію і оксид магнію, розмелені синтетичні матеріали, добрива, такі як сульфат амонію, фосфат амонію, нітрат амонію, сечовини і продукти рослинного походження, такі як борошно зернових культур, борошно деревної кори, деревне борошно і борошно горіхової шкарлупи, целюлозні порошки або інші тверді носії.

Придатними поверхнево-активними речовинами (добавки, змочувальні, адгезійні, диспергувальні або емульгувальні засоби) є лужні, лужноземельні, амонієві солі ароматичних сульфокислот, наприклад, лігнінсульфофосфатів (типи Borresperse, Borregaard), фенолсульфофосфатів, нафталінсульфофосфатів (типи Morwet, Akzo Nobel,) і дибутілнафталінсульфофосфатів (типи Nekal, BASF), також кислот жирного ряду, алкілсульфонати і алкіларилсульфонати, алкілсульфати, сульфати простих лаурилових ефірів і сульфати спиртів жирного ряду, а також солі сульфатованих гекса-, гепта- і октадеканолів, а також гліколевих ефірів спиртів жирного ряду, продукти конденсації сульфонованого нафталіну і його похідних з формальдегідом, продукти конденсації нафталіну або нафталінсульфофосфатів з фенолом і формальдегідом, поліоксиетилен-октилфенольний ефір, етоксильований ізооктилфенол, октилфенол, нонілфенол, алкілфенільний полігліколевий ефір, трибутилфенілполігліколевий ефір, алкіларил-поліефірні спирти, ізотридециловий спирт, конденсати окису етилену спирту жирного ряду, етоксильована рицинова олія, поліоксиетилен-алкіловий ефір або поліоксипропілен-алкіловий ефір, поліглікольєфірний ацетат лаурилових спиртів, складний ефір сорбіту, лігнінсульфітні відпрацьовані луги, а також білки, денатуровані

білки, полісахариди (наприклад, метилцелюлоза), гідрофобно модифіковані крохмалі, полівініловий спирт (типи Mowiol, Clariant), полікарбоксилати (типи Sokalan BASF AG), поліалкоксилати, полівініламін (типи Lupamin, BASF AG), поліетиленімін (типи Lupasol, BASF AG), полівінілпіролідон та його співполімери.

5 Порошки, засоби для розпилення і тонкі порошки можуть бути одержані за допомогою змішування або сумісного розмелу діючих речовин з твердим носієм.

Грануляти, наприклад, покриті грануляти, просочені або гомогенні грануляти, можуть бути одержані за допомогою поєднання діючих речовин з твердим носієм.

10 Водні форми застосування можуть бути приготовлені з емульсійних концентратів, суспензій, паст, змочувальних порошоків або здатних до диспергування у воді гранулятів за допомогою додавання води.

15 Для одержання емульсій, паст або олійних дисперсій ізоксазоло[5,4-b]піридини формули I як такі або розчинені в олії або розчиннику можуть гомогенізуватися в воді за допомогою змочувальних агентів, адгезійних складів, диспергаторів або емульгаторів. Альтернативно можуть бути одержані концентрати, що містять діючу сполуку, змочувальний агент, адгезійний склад, диспергатор або емульгатор і при бажанні розчинника або масла, які є придатними для розведення водою.

20 Концентрації ізоксазоло[5,4-b]піридинів формули I в готових до застосування препаратах (складах) можуть варіюватися в широкому діапазоні. Загалом, склади містять приблизно від 0.001 до 98 мас. %, переважно від 0.01 до 95 мас. % щонайменше однієї діючої речовини. Діючі речовини застосовуються з чистотою від 90 % до 100 %, переважно від 95 % до 100 % (за спектром ЯМР).

25 У складі ізоксазоло[5,4-b]піридинів формули I згідно з даним винаходом діючі речовини, наприклад, ізоксазоло[5,4-b]піридини формули I, знаходяться в суспендованому, емульгованому або розчиненому вигляді. Склад згідно з винаходом може знаходитися у вигляді водних розчинів, порошоків, суспензій, також висококонцентрованих водних, олійних або інших суспензій або дисперсій, водних емульсій, водних мікроемульсій, водних суспензій, олійних дисперсій, паст, тонких порошоків, речовин для опудрювання або гранулятів.

30 Ізоксазоло[5,4-b]піридини формули I згідно з даним винаходом можуть бути приготовлені, наприклад, наступним чином:

1. Продукти для розведення з водою

A Водорозчинні концентрати

35 10 ваг. частин діючої сполуки розчиняють у 90 ваг. частин води або у водорозчинному розчиннику. Альтернативно додають змочувальний агент або інші допоміжні засоби. При розведенні з водою діюча сполука розчиняється. Таким способом одержують композицію з вмістом діючого компонента 10 мас. %.

B Здатні до диспергування концентрати

40 20 ваг. частин діючої сполуки розчиняють у 70 ваг. частин циклогексанону при додаванні 10 ваг. частин диспергатора, наприклад, полівінілпіролідону. При розведенні з водою одержують дисперсію. Вміст діючої сполуки складає 20 мас. %.

C Здатні до емульгування концентрати

45 15 ваг. частин діючої сполуки розчиняють у 75 ваг. частин органічного розчинника (наприклад, алкілароматичні сполуки) при додаванні додецилбензолсульфонату кальцію і етоксилату рицинової олії (по 5 ваг. частин). При розведенні з водою утворюється емульсія. Склад містить 15 мас. % діючої сполуки.

D Емульсії

50 25 ваг. частин діючої сполуки розчиняють у 35 ваг. частин органічного розчинника (наприклад, алкілароматичні сполуки) при додаванні додецилбензолсульфонату кальцію і етоксилату рицинової олії (по 5 ваг. частин). Цю суміш за допомогою емульгувального пристрою (Ultraturax) додають в 30 ваг. частин води і доводять до гомогенної емульсії. При розведенні з водою утворюється емульсія. Склад містить 25 мас. % діючої сполуки.

E Суспензії

55 В кульовому млині з мішалкою подрібнюють до тонкої суспензії діючої сполуки 20 ваг. частин діючої сполуки при додаванні 10 ваг. частин диспергатора і змочувального агента і 70 ваг. частин води або органічного розчинника. При розведенні з водою утворюється стабільна суспензія діючої сполуки. Вміст діючої сполуки в складі складає 20 мас. %.

F Здатні до диспергування у воді і водорозчинні грануляти

60 50 ваг. частин діючої сполуки тонко подрібнюють при додаванні 50 ваг. частин диспергатора і змочувального агента і за допомогою технічних пристроїв (наприклад, екструзійного пристрою, розпилювальної башти, псевдо розрідженого шару) одержують здатні до диспергування у воді

або водорозчинні грануляти. При розведенні з водою утворюється стабільна дисперсія або розчин діючої сполуки. Склад містить 50 мас. % діючої сполуки.

G Здатні до диспергування у воді і водорозчинні порошки

75 ваг. частин діючої сполуки перемелюють в роторно-статорному млині при додаванні 25 ваг. частин диспергатора і змочувального агента, а також силікагелю. При розведенні з водою утворюється стабільна дисперсія або розчин діючої сполуки. Вміст діючої сполуки в складі складає 75 мас. %.

H Гелеві склади

20 ваг. частин діючої сполуки, 10 ваг. частин диспергатора, 1 ваг. частину гелеутворюючої речовини і 70 ваг. частин води або органічного розчинника подрібнюють в кульовому млині до тонкої суспензії. При розведенні з водою утворюється стабільна суспензія з вмістом діючої сполуки 20 мас. %.

2. Продукти для безпосереднього нанесення

I Тонкі порошки

5 ваг. частин діючої сполуки тонко подрібнюють і ретельно перемішують з 95 ваг. частин тонкодисперсного каоліну. Внаслідок чого одержують засіб для обпилення з вмістом діючої сполуки 5 мас. %.

J Грануляти (GR, FG, GG, MG)

0,5 ваг. частини діючої сполуки тонко подрібнюють і поєднують з 99,5 ваг. частинами носіїв. При цьому звичайним способом є екструзія, розпилювальне сушіння або псевдорозріджений шар. Внаслідок чого одержують гранулят для безпосереднього застосування з вмістом діючої сполуки 0,5 мас. %.

K ULV розчини (UL)

10 ваг. частин діючої сполуки розчиняють у 90 ваг. частин органічного розчинника, наприклад, ксилолу. Внаслідок чого одержують продукт для безпосереднього застосування з вмістом діючої сполуки 10 мас. %.

Водні форми застосування можуть бути одержані з емульсійних концентратів, суспензій, паст, змочувальних порошоків або здатних до диспергування у воді гранулятів шляхом додавання води.

Ізоксазоло[5,4-b]піридини формули I або що їх містять гербіцидні композиції можуть застосовуватися шляхом досходової, післясходової обробки або разом з посівним матеріалом культурної рослини. Також існує можливість, гербіцидну композицію або діючі сполуки застосовувати таким чином, що посівний матеріал культурної рослини вноситься попередньо обробленим гербіцидними композиціями або діючими сполуками. Якщо діючі речовини для деяких культурних рослин є менш стійкими, то можуть застосовуватися способи внесення, при яких гербіцидні композиції розпилюють за допомогою розпилювачів таким чином, що листя чутливих культурних рослин по мірі можливості не піддаються ушкодженню, в той час як діючі речовини потрапляють на листя небажаних рослин, які ростуть під ними або на непокриті поверхні ґрунту (метод спрямованого обприскування, метод стрічкового обприскування).

В іншому варіанті здійснення, ізоксазоло[5,4-b]піридини формули I або гербіцидні композиції можуть застосовуватися шляхом обробки посівного матеріалу. Обробка посівного матеріалу охоплює по суті всі відомі спеціалісту в даній галузі технічні способи (обволікання насіння, покриття насіння, обпилення насіння, просочування насіння, покриття насіння плівкою, багат шарове покриття насіння, покриття насіння коринкою, просочування насіння й дражування насіння) на основі ізоксазоло[5,4-b]піридинів формули I згідно з винаходом або приготування з них композицій. При цьому гербіцидні композиції можуть наноситися розведеними або нерозведеними.

Поняття "посівний матеріал" охоплює посівний матеріал всіх типів, таких як, наприклад, зерна, насіння, плоди, бульби, черешки і подібні форми. Переважно в даному винаході поняття описує зерна і насіння.

Застосовний посівний матеріал може бути посівним матеріалом зазначених вище технічних культур, а також посівний матеріал трансгенних рослин або одержаних завдяки звичайним методам вирощування.

Норми витрати діючих ізоксазоло[5,4-b]піридинів формули I згідно з даним винаходом (загальна кількість ізоксазоло[5,4-b]піридинів формули I) залежно від цілі боротьби, пори року, цільових рослин і стадії росту складають від 0,1 г/га до 3000 г/га, переважно від 10 г/га до 1000 г/га активної речовини (а.в.).

В іншому переважному варіанті винаходу, норми витрати ізоксазоло[5,4-b]піридинів формули I знаходяться в межах від 0,1 г/га до 5000 г/га і переважно в межах від 1 г/га до 2500 г/га або від 5 г/га до 2000 г/га активної речовини (а.в.).

В іншому переважному варіанті винаходу, норма витрати ізоксазоло[5,4-*b*]піридинів формули I складає від 0.1 до 1000 г/га, переважно від 1 до 750 г/га, більш переважно від 5 до 500 г/га активної речовини.

Для обробки посівного матеріалу, ізоксазоло[5,4-*b*]піридини I загалом застосовують в кількостях від 0,001 до 10 кг на 100 кг посівного матеріалу.

Для розширення спектру дії і для досягнення синергетичного ефекту ізоксазоло[5,4-*b*]піридини формули I можна змішувати з багаточисельними представниками інших гербіцидних або регулюючих ріст груп діючих речовин і потім вноситися разом. Придатними компонентами для сумішей є, наприклад, 1,2,4-тіадіазоли, 1,3,4-тіадіазоли, аміді, амінофосфорна кислота і її похідні, амінотріазоли, аніліди, (гет)арилоксиалканові кислоти і їх похідні, бензойна кислота і її похідні, бензотіадіазинони, 2-ароїл-1,3-циклогександіони, 2-гетароїл-1,3-циклогександіони, гетарил-арил-кетони, бензилізоксазолідинони, похідні мета-CF₃-фенілу, карбамати, хінолінкарбонова кислота і її похідні, хлорацетаніліди, похідні циклогексеноноксимоного ефіру, діазини, дихлорпропіонова кислота і її похідні, дигідробензофурані, дигідрофуран-3-они, динітроаніліни, динітрофеноли, прості дифенілові ефіри, дипіридили, галогенкарбонові кислоти і їх похідні, сечовини, 3-фенілурацили, імідазоли, імідазолінони, N-феніл-3,4,5,6 тетрагідрофталіміди, оксадіазоли, оксирани, феноли, складні ефіри арилокси- і гетероарилоксифеноксипропіонової кислоти, фенілоцтова кислота і її похідні, 2-фенілпропіонова кислота і її похідні, піразоли, фенілпіразоли, піридазини, піридинкарбонова кислота і її похідні, прості піримідилові ефіри, сульфонаміди, сульфонілсечовини, тріазини, тріазинони, тріазолінони, тріазолкарбоксаміди, урацили, фенілпіразоліни й ізоксазоліни і їх похідні.

Крім того, перед внесенням також може бути корисним застосовувати ізоксазоло[5,4-*b*]піридини формули I окремо або в комбінації з іншими гербіцидами, або ж у вигляді суміші з іншими засобами для захисту культурних рослин, наприклад, разом із засобами для боротьби зі шкідниками або фітопатогенними грибами або бактеріями. Також вигідним є змішування з розчинами мінеральних солей, які використовують для усунення недоліку поживних властивостей і мікроелементів. Також можуть бути додані нефітотоксичні олії й олійні концентрати.

Крім того, може бути вигідним, застосовувати ізоксазоло[5,4-*b*]піридини формули I в комбінації з сафенерами. Сафенери представляють собою хімічні сполуки, які запобігають або знижують ушкодження корисних рослин, при цьому вони суттєво не впливають на гербіцидну дію ізоксазоло[5,4-*b*]піридинів формули I відносно небажаних рослин. Вони можуть застосовуватися як перед посівом (наприклад, при обробках посівного матеріалу, черешків, або саджанців), так і до сходу або після сходу корисних рослин. Сафенери й ізоксазоло[5,4-*b*]піридини формули I можуть застосовуватися одночасно або один за іншим.

Придатними сафенерами є, наприклад, (хінолін-8-окси)оцтові кислоти, 1-феніл-5-галоалкіл-1Н-1,2,4-тріазол-3-карбонові кислоти, 1-феніл-4,5-дигідро-5-алкіл-1Н-піразол-3,5-дикарбонові кислоти, 4,5-дигідро-5,5-діарил-3-ізоксазолкарбонові кислоти, дихлорацетаміді, альфа-оксимінофенілацетонітрили, ацетофеноноксими, 4,6-дигало-2-фенілпіримідини, аміді N-[[4-(амінокарбоніл)феніл]сульфоніл]-2-бензойної кислоти, ангідрид 1,8-нафталевої кислоти, 2-гало-4-(галоалкіл)-5-тіазолкарбонові кислоти, фосфортіолати і N-алкіл-О-фенілкарбамати, а також їх застосовні в сільському господарстві солі, і за умови, що вони мають кислотну функцію, їх застосовні в сільському господарстві похідні, такі як аміді, складні ефіри і складні тіоефіри.

Нижче одержання типових ізоксазоло[5,4-*b*]піридинів формули I пояснюється за допомогою прикладів:

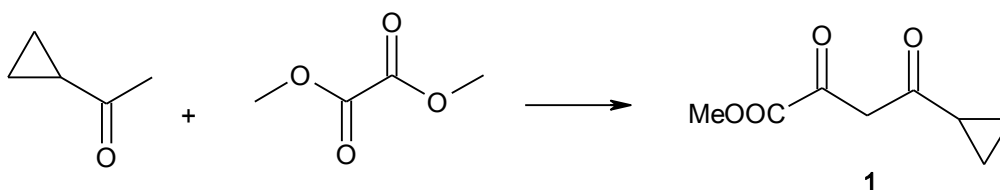
Спектри ЯМР були записані на Bruker Avance II 300. ЖК-МС були записані на Waters system при наведених нижче умовах:

Колонка: XTerra MS C₁₈ 5 мкм (4,6x100 мм)

Градiєнт: від 95 % H₂O/5 % MeOH до 100 % MeOH за 8 хв

Швидкість потоку: 1,5 мл/хв

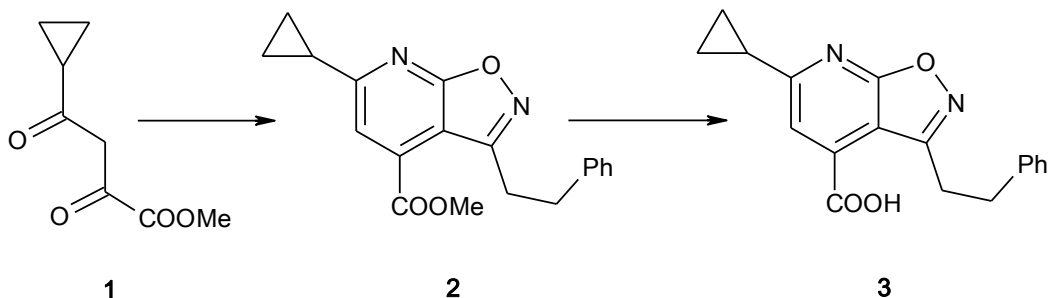
Альтернативно, використовували Shimadzu Nexera UHPLC в комбінації з Shimadzu LCMS 20-20, ESI; колонка: Phenomenex Kinetex 1,7 мкм XB-C18 100A;



Синтез сполуки 1

Na (14.67 г, 0.64 моль) розчиняли в сухому MeOH (0.8 л) і розчин циклопропілметилкетону (50 г, 0.59 моль) і диметилосалату (70.2 г, 0.59 моль) в сухому MeOH (0.2 л) додавали по краплях при 0 °С. Реакційну суміш перемішували при кімнатній температурі протягом 24 год. і в колбі зі зворотним холодильником протягом ночі. Додавали воду (0.5 л) і метанол видаляли при зниженому тиску. Водний розчин промивали за допомогою Et₂O (150 мл), підкислювали до pH=2 за допомогою 2M H₂SO₄ і екстрагували з Et₂O (3x150 мл). Органічний шар висушували над MgSO₄ і концентрували до сухості, щоб одержати сполуку 1 (55.6 г, 55 %), яку використовували без подальшого очищення.

¹H-ЯМР (CDCl₃): δ=14.61 (br, 1H), 6.84 (s, 1H), 3.90 (s, 3H), 1.95-1.82 (m, 1H), 1.26-1.20 (m, 2H), 1.10-1.00 (m, 2H).



Синтез сполуки 2

Суміш сполуки 1 (0.9 г, 5.3 ммоль) і 5-аміно-3-(2-фенілетил)ізоксазол (1.0 г, 5.3 ммоль) в AcOH (16мл) перемішували в колбі зі зворотним холодильником протягом 4 год. Реакційну суміш виливали на лід/воду (100 мл). Утворену тверду речовину збирали фільтрацією і висушували під високим вакуумом. Одержували 1.5 г (79 %) сполуки 2.

¹H-ЯМР (CDCl₃): δ=7.62 (s, 1H), 7.27-7.11 (m, 5H), 3.93 (s, 3H), 3.43-3.37 (m, 2H), 3.03-2.97 (m, 2H), 2.22-2.10 (m, 1H), 1.24-1.17 (m, 2H), 1.13-1.05 (m, 2H).

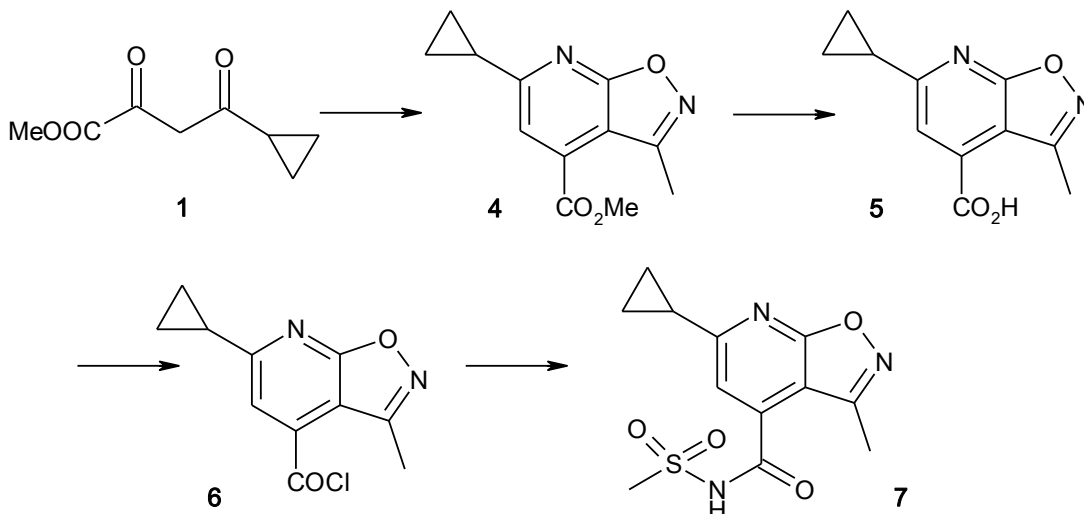
MS: m/z=323[M+H]⁺, 345 [M+Na]⁺

Синтез сполуки 3

Розчин сполуки 2 (1.0 г, 3.1 ммоль) в суміші 1:1 ТГФ/1N NaOH (15 мл) перемішували при кімнатній температурі протягом 2 год. Реакційну суміш концентрували в вакуумі, водний розчин підкислювали до pH=2 з 10 % HCl і екстрагували з AcOEt (3x10 мл). Органічний шар висушували над MgSO₄ і концентрували до сухості. Залишок перемішували в петролейному ефірі /Et₂O 10:1 і одержану тверду речовину збирали фільтрацією і висушували під високим вакуумом, щоб одержати сполуку 3 (0.82 г, 85 %).

¹H-ЯМР (CDCl₃): δ=7.81 (s, 1H), 7.31-7.13 (m, 5H), 3.52-3.46 (m, 2H), 3.12-3.05 (m, 2H), 2.34-2.22 (m, 1H), 1.34-1.28 (m, 2H), 1.26-1.17 (m, 2H).

MS: m/z=331 [M+Na]⁺, 353 [M-H+2Na]⁺, 639 [2M-2H+3Na]⁺



Синтез сполуки 4

Суміш сполуки 1 (3 г, 17.6 ммоль) і 5-аміно-3-метилізоксазолу (1.73 г, 17.6 ммоль) в АсОН (44 мл) перемішували в колбі зі зворотним холодильником протягом 2 год. Реакційну суміш

5 виливали на лід/воду (100 мл). Утворену тверду речовину збирали фільтрацією і висушували під високим вакуумом. Одержували 3.9 г (97 %) сполуки 4.

^1H -ЯМР (CDCl_3): δ =7.69 (s, 1H), 4.02 (s, 3H), 2.69 (s, 3H), 2.26-2.15 (m, 1H), 1.28-1.21 (m, 2H), 1.19-1.11 (m, 2H).

MS: m/z =233 $[\text{M}+\text{H}]^+$

Синтез сполуки 5

10 Розчин сполуки 4 (2.7 г, 11.6 ммоль) в суміші 1:1 ТГФ/1N NaOH (52 мл) перемішували при кімнатній температурі протягом 1,5 год. Реакційну суміш концентрували в вакуумі, водний розчин підкислювали до pH=2 з 10% HCl і утворену тверду речовину збирали фільтрацією і

15 висушували під високим вакуумом, щоб одержати сполуку 5 (2.4 г, 94 %).

^1H -ЯМР ($\text{DMSO}-d_6$): δ =7.78 (s, 1H), 2.59 (s, 3H), 2.46-2.36 (m, 1H), 1.18-1.01 (m, 4H).

MS: m/z =219 $[\text{M}+\text{H}]^+$.

Синтез сполуки 6

20 Суміш сполуки 5 (0.7 г, 3.2 ммоль) в SOCl_2 (6.4 мл) нагрівали в колбі зі зворотним холодильником протягом ночі. Леткі компоненти видаляли під вакуумом з використанням толуолу як співрозчинника. Одержували 760 мг сполуки 6 і застосовували без подальшого очищення.

Синтез сполуки 7

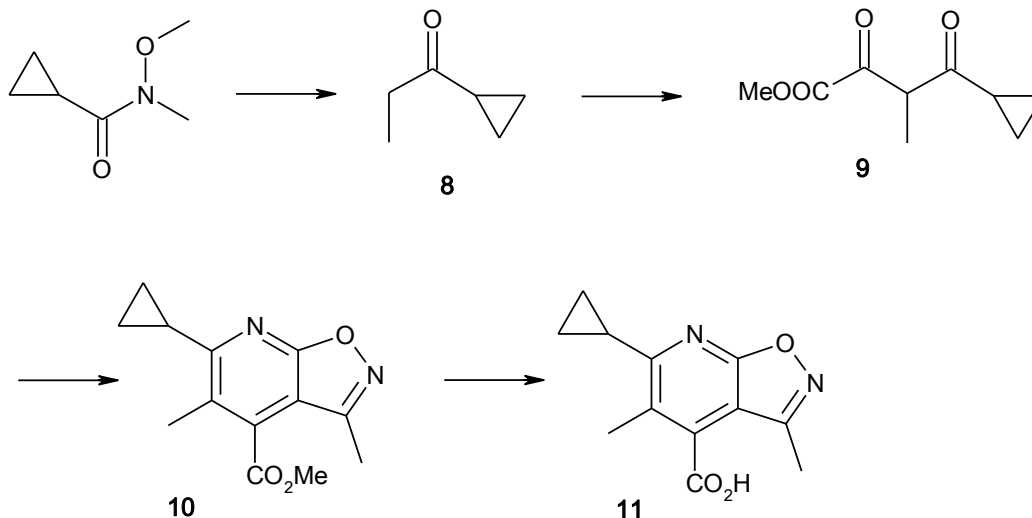
25 До розчину сполуки 6 (0.38 г, 1.6 ммоль) в сухому дихлорметані (8 мл) додавали метансульфонамід (0.17 г, 1.8 ммоль) і N,N-діізопропілетиламін (0.25 г, 1.9 ммоль) при 0 °C. Суміш перемішували при кімнатній температурі протягом 12 год. Реакційну суміш виливали у

водн. 5 % лимонну кислоту (20 мл) і екстрагували з дихлорметаном (3x10 мл). Органічний шар висушували над MgSO_4 , і концентрували до сухості. Залишок перемішували в Et_2O і утворену

тверду речовину збирали фільтрацією і після висушування його очищували преп. TCM (SiO_2 , $\text{CHCl}_3/\text{MeOH}$ 95:5). Одержували 160 мг (34 %) сполуки 7.

30 ^1H -ЯМР (CDCl_3): δ =7.36 (s, 1H), 3.37 (s, 3H), 2.57 (s, 3H), 2.22-2.11 (m, 1H), 1.25-1.05 (m, 4H).

MS: m/z =347 $[\text{M}+\text{Na}]^+$, 671 $[2\text{M}+\text{Na}]^+$.



Синтез сполуки 8

35 До розчину N-метокси-N-метил циклопропанкарбоксаміду (8 г, 62ммоль) у сухому ТГФ (93мл) додавали по краплях при -78 °C розчин 1M броміду етилмагнію в ТГФ (62 мл, 62 ммоль) під атмосферою азоту. Реакційну суміш повільно піддавали нагріванню до 0 °C, виливали в розчин фосфатного буферу (150 мл, pH=7) і екстрагували з Et_2O (3x50 мл). Органічний шар

40 висушували над MgSO_4 і концентрували при 45 °C/400 мБар. Залишок залишався в суміші 1:2 сполука 8/ТГФ (9.2 г, ~3.7 г продукт, ~61 %) і його застосовували без подальшого очищення.

^1H -ЯМР (CDCl_3): δ =2.54 (c, J=7.33 Hz, 2H), 1.94-1.84 (m, 1H), 1.04 (t, J=7.33 Hz, 3H), 1.00-0.92

(m, 2H), 0.85-0.76 (m, 2H).

Синтез сполуки 9

Na (0.93 г, 40.4 ммоль) розчиняли в сухому MeOH (52 мл) і розчин сполуки 8 (3.7 г, 37.7 ммоль) і диметилосалату (4.45 г, 37.7 ммоль) в сухому MeOH (15 мл) додавали по краплях при 0 °C. Реакційну суміш перемішували при кімнатній температурі протягом 18 год. Диметилосалат (4.45 г, 37.7 ммоль) і 30 % NaOMe в MeOH (7.5 мл) додавали і суміш перемішували при кімнатній температурі протягом 18 год. Додавали більше 30 % NaOMe в MeOH (2.5 мл) і суміш перемішували при кімнатній температурі протягом 18 год. перш ніж його виливали у воду (200 мл). Метанол видаляли при зниженому тиску. Водний розчин промивали за допомогою Et₂O (25 мл), підкислювали до pH=2 з 2M H₂SO₄ і екстрагували з Et₂O (3x50 мл). Органічний шар висушували над MgSO₄ і концентрували до сухості, щоб одержати сполуку 9 (5.1 г, ~82 %) яку використовували без подальшого очищення.

Синтез сполуки 10

Суміш сполуки 9 (5 г, 27.1 ммоль) і 5-аміно-3-метилізоксазол (2.66 г, 27.1 ммоль) в AcOH (78 мл) перемішували в колбі зі зворотним холодильником протягом 1 год. Реакційну суміш концентрували до сухості і радикал розчиняли в AcOEt (50 мл) і промивали водн. нас. NaHCO₃ (2x15 мл). Органічний шар висушували над MgSO₄, і концентрували до сухості. Залишок очищували колонковою флеш-хроматографією (SiO₂, c-Hex/AcOEt), щоб одержати сполуку 10 (1.3 г, 18 %).

¹H-ЯМР (CDCl₃): δ=2.50 (s, 3H), 2.43 (s, 3H), 2.30-2.20 (m, 1H), 1.30-1.22 (m, 2H), 1.16-1.07 (m, 2H).

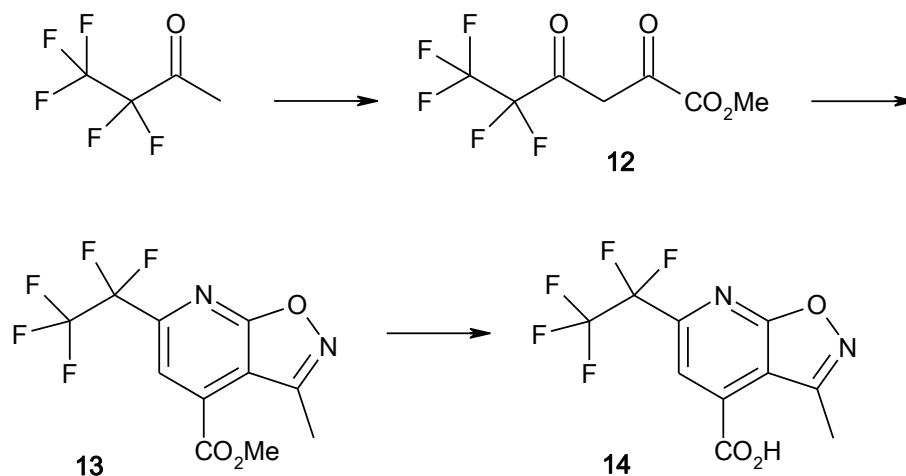
MS: m/z=269 [M+Na]⁺.

Синтез сполуки 11

Розчин сполуки 10 (0.6 г, 2.1 ммоль) в суміші 1:1 ТГФ/1N NaOH (12 мл) перемішували при кімнатній температурі протягом 12 год. Реакційну суміш концентрували в вакуумі, водний розчин підкислювали до pH=2 з 10 % HCl і екстрагували з дихлорметан (3x25 мл). Органічний шар висушували над MgSO₄, і концентрували до сухості. Залишок перемішували в петролейному ефірі/Et₂O 10:1 і одержану тверду речовину збирали фільтрацією і висушували під високим вакуумом, щоб одержати сполуку 11 (0.41 г, 85 %).

¹H-ЯМР (MeOD-d₄): δ=2.44 (s, 3H), 2.38 (s, 3H), 2.32-2.25 (m, 1H), 1.10-1.00 (m, 2H).

MS: m/z=233 [M+H]⁺, 255 [M+Na]⁺, 277 [M-H+2Na]⁺.



Синтез сполуки 12

Na (0.76 г, 33.1 ммоль) розчиняли в сухому MeOH (42 мл) і розчин 3,3,4,4,4-пентафтор-бутан-2-ону (5 г, 30.9 ммоль) і диметилосалату (3.64 г, 30.9 ммоль) в сухому MeOH (13 мл) додавали по краплях при 0 °C. Реакційну суміш перемішували при кімнатній температурі протягом ночі. Додавали воду (50 мл), і метанол видаляли при зниженому тиску. Водний розчин промивали за допомогою Et₂O (25 мл), підкислювали до pH=2 за допомогою 2M H₂SO₄ і екстрагували з Et₂O (3x25 мл). Органічний шар висушували над MgSO₄ і концентрували до сухості, щоб одержати сполуку 12 (2 г, ~26 %), яку використовували без подальшого очищення.

¹H-ЯМР (CDCl₃): δ=6.28 (s, 1H), 3.92 (s, 3H).

Синтез сполуки 13

Суміш сполуки 12 (2 г, 8.1 ммоль) і 5-аміно-3-метилізоксазол (0.67 г, 6.8 ммоль) в AcOH (20 мл) перемішували в колбі зі зворотним холодильником протягом 1 год. Реакційну суміш виливали на лід/воду (50 мл) і екстрагували з Et₂O (3x25 мл). Органічний шар промивали за допомогою водн. нас. NaHCO₃ (2x15 мл), висушували над MgSO₄ і концентрували до сухості.

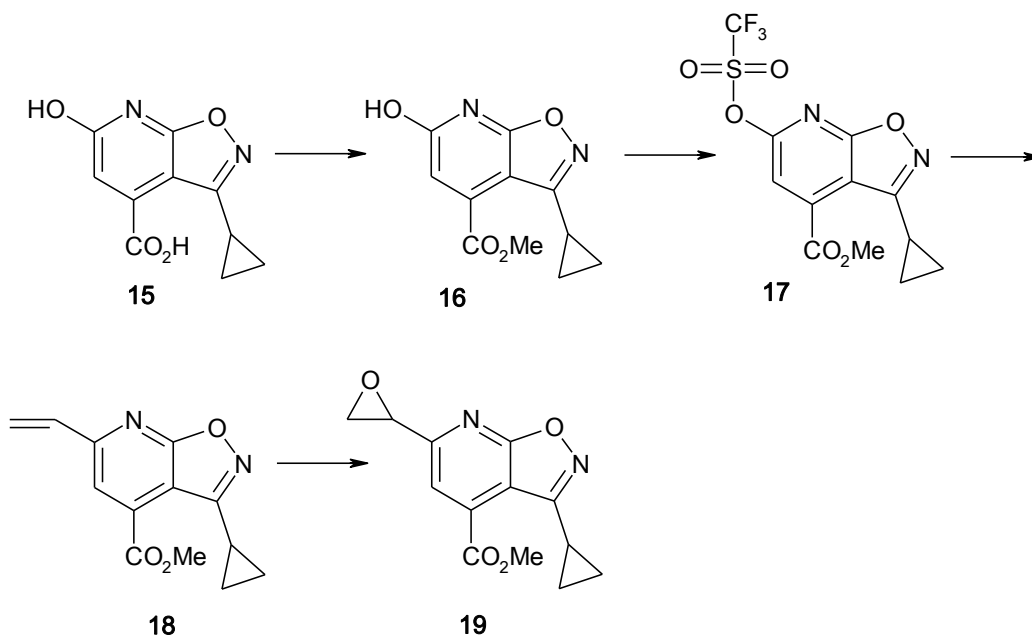
Сирий продукт реакції очищували колонковою флеш-хроматографією (SiO_2 , c-Hex/AcOEt) і одержували 60 мг сполуки 13 (2.4 %).

Синтез сполуки 14

Розчин сполуки 13 (56 мг, 0.2 ммоль) в суміші 1:1 ТГФ/1N NaOH (2 мл) перемішували при кімнатній температурі протягом 4 год. Реакційну суміш концентрували в вакуумі, водний розчин підкислювали до pH=2 з 10 % HCl і екстрагували з дихлорметан (3×5 мл). Органічний шар висушували над MgSO_4 , і концентрували до сухості. Залишок перемішували в петролейному ефірі/ Et_2O 10:1 і одержану тверду речовину збирали фільтрацією і висушували під високим вакуумом, щоб одержати сполуку 14 (44 мг, 88%).

^1H -ЯМР (CDCl_3): δ =8.31 (s, 1H), 2.86 (s, 3H).

MS: m/z=319 $[\text{M}+\text{Na}]^+$, 341 $[\text{M}-\text{H}+2\text{Na}]^+$



Синтез сполуки 16

Суміш сполуки 15 (0.85 г, 3.9 ммоль) і р-толуолсульфонової кислоти (0.27 г, 1.5 ммоль) в MeOH (17 мл) нагрівали в колбі зі зворотним холодильником протягом 4 днів. Розчинник видаляли, і залишок розводили сумішшю CHCl_3 /2-пропанол 7:3 (50 мл) і промивали за допомогою водн. нас. NaHCO_3 (2×15 мл). Органічний шар висушували над MgSO_4 , і концентрували до сухості. 620 мг (69 %) сполуки 16 одержували і застосовували без подальшого очищення.

^1H -ЯМР (CDCl_3): δ =7.19 (s, 1H), 4.04 (s, 3H), 2.59-2.44 (m, 1H), 1.25-1.17 (m, 2H), 1.15-1.00 (m, 2H).

MS: m/z=335 $[\text{M}+\text{H}]^+$, 357 $[\text{M}+\text{Na}]^+$

Синтез сполуки 17

До розчину сполуки 16 (0.19 г, 0.8 ммоль) в сухому дихлорметані (3 мл) додавали при 0 °C піридин (80 мг, 1 ммоль) і ангідрид трифторметансульфонової кислоти (0.29 г, 1 ммоль) і суміш перемішували при цій температурі протягом ½ год. і при к.т. протягом 8 год. Реакційну суміш розводили водою (3 мл) і екстрагували з ДХМ (2×5 мл). Органічний шар висушували над MgSO_4 і концентрували до сухості. Неочищений продукт реакції очищували колонковою флеш-хроматографією, щоб одержати 190 мг (63 %) сполуки 17.

^1H -ЯМР (CDCl_3): δ =7.66 (s, 1H), 4.07 (s, 3H), 2.71-2.57 (m, 1H), 1.22-1.10 (m, 4H).

MS: m/z=367 $[\text{M}+\text{H}]^+$.

Синтез сполуки 18

Суміш сполуки 17 (150 мг, 0.41 ммоль), LiCl (90 мг, 2.1 ммоль), трибутилвінілцини (170 мг, 0.53 ммоль) і дихлориду біс(трифенілфосфін)паладію (II) (50 мг, 0.07 ммоль) в сухому ДМФ (5 мл) перемішували при 80 °C протягом 1 год. Після охолодження, розчин NaF (390 мг) додавали в воду (4.5 мл) і суміш перемішували при кімнатній температурі протягом 1 год. Реакційну суміш відфільтровували через целітну прокладку і осад на фільтрі промивали за допомогою AcOEt. Шари фільтрату відокремлювали, водний шар екстрагували з AcOEt (3×10 мл) і об'єднаний органічний шар висушували над MgSO_4 і концентрували до сухості. Неочищений продукт реакції

очищували колонковою флеш-хроматографією, щоб одержати 80 мг (80 %) сполуки 18. В одержаній таким чином сполуці виявлялися деякі домішки від реагенту цини.

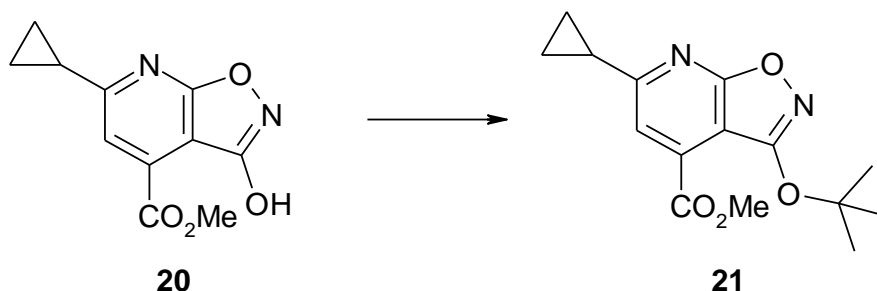
^1H -ЯМР (CDCl_3): δ =7.81 (s, 1H), 6.92 (dd, J =17.4, 10.7 Hz, 1H), 6.51 (d, J =17.4 Hz, 1H), 5.73 (d, J =10.7 Hz, 1H), 4.04 (s, 3H), 2.67-2.57 (m, 1H), 1.20-1.14 (m, 2H), 1.13-1.05 (m, 2H).

5 MS: m/z =467 $[\text{M}+\text{Na}]^+$.

Синтез сполуки 19

До розчину сполуки 18 (100 мг, 0.41 ммоль) в дихлорметані (4 мл) додавали при 0 °C розчин мета-хлорпероксибензойної кислоти (71 мг, 0.41 ммоль) в дихлорметані (4 мл), який попередньо висушували над MgSO_4 . Реакційну суміш перемішували при к.т. протягом 24 год., перш ніж додавали новий розчин мета-хлорпероксибензойної кислоти (71 мг, 0.41 ммоль) в дихлорметані (4 мл). Цю дію повторювали два рази. Суміш промивали за допомогою водн. нас. NaHCO_3 (3x10 мл) і органічний шар висушували над MgSO_4 і концентрували до сухості. Залишок очищували за допомогою препарат. ТХХ (SiO_2 , c-Hex/ AcOEt), щоб одержати 45 мг (41 %) сполуки 19. Сполука 19, одержана таким чином містила деяку кількість мета-хлорбензойної кислоти.

15 ^1H -ЯМР (CDCl_3): δ =7.69 (s, 1H), 4.19-4.14 (m, 1H), 4.03 (s, 3H), 3.29 (dd, J =5.1, 4.1 Hz, 1H), 3.01 (dd, J =5.3, 2.1 Hz, 1H), 2.70-2.57 (m, 1H), 1.20-1.14 (m, 2H), 1.14-1.07 (m, 2H).



20 Синтез сполуки 20

Суміш сполуки 1 (17 г, 0.1 моль) і 5-аміно-ізоксазол-3-ону (10 г, 0.1 моль) в оцтовій кислоті (AcOH) (100 мл) перемішували в колбі зі зворотним холодильником протягом 2 год. Реакційну суміш виливали на лід/воду (200 мл). Утворену тверду речовину збирали фільтрацією і висушували під високим вакуумом. Одержували 19 г (82 %) сполуки 20.

25 ^1H -ЯМР (CDCl_3): δ =10.30 (bs, 1H), 7.69 (s, 1H), 4.12 (s, 3H), 2.27-2.20 (m, 1H), 1.29-1.22 (m, 2H), 1.21-1.12 (m, 2H).

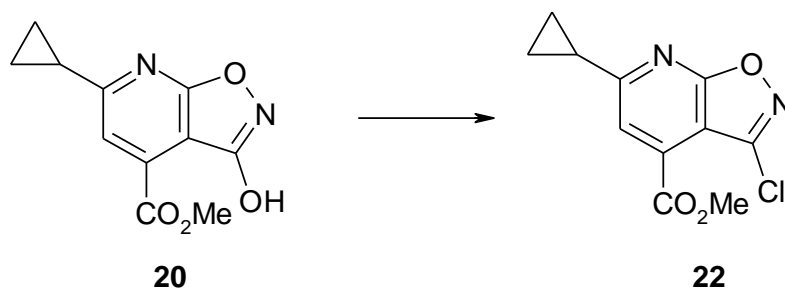
MS: m/z =235 $[\text{M}+\text{H}]^+$

Синтез сполуки 21

До перемішаного розчину трифенілфосфіну (12.3 г, 46.9 ммоль) в сухому ТГФ (150 мл) додавали по краплях діізопропілу азодикарбоксилат (9.5 г, 46.9 ммоль) при 0 °C під атмосферою азоту, і суміш перемішували протягом 20 хв. Потім, $t\text{-BuOH}$ (3.5 г, 47.2 ммоль) і сполуку 20 (10 г, 42.7 ммоль) додавали при 0 °C. Суміш перемішували при кімнатній температурі протягом 2 год. і нагрівали до 40 °C, перемішували протягом ночі. Суміш охолоджували до к. т. і додавали іншу порцію трифенілфосфіну (12.3 г, 46.9 ммоль), $t\text{-BuOH}$ (3.5 г, 47.2 ммоль) і діізопропілу азодикарбоксилат (9.5 г, 46.9 ммоль). Суміш перемішували при кімнатній температурі протягом 1 год. і нагрівали до 60 °C, перемішували протягом ночі. Розчинник видаляли при зниженому тиску. Залишок очищували колонковою хроматографією (SiO_2 , c-Hex/ AcOEt), щоб одержати сполуку 21 (5.6 г, вихід: 45 %)

40 ^1H -ЯМР (CDCl_3): δ =7.52 (s, 1H), 4.00 (s, 3H), 2.25-2.16 (m, 1H), 1.65 (s, 9H), 1.28-1.21 (m, 2H), 1.19-1.11 (m, 2H).

MS: m/z =235 $[\text{M}-t\text{Bu}+\text{H}]^+$

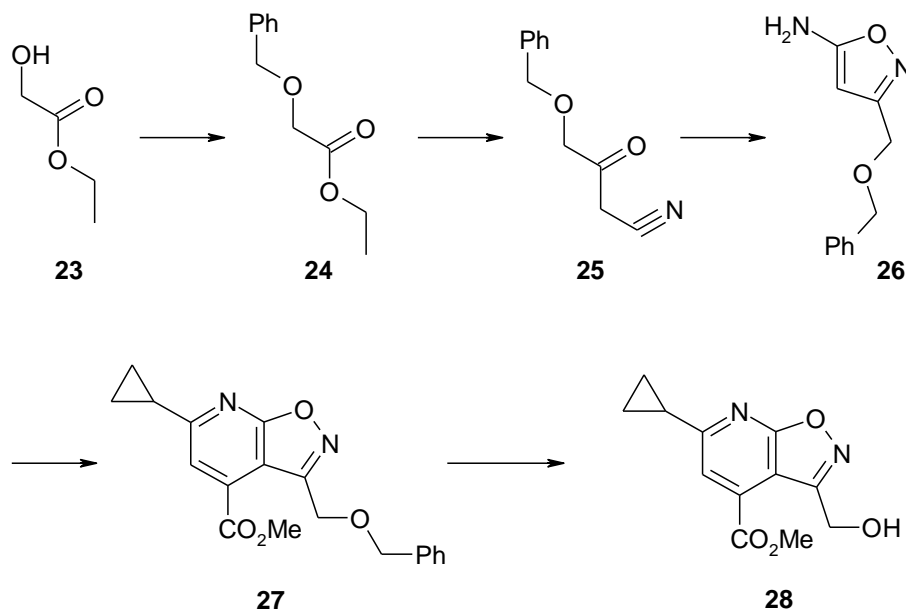


Синтез сполуки 22

Суміш сполуки 20 (12 г, 0.05 моль), піридину гідрохлориду (20 г, 0.17 моль), H_3PO_4 (3.6 г, 0.04 моль) і POCl_3 (120 мл) перемішували при 90 °С протягом 3 год. Надлишок POCl_3 випарювали під високим вакуумом. Суміш, що залишилася розчиняли в етилацетаті і повільно нейтралізували з NaHCO_3 при 0 °С. Органічний шар промивали за допомогою розсолу і води, висушували над MgSO_4 і концентрували до сухості. Залишок очищували колонковою хроматографією (SiO_2 , c-Hex/AcOEt), щоб одержати сполуку 22 (6.5 г, вихід: 50 %).

^1H -ЯМР (CDCl_3): δ =7.72 (s, 1H), 4.05 (s, 3H), 2.29-2.20 (m, 1H), 1.32-1.26 (m, 2H), 1.25-1.18 (m, 2H).

MS: m/z =253 $[\text{M}+\text{H}]^+$



Синтез сполуки 24

До розчину етилового ефіру гідрокси-оцтової кислоти 23 (99.6 г, 0.96 моль) в ТГФ (1.5L) під атмосферою азоту, NaH (42 г, 1.0 моль: 60 % в мінеральній олії) додавали порціями при 0 °С. Суміш перемішували при 0 °С протягом 30 хв. і додавали тетрабутиламонію йодид (35.3 г, 0.10 моль) і бензилбромід (163.6 г, 0.96 моль). Суміш піддавали нагріванню до к.т. і перемішували при цій температурі протягом 12 год. Реакційну суміш розводили з водою і екстрагували етилацетатом. Органічний шар висушували над MgSO_4 , розчинник випарювали під високим вакуумом і сирий продукт дистильовали (121 °С /4 мБар), щоб одержати сполуку 24 (135.5 г, вихід: 73%).

^1H -ЯМР (CDCl_3): δ =7.41- 7.22 (m, 5H), 4.65 (s, 2H), 4.27 (q, 2H), 4.11 (s, 2H), 1.25 (t, 3H).

Синтез сполуки 25

Тетрагідрофуран (1 л) і NaH (30 г, 0.77 моль: 60 % в мінеральній олії) перемішували під атмосферою азоту і нагрівали до 50 °С. До цієї суміші додавали тетрагідрофурановий розчин сполуки 24 (135.5 г, 0.70 моль) і ацетонітрil (37.1 г, 0.90 моль). Реакційну суміш перемішували при кімнатній температурі протягом 12 год. Реакційну суміш розводили з водою і екстрагували за допомогою МТБЕ (метилтрет-бутиловий ефір). Водну фазу підкислювали лимонною кислотою (pH=3) і екстрагували етилацетатом. Органічний шар промивали за допомогою розсолу і води, висушували над MgSO_4 і концентрували до сухості. Залишок очищували колонковою хроматографією (SiO_2 , c-Hex/AcOEt), щоб одержати сполуку 25 (41 г, вихід: 31 %).

^1H -ЯМР (CDCl_3): δ =7.40- 7.21 (m, 5H), 4.58 (s, 2H), 4.10 (s, 2H), 3.61 (s, 2H).

Синтез сполуки 26

Суміш сполуки 25 (63.3 г, 0.33 моль), гідроксиламіну гідрохлорид (30.2 г, 0.43 моль) і ацетат натрію (82.3 г, 1 моль) в EtOH (1L) перемішували при кімнатній температурі протягом 4 год. Розчинник видалляли під високим вакуумом. Реакційну суміш виливали в воду і екстрагували з метиленхлоридом. Органічний шар промивали за допомогою розсолу і води, висушували над MgSO_4 і концентрували до сухості. Залишок очищували колонковою хроматографією (SiO_2 , c-Hex/AcOEt), щоб одержати сполуку 26 (13.8 г, вихід: 20 %).

^1H -ЯМР (CDCl_3): δ =7.40- 7.22 (m, 5H), 5.20 (s, 1H), 4.55 (bs, 4H), 4.46 (s, 2H).

Синтез сполуки 27

Суміш сполуки 1 (11.5 г, 0.07 моль) і 26 (13.8 г, 0.07 моль) в AcOH (150 мл) перемішували в колбі зі зворотним холодильником протягом 2 год. Реакційну суміш виливали на лід/воду (200 мл). Утворену тверду речовину збирали фільтрацією і висушували під високим вакуумом.

5 Одержували 16.5 г (72 %) сполуки 27.

^1H -ЯМР (CDCl_3): δ =7.68 (s, 1H), 7.32 (s, 5H), 5.03 (s, 2H), 4.60 (s, 2H), 3.95 (s, 3H), 2.26-2.20 (m, 1H), 1.30-1.25 (m, 2H), 1.20-1.12 (m, 2H).

MS: m/z =339 $[\text{M}+\text{H}]^+$

Синтез сполуки 28

10 BCl_3 (5.9 мл, 5.91 ммоль; 1M в CH_2Cl_2) повільно додавали до розчину сполуки 27 (1 г, 2.96 ммоль) в CH_2Cl_2 (20 мл) при -78°C і реакційну суміш перемішували при цій температурі протягом 2 год. Додавали насичений водний NaHCO_3 . Шари відокремлювали і органічний шар промивали за допомогою розсолу і води, висушували над MgSO_4 і концентрували до сухості.

15 Залишок перемішували діізопропіловим ефіром і утворену тверду речовину збирали фільтрацією і висушували під високим вакуумом, щоб одержати сполуку 29 (0.5 г, вихід: 68 %).

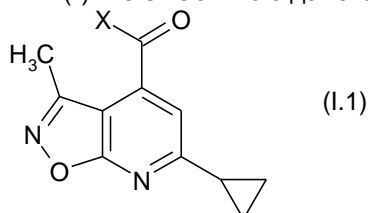
^1H -ЯМР (CDCl_3): δ =7.80 (s, 1H), 5.00 (s, 2H), 4.07 (s, 3H), 3.88 (bs, 1H), 2.28-2.20 (m, 1H), 1.30-1.25 (m, 2H), 1.20-1.15 (m, 2H).

Ізоксазол[5,4-*b*]піридини згідно з таблицею з 7 по 14 нижче одержували відповідно до методів, описаних вище; сполуки, помічені "(-)" не є частиною даного винаходу:

20

Таблиця 7

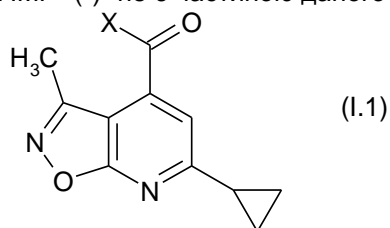
Сполуки ЯМР "(-)" не є частиною даного винаходу



№ спол.	X	ЧУ (хв)	$m/z=[\text{M}+\text{H}]^+$
I.1.1 (-)		3.241	370.1
I.1.2 (-)		3.082	401.1
I.1.3		2.781	345.1
I.1.4 (-)		3.527	385.1
I.1.5		3.541	477.1

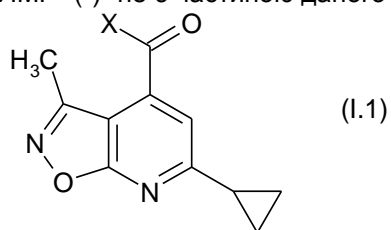
Таблица 7

Сполуки ЯМР "(-)" не є частиною даного винаходу



№ спол.	X	ЧУ (хв)	m/z=[M+H] ⁺
I.1.6	OCH ₂ CN	3.147	258.1
I.1.7		3.734	426.2
I.1.8 (-)		2.892	409.1
I.1.9 (-)		3.943	383.1
I.1.10		3.943	383.1
I.1.11		4.283	361.1
I.1.12 (-)		3.741	406.2
I.1.13 (-)		3.646	384.1
I.1.14		4.106	353.1

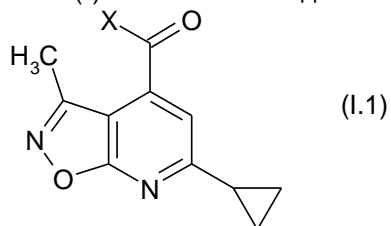
Сполуки ЯМР "(-)" не є частиною даного винаходу



№ спол.	X	ЧУ (хв)	m/z=[M+H] ⁺
I.1.15		3.899	366.1
I.1.16 (-)		3.473	410.1
I.1.17		3.941	381.1
I.1.18 (-)		3.490	324.1
I.1.19 (-)		3.604	366.1
I.1.20		3.477	483.1
I.1.21 (-)		3.794	350.1

Таблица 7

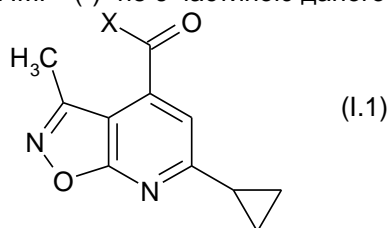
Сполуки ЯМР "(-)" не є частиною даного винаходу



№ спол.	X	ЧУ (хв)	m/z=[M+H] ⁺
I.1.22 (-)		3.530	380.1
I.1.23 (-)		3.491	422.2
I.1.24		2.600	290.1
I.1.25 (-)		3.847	386.2
I.1.26 (-)		3.346	391.1
I.1.27 (-)		3.927	437.1

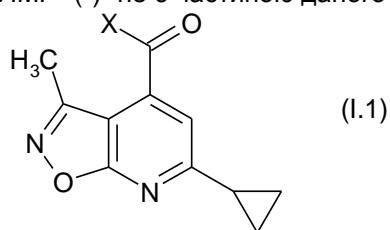
Таблица 7

Сполуки ЯМР "(-)" не є частиною даного винаходу



№ спол.	X	ЧУ (хв)	m/z=[M+H] ⁺
I.1.28 (-)		2.883	422.1
I.1.29 (-)		2.978	330.1
I.1.30 (-)		4.140	395.1
I.1.31 (-)		4.043	406.1
I.1.32 (-)		4.057	434.2
I.1.33 (-)		3.875	436.2
I.1.34		3.686	344.1
I.1.35		3.804	372.2
I.1.36		4.082	388.2

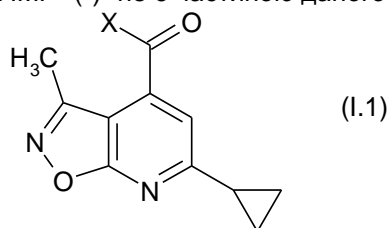
Сполуки ЯМР "(-)" не є частиною даного винаходу



№ спол.	X	ЧУ (хв)	m/z=[M+H] ⁺
I.1.37		4.156	417.1
I.1.38 (-)		3.503	386.1
I.1.39	OCH ₃	3.254	233.1
I.1.40		4.099	398.0
I.1.41 (-)		3.984	406.2
I.1.42 (-)		3.437	386.1
I.1.43	(CH ₃) ₃ COCOCH ₂ O	3.989	333.1
I.1.44 (-)		3.624	396.1
I.1.45 (-)		3.778	424.2
I.1.46 (-)		3.813	414.1

Таблица 7

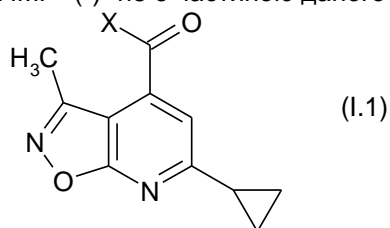
Сполуки ЯМР "(-)" не є частиною даного винаходу



№ спол.	X	ЧУ (хв)	m/z=[M+H] ⁺
I.1.47 (-)		4.073	405.1
I.1.48 (-)		3.636	358.2
I.1.49		4.063	371.1
I.1.50 (-)		3.653	412.2
I.1.51		3.767	357.1
I.1.52 (-)		3.990	386.2
I.1.53	OCH ₂ CO ₂ CH ₃	3.275	291.1
I.1.54 (-)		3.048	384.2

Таблица 7

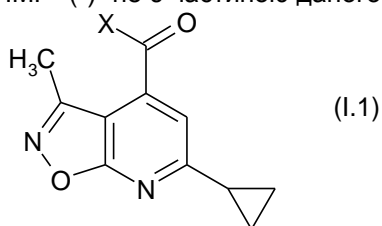
Сполуки ЯМР "(-)" не є частиною даного винаходу



№ спол.	X	ЧУ (хв)	m/z=[M+H] ⁺
I.1.55 (-)		3.740	373.1
I.1.56		4.007	369.1
I.1.57 (-)		4.196	401.0
I.1.58 (-)		3.641	398.1
I.1.59		4.288	361.1
I.1.60		3.909	391.1
I.1.61	OCH ₂ OCH ₃	2.592	219.1
I.1.62	OCH ₂ CH=CH ₂	3.750	259.1
I.1.63	OCH ₂ CH ₃	3.609	247.1
I.1.64	OCH ₂ CH=CClCH ₃ (Z-ізомер)	4.170	219.1
I.1.65	OCH ₂ CHF ₂	3.539	283.1
I.1.66	OCH ₂ CH=C(CH ₃) ₂	4.234	219.1
I.1.67	OCH ₂ CF ₃	3.824	301.1
I.1.68	OCH ₂ CCCH ₃	3.761	271.1

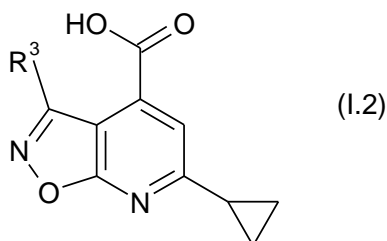
Таблица 7

Сполуки ЯМР "(-)" не є частиною даного винаходу



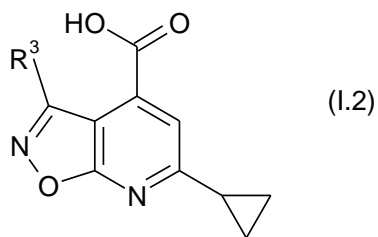
№ спол.	X	ЧУ (хв)	m/z=[M+H] ⁺
I.1.69	O(CH ₂) ₂ OCH ₂ CH ₃	3.579	291.1
I.1.70	O[(CH ₂) ₂ O] ₂ C ₄ H ₉	4.082	363.2
I.1.71	OC(CH ₃) ₂	4.148	219.1
I.1.72	OC ₃ H ₇	3.936	261.1
I.1.73	OCH ₂ C(CH ₃) ₂	4.431	289.1
I.1.74	O(CH ₂) ₂ OH	2.641	263.1
I.1.75	O(CH ₂) ₂ OCH=CH ₂	3.705	289.1
I.1.76	OCH ₂ CH=CHC≡CH	3.799	283.1
I.1.77	NHSO ₂ CH ₃	0.909	296
I.1.78	NHSO ₂ C ₆ H ₅	1.102	358
I.1.79	SCH ₂ C ₆ H ₅	1.441	325
I.1.80	SCH ₂ CHCH ₂	1.351	275
I.1.81	S(CH ₂) ₃ CH ₃	1.480	291
I.1.82	SCH ₃	1.236	249
I.1.83	N(OCH ₃)CH ₃	0.985	262

Таблица 8



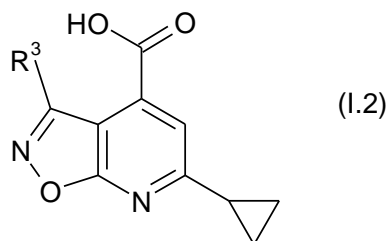
№ спол.	R ³	ЧУ (хв)	m/z=[M+H] ⁺
I.2.1	CH ₃	2.574	219.1
I.2.2	CH ₂ C(CH ₃) ₂	3.429	275.1
I.2.3	(CH ₂) ₂ CH ₃	3.078	247.1
I.2.4		2.885	271.0
I.2.5	C ₆ H ₅	3.108	281.1
I.2.6	CH(CH ₃) ₂	3.048	247.1
I.2.7		2.920	245.1
I.2.8	4-CH ₃ O-C ₆ H ₄	3.176	311.1

Таблица 8



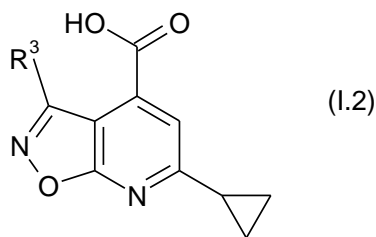
№ спол.	R ³	ЧУ (хв)	m/z=[M+H] ⁺
I.2.9		2.651	313.1
I.2.10	CF ₃	3.176	273.0
I.2.11	(CH ₂) ₂ C ₆ H ₅	3.543	309.1
I.2.12		3.180	259.1
I.2.13		3.156	259.1
I.2.14		3.370	273.1
I.2.15		2.078	282.1
I.2.16		0.763	282
I.2.17	4-Cl-C ₆ H ₄	1.175	315
I.2.18	4-CF ₃ -C ₆ H ₄	1.234	349
I.2.19	4-C ₆ H ₅ -C ₆ H ₄	1.287	357
I.2.20	4-Br-C ₆ H ₄	1.194	360
I.2.21	3-CF ₃ -C ₆ H ₄	1.228	349
I.2.22	3-OCH ₃ -C ₆ H ₄	1.110	311
I.2.23	3-OCH ₃ , 4-OCH ₃ -C ₆ H ₃	1.066	341
I.2.24	3-Cl-C ₆ H ₄	1.183	315
I.2.25	CH ₂ CH ₃	1.012	233
I.2.26		1.218	287
I.2.27		1.232	287
I.2.28	(CH ₂) ₄ CH ₃	1.225	275

Таблица 8



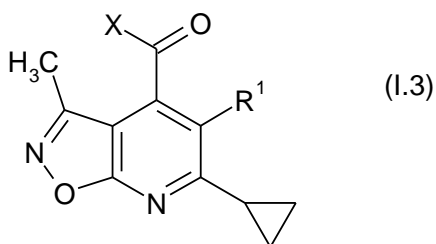
№ спол.	R ³	ЧУ (хв)	m/z=[M+H] ⁺
I.2.29		1.280	301
I.2.30		1.363	315
I.2.31	3-F-C ₆ H ₄	1.131	299
I.2.32	3-Cl,5-Cl-C ₆ H ₃	1.281	349 [M] ⁺
I.2.33	2-OCH ₃ -C ₆ H ₄	1.090	311
I.2.34	2-OCH ₃ ,3-OCH ₃ ,4-OCH ₃ -C ₆ H ₂	1.107	371
I.2.35	2-Cl-C ₆ H ₄	1.144	315
I.2.36	3-OCH ₃ ,5-OCH ₃ -C ₆ H ₃	1.133	341
I.2.37	(CH ₂) ₃ C ₆ H ₄	1.256	323
I.2.38	CH ₂ OCH ₃	0.938	249
I.2.39	(CH ₂) ₂ CH(CH ₃) ₂	1.218	275
I.2.40		1.238	329
I.2.41		1.304	313
I.2.42	(CH ₂) ₂ -4-OCH ₃ -C ₆ H ₄	1.209	339
I.2.43	4-I-C ₆ H ₄	1.230	406 [M] ⁺
I.2.44	3-F,5-F-C ₆ H ₃	1.178	317
I.2.45	4-OCHF ₂ -C ₆ H ₄	1.170	347
I.2.46		1.058	263
I.2.47		1.146	299
I.2.48	H	0.558	205
I.2.49	CH ₂ OH	0.825	235
I.2.50	2-F-C ₆ H ₄	1.126	299
I.2.51	4-F-C ₆ H ₄	1.123	299
I.2.52	2-CH ₃ -C ₆ H ₄	1.145	295
I.2.53	OCH ₃	0.933	235
I.2.54	OCH ₂ CH ₃	1.004	249
I.2.55	O(CH ₂) ₂ CH ₃	1.084	263
I.2.56	O(CH ₂) ₃ CH ₃	1.157	277

Таблица 8



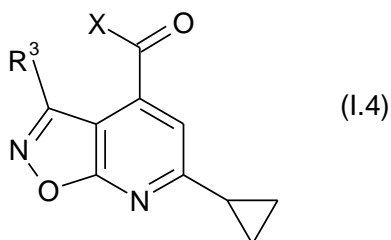
№ спол.	R ³	ЧУ (хв)	m/z=[M+H] ⁺
I.2.57	OCH(CH ₃) ₂	1.075	263
I.2.58	OC(CH ₃) ₃	1.142	277
I.2.59	2-Br-C ₆ H ₄	1.173	360
I.2.60	2-CF ₃ -C ₆ H ₄	1.245	349
I.2.61	4-CH ₂ CH ₃ -C ₆ H ₄	1.232	309
I.2.62	4-OCH ₂ CH ₃ -C ₆ H ₄	1.187	325
I.2.63	4-O(CH ₂) ₃ CH ₃ -C ₆ H ₄	1.313	353
I.2.64	2-OCHF ₂ -C ₆ H ₄	1.152	347
I.2.65	4-NO ₂ -C ₆ H ₄	1.164	326
I.2.66	4-CH(CH ₃) ₂ -C ₆ H ₄	1.279	323
I.2.67		1.107	285
I.2.68		1.125	285
I.2.69		1.148	301
I.2.70		1.168	301
I.2.71	4-C(CH ₃) ₃ -C ₆ H ₄	1.333	337
I.2.72	OH	0.884	221
I.2.73		1.103	366
I.2.74	OCH(CH ₂ CH ₃) ₂	1.237	291

Таблица 9



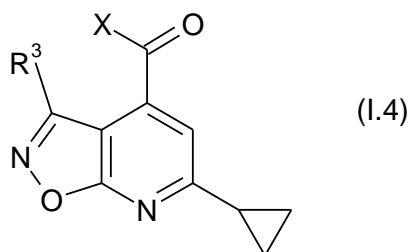
№ спол.	R ¹	X	ЧУ (хв)	m/z=[M+H] ⁺
I.3.1	CH ₂ C ₆ H ₅	OH	3.353	309.1
I.3.2	CH ₃	OH	2.539	233.1
I.3.3	Br	OH	2.606	297.0
I.3.4	Cl	OH	2.568	253.0
I.3.5	CH ₂ C ₆ H ₅	OC(CH ₃) ₃	4.538	365.2
I.3.6	CH ₃	OCH ₃	3.380	247.1
I.3.7	Br	OCH ₃	3.770	311.0
I.3.8	Cl	OCH ₃	3.732	267.0

Таблица 10



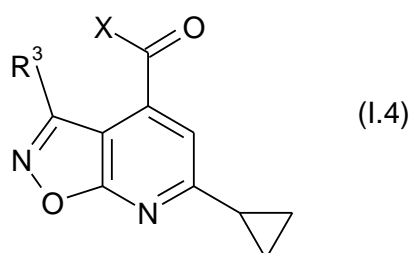
№ спол.	R ³	X	ЧУ (хв)	m/z=[M+H] ⁺
I.4.1		OCH ₃	4.134	287.1
I.4.2		OCH ₃	2.393	296.1
I.4.3		OCH ₃	3.897	273.1
I.4.4		OCH ₃	3.942	273.1
I.4.5	(CH ₂) ₂ C ₆ H ₅	OCH ₃	4.164	323.1
I.4.6	CF ₃	OCH ₃	3.821	287.0
I.4.7	4-CH ₃ O-C ₆ H ₄	OCH ₃	3.820	325.1
I.4.8	4-CH ₃ -C ₆ H ₄	OCH ₃	4.055	309.1
I.4.9	4-F-C ₆ H ₄	OCH ₃	3.882	313.1

Таблица 10



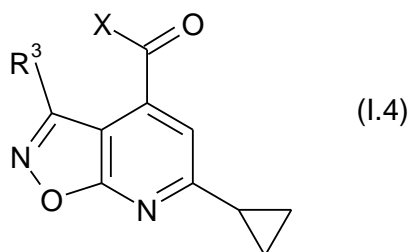
№ спол.	R ³	X	ЧУ (хв)	m/z=[M+H] ⁺
I.4.10		OCH ₃	3.287	327.1
I.4.11	2-F-C ₆ H ₄	OCH ₃	3.880	313.1
I.4.12		OCH ₃	3.085	327.1
I.4.13		OCH ₃	0.880	296
I.4.14	4-Cl-C ₆ H ₄	OCH ₃	1.363	329
I.4.15	4-CF ₃ -C ₆ H ₄	OCH ₃	1.390	363
I.4.16	4-C ₆ H ₅ -C ₆ H ₄	OCH ₃	1.455	371
I.4.17	4-Br-C ₆ H ₄	OCH ₃	1.377	374
I.4.18	3-CF ₃ -C ₆ H ₄	OCH ₃	1.390	363
I.4.19	3-OCH ₃ -C ₆ H ₄	OCH ₃	1.288	325
I.4.20	3-OCH ₃ ,4-OCH ₃ -C ₆ H ₃	OCH ₃	1.221	355
I.4.21	3-Cl-C ₆ H ₄	OCH ₃	1.371	329
I.4.22	CH ₂ CH ₃	OCH ₃	1.214	247
I.4.23		OCH ₃	1.443	301
I.4.24		OCH ₃	1.442	301
I.4.25	(CH ₂) ₄ CH ₃	OCH ₃	1.441	289
I.4.26		OCH ₃	1.502	315
I.4.27		OCH ₃	1.567	329
I.4.28	3-F-C ₆ H ₄	OCH ₃	1.306	313
I.4.29	3-Cl,5-Cl-C ₆ H ₃	OCH ₃	1.466	363
I.4.30	2-OCH ₃ -C ₆ H ₄	OCH ₃	1.281	325

Таблица 10



№ спол.	R ³	X	ЧУ (хв)	m/z=[M+H] ⁺
I.4.31	2-OCH ₃ ,3-OCH ₃ ,4-OCH ₃ -C ₆ H ₂	OCH ₃	1.276	385
I.4.32	2-Cl-C ₆ H ₄	OCH ₃	1.331	329
I.4.33	3-OCH ₃ ,5-OCH ₃ -C ₆ H ₃	OCH ₃	1.305	355
I.4.34	(CH ₂) ₃ -C ₆ H ₄	OCH ₃	1.440	337
I.4.35	CH ₂ OCH ₃	OCH ₃	1.115	263
I.4.36	(CH ₂) ₂ CH(CH ₃) ₂	OCH ₃	1.437	289
I.4.37		OCH ₃	1.416	343
I.4.38		OCH ₃	1.517	327
I.4.39	(CH ₂) ₂ -4-OCH ₃ -C ₆ H ₄	OCH ₃	1.380	353
I.4.40	4-I-C ₆ H ₄	OCH ₃	1.412	421
I.4.41	3-F,5-F-C ₆ H ₃	OCH ₃	1.178	317
I.4.42	4-OCHF ₂ -C ₆ H ₄	OCH ₃	1.327	361
I.4.43		OCH ₃	1.247	277
I.4.44		OCH ₃	1.319	313
I.4.45	CH ₂ C(CH ₃) ₃	SCH ₃	1.487	305
I.4.46	2-F-C ₆ H ₄	SCH ₃	1.369	329
I.4.47	4-F-C ₆ H ₄	SCH ₃	1.375	329
I.4.48	2-CH ₃ -C ₆ H ₄	SCH ₃	1.398	325
I.4.49	OC(CH ₃) ₃	NH ₂	1.175	276
I.4.50	OC(CH ₃) ₃	SCH ₃	1.320	307
I.4.51	OCH(CH ₃) ₂	NH ₂	1.065	262
I.4.52	OCH(CH ₃) ₂	SCH ₃	1.378	293
I.4.53	OCH(CH ₃) ₂	SCH ₂ C ₆ H ₅	1.533	369
I.4.54	4-OCH ₂ CH ₃ -C ₆ H ₄	SCH ₃	1.421	355
I.4.55	4-O(CH ₂) ₃ CH ₃ -C ₆ H ₄	SCH ₃	1.538	383
I.4.56	2-OCHF ₂ -C ₆ H ₄	SCH ₃	1.362	377
I.4.57	4-NO ₂ -C ₆ H ₄	SCH ₃	1.365	356
I.4.58	NHCH(CH ₃) ₂	CONHCH(CH ₃) ₂	1.258	303
I.4.59	(CH ₂) ₂ CH ₃	SCH ₃	1.390	277
I.4.60		SCH ₃	1.338	275
I.4.61	2-Br-C ₆ H ₄	SCH ₃	1.416	390

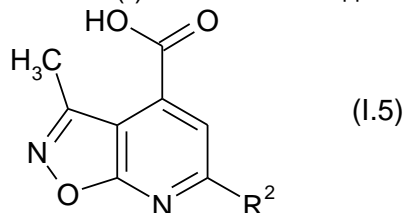
Таблиця 10



№ спол.	R ³	X	ЧУ (хв)	m/z=[M+H] ⁺
I.4.62	2-CF ₃ -C ₆ H ₄	SCH ₃	1.463	379
I.4.63		NH ₂	0.918	244
I.4.64	OCOC(CH ₃) ₃	OCH ₃	1.402	319

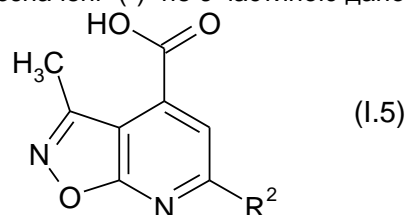
Таблиця 11

Сполуки, позначені "(-)" не є частиною даного винаходу



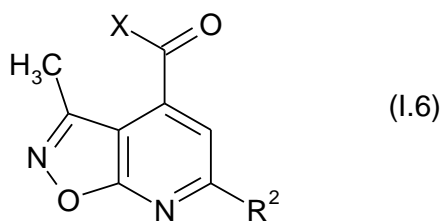
№ спол.	R ²	ЧУ (хв)	m/z=[M+H] ⁺
I.5.1 (-)	2-CF ₃ -C ₆ H ₄	3.539	323.0
I.5.2	CH ₃	1.941	193.0
I.5.3	CH(CH ₃) ₂	2.693	221.1
I.5.4	CH ₂ CH ₃	2.330	207.1
I.5.5 (-)	2-F-C ₆ H ₄	3.052	273.0
I.5.6 (-)	4-F-C ₆ H ₄	3.167	273.0
I.5.7		2.610	244.0
I.5.8 (-)	2-CH ₃ -C ₆ H ₄	3.314	269.1
I.5.9		3.186	258.0
I.5.10		3.280	272.1
I.5.11 (-)	4-CH ₃ O-C ₆ H ₄	3.065	285.1
I.5.12		1.575	256.1

Сполуки, позначені "(-)" не є частиною даного винаходу



№ спол.	R ²	ЧУ (хв)	m/z=[M+H] ⁺
I.5.13 (-)	4-CHF ₂ O-C ₆ H ₄	3.306	321.0
I.5.14		2.545	273.1
I.5.15		3.005	233.1
I.5.16 (-)	4-NO ₂ -C ₆ H ₄	3.125	300.1
I.5.17 (-)		3.015	299.0
I.5.18	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	2.960	235.1
I.5.19	(CH ₂) ₄ CH ₃	3.347	249.1
I.5.20		2.867	233.0
I.5.21		3.387	261.1
I.5.22		3.142	247.1
I.5.23	CH ₂ C ₆ H ₅	3.009	269.1
I.5.24	CF ₂ CF ₃	3.195	297.0
I.5.25		2.919	233.1
I.5.26	CH ₂ C(CH ₃) ₂ O CH ₃	2.484	233.1
I.5.27	C(CH ₃) ₃	3.069	235.1
I.5.28 (-)	3-Cl-C ₆ H ₄	3.469	289.0
I.5.29 (-)	2-Cl-C ₆ H ₄	3.116	289.0
I.5.30 (-)	4-C ₂ H ₅ O-C ₆ H ₄	3.358	299.1
I.5.31 (-)	2-CH ₃ ,4-CH ₃ -C ₆ H ₃	3.409	283.1
I.5.32 (-)	2-F,5-F-C ₆ H ₃	3.223	291.0
I.5.33 (-)	4-CH ₃ O-C ₆ H ₄	2.990	285.1
I.5.34	CF ₃	0.938	247

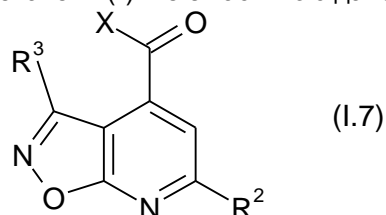
Таблица 12



№ спол.	R ²	X	ЧУ (хв)	m/z=[M+H] ⁺
I.6.1	CH ₂ C(CH ₃) ₂ OCH ₃	OCH ₃	2.041	270.1
I.6.2	C ₆ H ₅	OCH ₃	3.140	247.1
I.6.3		OCH ₃	3.624	247.1
I.6.4	CH ₂ C ₆ H ₅	OCH ₃	3.617	283.1
I.6.5		OCH ₃	3.860	261.1
I.6.6		OCH ₃	4.114	275.1
I.6.7		OCH ₃	3.585	247.1
I.6.8	(CH ₂) ₄ CH ₃	OCH ₃	4.044	263.1
I.6.9	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	OCH ₃	3.664	249.1
I.6.10		OCH ₃	3.712	247.1
I.6.11	C(CH ₃) ₃	OCH ₃	3.770	249.1
I.6.12	CH ₃	OCH ₃	2.643	207.1
I.6.13		OCH ₃	3.216	287.1
I.6.14	CH ₃	OCH(CH ₃)CONH ₂	2.082	264.1
I.6.15	CH ₃		2.855	300.1
I.6.16	CH(CH ₃) ₂	OCH ₃	3.427	235.1

Таблиця 13

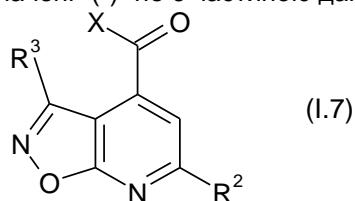
Сполуки, позначені "(-)" не є частиною даного винаходу



№ спол.	R ²	R ³	X	ЧУ (хв)	m/z=[M+H] ⁺
I.7.1 (-)	3,4-CH ₃ O-C ₆ H ₃	CH(CH ₃) ₂	OH	3.193	343.1
I.7.2		CH(CH ₃) ₂	OCH ₃	4.481	337.0
I.7.3 (-)	4-CH ₃ O-C ₆ H ₄	CH(CH ₃) ₂	OH	3.450	313.1
I.7.4 (-)	4-F-C ₆ H ₄	CH(CH ₃) ₂	OH	3.561	301.1
I.7.5 (-)	2-CH ₃ O,5-CH ₃ O-C ₆ H ₃	CH(CH ₃) ₂	OH	3.379	343.1
I.7.6 (-)	2-CH ₃ O,4-CH ₃ O-C ₆ H ₃	CH(CH ₃) ₂	OH	3.422	343.1
I.7.7 (-)	2-CH ₃ O-C ₆ H ₄	CH(CH ₃) ₂	OH	3.390	313.1
I.7.8		CH(CH ₃) ₂	OH	3.360	247.0
I.7.9 (-)	4-Cl-C ₆ H ₄	CH(CH ₃) ₂	OH	3.886	275.0
I.7.10	CH ₃	CH(CH ₃) ₂	OH	2.459	221.1
I.7.11		CH(CH ₃) ₂	OH	1.969	284.1
I.7.12			OH	2.936	271.1
I.7.13	CH ₃		OH	2.323	219.1
I.7.14 (-)	C ₆ H ₅		OH	3.371	281.1
I.7.15 (-)	2-F-C ₆ H ₄		OH	3.374	299.1
I.7.16 (-)	4-F-C ₆ H ₄		OH	3.480	299.1
I.7.17	CH ₂ CH ₃		OH	2.710	233.1
I.7.18 (-)	3-Cl,4-Cl-C ₆ H ₃	C ₆ H ₅	OH	4.190	385.0
I.7.19 (-)	3-NO ₂ -C ₆ H ₄	C ₆ H ₅	OH	4.122	376.1
I.7.20 (-)	4-CH ₃ -C ₆ H ₄	C ₆ H ₅	OH	3.750	331.1
I.7.21 (-)	3-CHF ₂ O-C ₆ H ₄	C ₆ H ₅	OH	3.679	383.1
I.7.22 (-)	2-F-C ₆ H ₄	C ₆ H ₅	OH	3.513	335.1
I.7.23 (-)	4-CHF ₂ O-C ₆ H ₄	C ₆ H ₅	OH	3.681	383.1
I.7.24 (-)	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	OH	3.520	317.0

Таблица 13

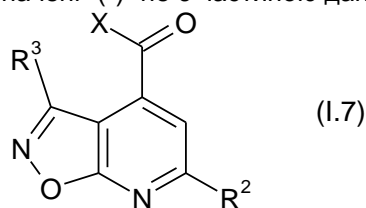
Сполуки, позначені "(-)" не є частиною даного винаходу



№ спол.	R ²	R ³	X	ЧУ (хв)	m/z=[M+H] ⁺
I.7.25 (-)		C ₆ H ₅	OH	3.455	361.1
I.7.26 (-)	2-Cl,4-Cl-C ₆ H ₃	C ₆ H ₅	OH	3.927	385.0
I.7.27	CH(CH ₃) ₃	C ₆ H ₅	OH	3.240	283.1
I.7.28		C ₆ H ₅	OH	2.818	335.1
I.7.29		C ₆ H ₅	OH	2.107	318.1
I.7.30		C ₆ H ₅	OH	3.114	307.1
I.7.31	CH ₃	C ₆ H ₅	OH	2.585	255.1
I.7.32 (-)	C ₆ H ₅		OH	3.295	307.0
I.7.33 (-)	4-CH ₃ O-C ₆ H ₄		OCH ₃	3.916	351.1
I.7.34 (-)	4-F-C ₆ H ₄		OH	3.398	325.0
I.7.35 (-)	2-CH ₃ O-C ₆ H ₄		OH	3.249	337.1
I.7.36 (-)	2-CH ₃ O,4-CH ₃ O-C ₆ H ₃		OH	3.312	367.1
I.7.37			OH	2.904	297.6
I.7.38	CH ₃		OH	2.298	245.0
I.7.39	CH ₃	(CH ₂) ₂ CH ₃	OH	2.514	221.1
I.7.40		(CH ₂) ₂ CH ₃	OH	3.119	231.0

Таблиця 13

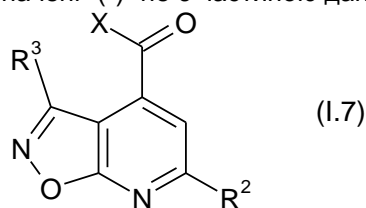
Сполуки, позначені "(-)" не є частиною даного винаходу



№ спол.	R ²	R ³	X	ЧУ (хв)	m/z=[M+H] ⁺
I.7.41	CH ₃	CH ₂ C(CH ₃) ₃	OH	2.933	249.1
I.7.42	C ₆ H ₅	2-F-C ₆ H ₄	OH	3.606	335.1
I.7.43	C ₆ H ₅	4-F-C ₆ H ₄	OH	3.605	335.1
I.7.44	C ₂ H ₅		OH	2.465	301.1
I.7.45	CH ₃		OH	2.147	287.1
I.7.46 (-)	CH ₃		OCH ₃	3.270	313.1
I.7.47	CH(CH ₃) ₂	3-CH ₃ O-C ₆ H ₄	OH	3.312	313.1
I.7.48	CH ₃	3-CH ₃ O-C ₆ H ₄	OH	2.699	285.1
I.7.49	CH ₃	4-CH ₃ O-C ₆ H ₄	OH	2.700	285.1
I.7.50	CH ₃		OH	2.297	287.1
I.7.51		CH ₃	OH	0.998	237
I.7.52			OH	1.097	263
I.7.53			OCH ₃	1.290	277
I.7.54			OCH ₃	1.283	295
I.7.55			OH	1.069	281

Таблиця 13

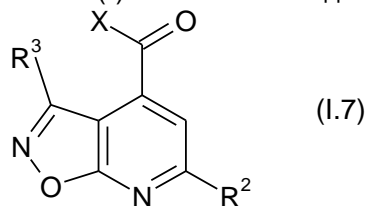
Сполуки, позначені "(-)" не є частиною даного винаходу



№ спол.	R ²	R ³	X	ЧУ (хв)	m/z=[M+H] ⁺
I.7.56		C ₆ H ₅	OH	1.119	317
I.7.57		4-OCH ₃ -C ₆ H ₄	OH	1.128	347
I.7.58		CH ₃	OH	0.985	256
I.7.59		4-CF ₃ -C ₆ H ₄	OH	1.281	367
I.7.60		4-Br-C ₆ H ₄	OH	1.251	378
I.7.61		4-OCH ₃ -C ₆ H ₄	OH	1.165	329
I.7.62		C ₆ H ₅	OH	1.155	299
I.7.63		(CH ₂) ₂ CH ₃	OH	1.158	265
I.7.64		C(CH ₃) ₃	OH	1.180	279
I.7.65		4-OCHF ₂ -C ₆ H ₄	OH	1.222	365
I.7.66		(CH ₂) ₃ CH ₃	OH	1.228	279
I.7.67		CH(CH ₃) ₂	OH	1.155	265
I.7.68		CH ₂ CH(CH ₃) ₂	OH	1.218	279

Таблиця 13

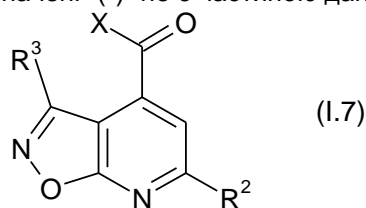
Сполуки, позначені "(-)" не є частиною даного винаходу



№ спол.	R ²	R ³	X	ЧУ (хв)	m/z=[M+H] ⁺
I.7.69		CH ₂ C(CH ₃) ₃	OH	1.263	293
I.7.70		(CH ₂) ₂ C ₆ H ₅	OH	1.283	327
I.7.71			OH	1.300	305
I.7.72			OH	1.243	291
I.7.73		CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ CH ₃	OH	1.284	293
I.7.74			SCH ₃	1.401	293
I.7.75			OH	1.198	277
I.7.76		CH ₂ C ₆ H ₅	OH	1.226	313
I.7.77		(CH ₂) ₂ CH(CH ₃) ₂	OH	1.295	293
I.7.78		4-OCH ₂ CH ₃ -C ₆ H ₄	OH	1.234	343
I.7.79			OH	1.185	277
I.7.80		C(CH ₃) ₂ CH ₂ CH ₃	OH	1.239	293
I.7.81		3-F,4-Br-C ₆ H ₃	OH	1.300	396

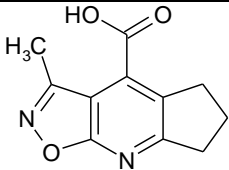
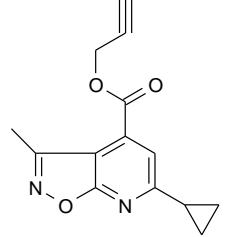
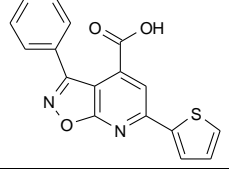
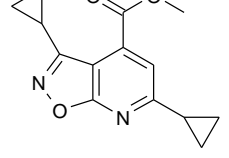
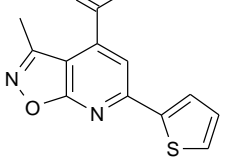
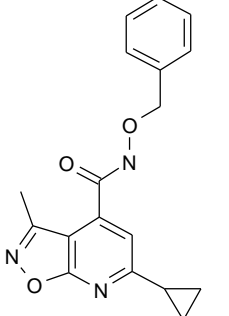
Таблиця 13

Сполуки, позначені "(-)" не є частиною даного винаходу



№ спол.	R ²	R ³	X	ЧУ (хв)	m/z=[M+H] ⁺
I.7.82			OH	1.198	277
I.7.83		3-F,4-F-C ₆ H ₃	OH	1.230	335
I.7.84		OCH(CH ₃) ₂	NH ₂	1.103	280
I.7.85		OCH(CH ₃) ₂	OH	1.152	281
I.7.86		OCH(CH ₃) ₂	SCH ₃	1.431	311
I.7.87		OCH(CH ₃) ₂	SCH ₂ C ₆ H ₅	1.573	387
I.7.88		OCH(CH ₃) ₂	SC(CH ₃) ₃	1.593	353
I.7.89		OCH(CH ₃) ₂	OCH ₂ OCH ₃	1.160	281 [M-CH ₂ OCH ₃ +H] ⁺
I.7.90		CH ₂ CH ₃	OH	3.002	251

Таблиця 14

№ спол.		ЧУ (хв)	m/z=[M+H] ⁺
I.8.1		2.119	219.1
I.8.2		3.12	324.1
I.8.3		2.93	261.0
I.8.4		3.60	259.1
I.8.5		3.37	323.0
I.8.6		3.44	257.1

Приклади застосування

Гербіцидну дію ізоксазоло[5,4-b]піридинів формули I можна показати за допомогою наведених нижче дослідів у теплиці:

Використовуваними ємностями для культур служили пластикові горщики з супіском з приблизно 3,0 % гумусу як субстрату. Насіння тестованих рослин були висіяні окремо відповідно до видів.

При досховій обробці суспендовані або емульговані в воді діючі речовини були нанесені одразу після висівання за допомогою тонко розподілювальних розпилювачів. Ємності трохи зрошували, щоб сприяти проростанню й росту, і потім накрили прозорими пластиковими ковпаками, до тих пір, поки рослини не вирости. Це покриття сприяло рівномірному проростанню тестованих рослин, оскільки вони не були ушкоджені діючими речовинами.

З метою післясходової обробки досліджувані рослини залежно від форми росту спочатку підростають до висоти від 3 до 15 см і потім їх обробляють суспендованими або емульгованими в воді діючими речовинами. Досліджувані рослини або безпосередньо висаджують і вирощують в таких самих ємностях, або спочатку вони ростуть окремо як паростки і за декілька днів до обробки їх пересаджують в дослідні ємності.

Рослини витримували відповідно до видів при температурі від 10 - 25 °C або 20 - 35 °C. Період експерименту складав від 2 до 4 тижнів. Протягом цього часу за рослинами доглядали, і оцінювали їх реакцію на окремі обробки.

Оцінювання проводилося за шкалою від 0 до 100. При цьому 100 означає, що рослина не зійшла або повне знищення принаймні надземних частин і 0 означає відсутність ушкодження або нормальну динаміку росту. Гарна гербіцидна активність представлена значеннями від принаймні 80 і дуже гарна гербіцидна активність представлена значеннями принаймні від 90.

Використовувані в дослідженнях в теплиці рослини представлені наступними видами:

Таблиця

Код Bayer	Наукова назва	Загальна назва
ABUTH	Abutilon theophrasti	абутилон Теофраста
AGSST	Agrostis stolonifera L.	мітлиця повзуча
ALOMY	Alopecurus myosuroides	лисохвіст мишохвостиковий
AMARE	Amaranthus retroflexus L.	щириця звичайна
AVEFA	Avena fatua	вівсюг
CHEAL	Chenopodium album	лобода біла
LOLMU	Lolium multiflorum	пажитниця багатоквітова
MATIN	Matricaria inodora	ромашка непахуча
SETFA	Setaria faberi	мишій Фабера
POLCO	Polygonum convolvulus	гірчак березковидний

Таблиця 15

Післясходова обробка Abutilon theophrasti (абутилон Теофраста)

№ спол.	Норма витрати [кг/га]	Ураження [%]
I.5.4	3.0	85
I.2.1	2.0	95
I.1.6	3.0	100
I.1.35	3.0	90
I.2.2	2.0	100
I.2.3	3.0	100
I.2.5	3.0	100
I.2.6	3.0	100
I.7.31	3.0	98
I.2.7	3.0	100
I.2.8	3.0	100
I.7.17	3.0	100
I.1.61	3.0	100
I.1.62	2.0	100
I.8.2	3.0	100
I.1.66	3.0	100
I.1.67	3.0	100
I.1.68	3.0	100
I.1.69	3.0	100
I.1.70	3.0	100
I.1.75	3.0	100
I.8.1	3.0	100
I.7.41	3.0	100
I.7.38	3.0	100
I.7.13	3.0	100
I.7.10	3.0	100

Таблиця 15

Післясходова обробка *Abutilon theophrasti* (абутилон Теофраста)

№ спол.	Норма витрати [кг/га]	Ураження [%]
I.7.39	3.0	100
I.2.10	3.0	90
I.4.5	3.0	85
I.2.11	3.0	100
I.4.4	3.0	100
I.2.12	3.0	100
I.2.13	2.0	100
I.2.14	3.0	100
I.2.15	3.0	85
I.2.19	3.0	100
I.2.16	3.0	85
I.2.17	3.0	100
I.2.18	3.0	100
I.2.20	3.0	100
I.2.21	3.0	100
I.2.22	3.0	100
I.2.24	3.0	100
I.2.26	3.0	100
I.2.27	3.0	100
I.4.25	3.0	100
I.4.27	3.0	100
I.2.30	3.0	100
I.2.31	3.0	100
I.2.37	3.0	90
I.2.38	3.0	100
I.2.39	3.0	100
I.2.40	3.0	100
I.2.41	3.0	100
I.2.42	3.0	100
I.2.43	3.0	100
I.2.44	3.0	100

Таблиця 16

Післясходова обробка *Agrostis stolonifera* L. (мітлиця повзуча)

№ спол.	Норма витрати [кг/га]	Ураження [%]
I.8.6	2.0	80
I.1.10	2.0	90
I.1.31	2.0	85
I.1.39	2.0	90
I.1.49	2.0	85

Таблиця 17

Післясходова обробка *Alopecurus myosuroides* (лисохвіст мишохвостиковий)

№ спол.	Норма витрати [кг/га]	Ураження [%]
I.1.43	1.0	80

Таблиця 18

Післясходова обробка *Amaranthus retroflexus* L. (щириця звичайна)

№ спол.	Норма витрати [кг/га]	Ураження [%]
I.8.4	1.0	100
I.1.64	0.5	100
I.1.65	1.0	100
I.7.53	1.0	100
I.2.45	1.0	98
I.1.79	1.0	98
I.1.80	1.0	98
I.1.81	1.0	98
I.1.82	1.0	98
I.2.46	1.0	98
I.1.83	1.0	100
I.2.50	1.0	100
I.2.51	1.0	100
I.2.52	1.0	100
I.2.53	1.0	100
I.2.54	1.0	100
I.2.55	1.0	100
I.2.56	1.0	100
I.2.57	1.0	100
I.2.58	1.0	100
I.4.45	1.0	100
I.4.47	1.0	95
I.7.55	1.0	100
I.7.56	1.0	80
I.7.57	1.0	80
I.2.61	1.0	100
I.2.62	1.0	100
I.2.63	1.0	100
I.4.59	1.0	95
I.4.60	0.927	100
I.2.64	1.0	100
I.2.65	1.0	100
I.7.59	1.0	100
I.7.60	1.0	100
I.7.61	1.0	100
I.7.62	1.0	100
I.2.66	1.0	100
I.7.63	1.0	100
I.7.64	1.0	100
I.7.65	1.0	100
I.7.90	1.0	100
I.2.71	1.0	100
I.4.63	1.0	100
I.7.68	1.0	100
I.7.69	1.0	100

Таблиця 19

Післясходова обробка *Avena fatua* (вівсюг)

№ спол.	Норма витрати [кг/га]	Ураження [%]
I.1.35	3.0	85
I.1.39	2.0	85
I.1.43	1.0	90
I.1.61	3.0	100
I.1.63	3.0	80
I.8.2	3.0	90
I.1.66	3.0	80
I.1.67	3.0	95

Таблиця 20

Післясходова обробка *Chenopodium album* (лобода біла)

№ спол.	Норма витрати [кг/га]	Ураження [%]
I.1.21	1.0	100
I.8.4	1.0	100
I.1.65	1.0	100
I.7.53	1.0	90
I.2.45	1.0	98
I.1.79	1.0	85
I.1.80	1.0	98
I.1.81	1.0	98
I.1.82	1.0	98
I.2.46	1.0	98
I.1.83	1.0	100
I.2.50	1.0	100
I.2.51	1.0	100
I.2.52	1.0	98
I.2.53	1.0	100
I.2.54	1.0	100
I.2.55	1.0	100
I.2.56	1.0	100
I.2.57	1.0	100
I.2.58	1.0	100
I.7.55	1.0	100
I.7.56	1.0	90
I.7.57	1.0	98
I.7.58	1.0	95
I.2.59	1.0	95
I.2.61	1.0	100
I.2.62	1.0	100
I.2.63	1.0	100
I.4.59	1.0	100
I.4.60	0.927	100
I.7.61	1.0	100
I.7.62	1.0	100
I.2.66	1.0	100
I.7.63	1.0	100
I.7.64	1.0	100
I.7.65	1.0	100
I.7.90	1.0	100
I.7.66	1.0	100

Таблиця 20

Післясходова обробка *Chenopodium album* (лобода біла)

№ спол.	Норма витрати [кг/га]	Ураження [%]
I.7.67	1.0	100
I.2.69	1.0	95
I.2.71	1.0	100
I.4.63	1.0	100
I.7.68	1.0	100

Таблиця 21

Післясходова обробка *Lolium multiflorum* (пажитниця багатоквіткова)

№ спол.	Норма витрати [кг/га]	Ураження [%]
I.1.21	1.0	100

Таблиця 22

Післясходова обробка *Matricaria inodora* (ромашка непахуча)

№ спол.	Норма витрати [кг/га]	Ураження [%]
I.7.34	2.0	85
I.1.2	2.0	90
I.1.10	2.0	85
I.1.24	2.0	100
I.1.31	2.0	95
I.1.49	2.0	98
I.2.4	2.0	98

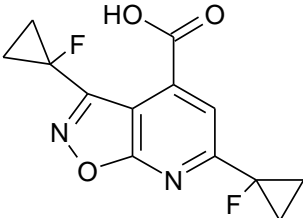
Таблиця 23

Післясходова обробка *Setaria faberi* (мишій Фабера)

№ спол.	Норма витрати [кг/га]	Ураження [%]
I.7.32	3.0	80
I.8.6	2.0	80
I.2.1	2.0	100
I.7.4	3.0	80
I.7.7	3.0	85
I.8.5	3.0	80
I.5.8	3.0	85
I.1.6	3.0	95
I.2.2	2.0	90
I.2.3	3.0	85
I.2.5	3.0	80
I.2.6	3.0	95
I.8.3	3.0	85
I.2.7	3.0	100
I.5.13	3.0	95
I.2.8	3.0	80
I.7.17	3.0	90
I.7.9	3.0	85
I.4.2	3.0	85
I.4.6	3.0	80
I.2.10	3.0	85
I.2.11	3.0	100

Таблиця 23

Післясходова обробка *Setaria faberi* (мишій Фабера)

№ спол.	Норма витрати [кг/га]	Ураження [%]
I.2.12	3.0	90
I.4.3	3.0	90
I.2.13	2.0	95
I.2.14	3.0	90
I.2.15	3.0	100
I.2.19	3.0	85
I.2.16	3.0	100
I.2.20	3.0	95
I.4.19	3.0	100
I.2.25	3.0	95
I.7.51	3.0	90
	3.0	98

Таблиця 24

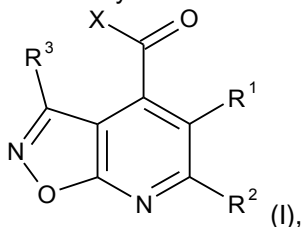
Післясходова обробка *Polygonum convolvulus* (гірчак березковидний)

№ спол.	Норма витрати [кг/га]	Ураження [%]
I.7.58	1.0	90
I.2.59	1.0	90
I.2.64	1.0	80
I.2.65	1.0	100
I.7.59	1.0	100
I.7.60	1.0	100
I.7.66	1.0	100
I.7.67	1.0	100
I.2.69	1.0	85
I.7.69	1.0	100

ФОРМУЛА ВИНАХОДУ

5

1. Застосування ізоксазоло[5,4-b]піридинових сполук формули I



або застосованих в сільському господарстві солей ізоксазоло[5,4-b]піридинових сполук формули I як гербіцидів,

10

де у формулі I, змінні є такими, як визначені нижче:

R¹ означає водень, галоген, C₁-C₆-алкіл, C₁-C₆-галоалкіл;

R² означає водень, C₁-C₆-алкіл, C₁-C₆-галоалкіл, C₁-C₆-гідроксіалкіл, C₃-C₆-циклоалкіл, C₃-C₆-галоциклоалкіл, C₂-C₆-алкеніл, C₂-C₆-алкініл;

- R^3 означає водень, галоген, гідрокси, C_1 - C_6 -алкіл, C_1 - C_6 -галоалкіл, C_1 - C_6 -гідроксіалкіл, C_1 - C_6 -алкокси- C_1 - C_6 -алкіл, C_1 - C_6 -галоалкокси- C_1 - C_6 -алкіл, C_3 - C_6 -циклоалкіл- C_1 - C_6 -алкіл, C_3 - C_6 -галоциклоалкіл- C_1 - C_6 -алкіл, C_3 - C_6 -циклоалкіл, C_3 - C_6 -галоциклоалкіл, C_1 - C_4 -алкіл- C_3 - C_6 -циклоалкіл, C_3 - C_6 -циклоалкеніл, C_3 - C_6 -галоциклоалкеніл, феніл- C_1 - C_6 -алкіл, гетероцикліл- C_1 - C_6 -алкіл, C_2 - C_6 -алкеніл, C_2 - C_6 -галоалкеніл, C_1 - C_6 -алкініл, C_2 - C_6 -галоалкініл, C_1 - C_6 -алкокси, C_1 - C_6 -галоалкокси, C_1 - C_6 -алкілтіо, C_1 - C_6 -галоалкілтіо, аміно, C_1 - C_6 -алкіламіно, N,N-ді-(C_1 - C_6)-алкіламіно, гетероцикліл, феніл; де гетероцикліл означає 5- або 6-членне насичене, частково ненасичене або ароматичне моноциклічне кільце, яке містить 1, 2, 3 або 4 гетероатоми з групи, що складається з O, N і S, як кільцеві члени; і де гетероциклільні і фенільні частини R^3 можуть бути незаміщеними або заміщеними одним або декількома радикалами, вибраними з галогену, гідрокси, нітро, ціано, C_1 - C_4 -алкілу, C_1 - C_4 -галоалкілу, C_1 - C_4 -алкокси- C_1 - C_4 -алкілу, C_3 - C_6 -циклоалкілу, C_2 - C_6 -алкенілу, C_2 - C_6 -алкінілу, C_1 - C_4 -алкокси, C_1 - C_4 -галоалкокси, C_1 - C_4 -алкоксикарбонілу, C_1 - C_4 -алкілтіо, C_1 - C_4 -алкілсульфінілу, C_1 - C_4 -алкілсульфонілу, аміно, C_1 - C_4 -алкіламіно, N,N-ді-(C_1 - C_4)-алкіламіно, гетероциклілу, фенілу;
- X означає OR^4 , SR^5 ; NR^6R^7 ;
- R^4 , R^5 означають водень, C_1 - C_6 -алкіл, C_1 - C_6 -галоалкіл, C_1 - C_6 -гідроксіалкіл, C_1 - C_6 -ціаноалкіл, C_1 - C_6 -алкокси- C_1 - C_6 -алкіл, C_1 - C_6 -алкокси- C_1 - C_6 -алкокси- C_1 - C_6 -алкіл, C_1 - C_6 -галоалкокси- C_1 - C_6 -алкіл, C_2 - C_6 -алкенілокси- C_1 - C_6 -алкіл, C_2 - C_6 -галоалкенілокси- C_1 - C_6 -алкіл, C_1 - C_6 -алкоксикарбоніл- C_1 - C_6 -алкіл, амінокарбоніл- C_1 - C_6 -алкіл, C_1 - C_6 -алкіл-амінокарбоніл- C_1 - C_6 -алкіл, N,N-ді-(C_1 - C_6 -алкіл)-амінокарбоніл- C_1 - C_6 -алкіл, [N-(C_3 - C_6 -циклоалкіл- C_1 - C_6 -алкіл), N-(C_1 - C_6 -алкіл)]-амінокарбоніл- C_1 - C_6 -алкіл, C_1 - C_6 -алкокси-амінокарбоніл- C_1 - C_6 -алкіл, C_2 - C_6 -алкеніл, C_2 - C_6 -галоалкеніл, C_2 - C_6 -алкініл- C_2 - C_6 -алкеніл, C_2 - C_6 -алкініл, C_2 - C_6 -галоалкініл, гетероцикліл, феніл, гетероциклілкарбоніл, фенілкарбоніл, гетероциклілкарбоніл- C_1 - C_6 -алкіл, фенілкарбоніл- C_1 - C_6 -алкіл, гетероцикліл- C_1 - C_6 -алкіл, феніл- C_1 - C_6 -алкіл; де гетероцикліл означає 5- або 6-членне насичене, частково ненасичене або ароматичне моноциклічне кільце, яке містить 1, 2, 3 або 4 гетероатоми з групи, що складається з O, N і S, як кільцеві члени; і де фенільні і гетероциклільні частини R^4 і R^5 можуть бути незаміщеними або заміщеними одним або декількома радикалами, вибраними з галогену, C_1 - C_4 -алкілу, C_1 - C_4 -галоалкілу, C_1 - C_4 -алкокси, C_1 - C_4 -галоалкокси, C_1 - C_4 -алкоксикарбонілу, гетероциклілу, фенілу;
- R^6 , R^7 означає водень, C_1 - C_6 -алкіл, C_1 - C_6 -галоалкіл, C_2 - C_6 -алкеніл, C_2 - C_6 -алкініл, C_1 - C_6 -алкокси, феніл- C_1 - C_6 -алкокси, феніл, феніл, заміщений галогеном, C_3 - C_6 -циклоалкіл, C_3 - C_6 -галоциклоалкіл, SO_2R^8 ;
- R^8 означає C_1 - C_6 -алкіл, C_1 - C_6 -галоалкіл, C_2 - C_6 -алкеніл, C_2 - C_6 -алкініл, C_3 - C_6 -циклоалкіл, C_3 - C_6 -галоциклоалкіл, феніл; де фенільна частина R^8 може бути незаміщеною або заміщеною одним або декількома радикалами, вибраними з галогену, C_1 - C_4 -алкілу, C_1 - C_4 -галоалкілу, C_1 - C_4 -алкокси, C_1 - C_4 -галоалкокси, C_1 - C_4 -алкоксикарбонілу, гетероциклілу, фенілу; де гетероцикліл означає 5- або 6-членне насичене, частково ненасичене або ароматичне моноциклічне кільце, яке містить 1, 2, 3 або 4 гетероатоми з групи, що складається з O, N і S, як кільцеві члени.
2. Застосування за п. 1, де в формулі I
- R^1 означає водень;
- R^2 означає водень, C_1 - C_6 -алкіл, C_1 - C_6 -галоалкіл, C_1 - C_6 -гідроксіалкіл, C_3 - C_6 -циклоалкіл, C_3 - C_6 -галоциклоалкіл, C_2 - C_6 -алкеніл, C_2 - C_6 -алкініл;
- R^3 означає C_1 - C_6 -алкіл, C_1 - C_6 -галоалкіл, C_3 - C_6 -циклоалкіл- C_1 - C_6 -алкіл, C_3 - C_6 -галоциклоалкіл- C_1 - C_6 -алкіл, C_3 - C_6 -циклоалкіл, C_3 - C_6 -галоциклоалкіл, C_1 - C_4 -алкіл- C_3 - C_6 -циклоалкіл, C_1 - C_6 -алкокси, C_1 - C_6 -галоалкокси, феніл; де фенільна частина R^3 може бути незаміщеною або заміщеною одним або декількома радикалами, вибраними з галогену, гідрокси, нітро, ціано, C_1 - C_4 -алкілу, C_1 - C_4 -галоалкілу, C_1 - C_4 -алкокси- C_1 - C_4 -алкілу, C_3 - C_6 -циклоалкілу, C_2 - C_6 -алкенілу, C_2 - C_6 -алкінілу, C_1 - C_4 -алкокси, C_1 - C_4 -галоалкокси, C_1 - C_4 -алкоксикарбонілу, C_1 - C_4 -алкілтіо, C_1 - C_4 -алкілсульфінілу, C_1 - C_4 -алкілсульфонілу, аміно, C_1 - C_4 -алкіламіно, N, N-ді-(C_1 - C_4)-алкіламіно, гетероциклілу, фенілу; де гетероцикліл означає 5- або 6-членне насичене, частково ненасичене або ароматичне моноциклічне кільце, яке містить 1, 2, 3 або 4 гетероатоми з групи, що складається з O, N і S, як кільцеві члени;
- X означає OR^4 , SR^5 .
3. Застосування за п. 1 або 2, де в формулі I
- X означає OR^4 ;
- R^4 означає водень, C_1 - C_6 -алкіл, C_1 - C_6 -галоалкіл, C_1 - C_6 -ціаноалкіл, C_1 - C_6 -алкокси- C_1 - C_6 -алкіл, C_1 - C_6 -галоалкокси- C_1 - C_6 -алкіл, C_2 - C_6 -алкеніл, C_2 - C_6 -галоалкеніл, C_2 - C_6 -алкініл.
4. Застосування за п. 3, де в формулі I
- R^4 означає водень.
5. Застосування за п. 4, де в формулі I

R¹ означає водень;

R² означає C₃-C₆-циклоалкіл, C₃-C₆-галоциклоалкіл;

R³ означає C₁-C₆-алкіл, C₁-C₆-галоалкіл, C₃-C₆-циклоалкіл-C₁-C₆-алкіл, C₃-C₆-галоциклоалкіл-C₁-C₆-алкіл, C₃-C₆-циклоалкіл, C₃-C₆-галоциклоалкіл, C₁-C₄-алкіл-C₃-C₆-циклоалкіл, C₁-C₆-алкокси, C₁-C₆-галоалкокси.

6. Застосування за п. 4, де в формулі I

R¹ означає водень;

R² означає циклопропіл;

R³ означає циклопропіл, 1-метилетил або 4-дифторметоксифеніл.

7. Застосування за п. 1 або 2, де в формулі I

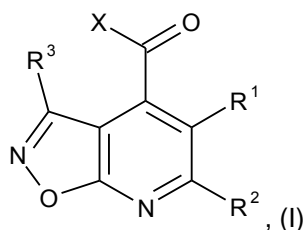
X означає SR⁵;

R⁵ означає водень, C₁-C₆-алкіл, C₁-C₆-галоалкіл, феніл-C₁-C₆-алкіл.

8. Застосування за п. 6, де в формулі I

R⁵ означає C₁-C₆-алкіл, феніл-C₁-C₆-алкіл.

9. Ізоксазоло[5,4-b]піридинові сполуки формули I



де

R¹ означає водень, галоген, C₁-C₆-алкіл, C₁-C₆-галоалкіл;

R² означає водень, C₁-C₆-алкіл, C₁-C₆-галоалкіл, C₁-C₆-гідроксіалкіл, C₃-C₆-циклоалкіл, C₃-C₆-галоциклоалкіл, C₂-C₆-алкеніл, C₂-C₆-алкініл;

R³ водень, галоген, гідрокси, C₁-C₆-алкіл, C₁-C₆-галоалкіл, C₁-C₆-гідроксіалкіл, C₁-C₆-алкокси-C₁-C₆-алкіл, C₁-C₆-галоалкокси-C₁-C₆-алкіл, C₃-C₆-циклоалкіл-C₁-C₆-алкіл, C₃-C₆-галоциклоалкіл-C₁-C₆-алкіл, C₃-C₆-циклоалкіл, C₃-C₆-галоциклоалкіл, C₁-C₄-алкіл-C₃-C₆-циклоалкіл, C₃-C₆-циклоалкеніл, C₃-C₆-галоциклоалкеніл, феніл-C₁-C₆-алкіл, гетероцикліл-C₁-C₆-алкіл, C₂-C₆-алкеніл, C₂-C₆-галоалкеніл, C₂-C₆-алкініл, C₂-C₆-галоалкініл, C₁-C₆-алкокси, C₁-C₆-галоалкокси, C₁-C₆-алкілтіо, C₁-C₆-галоалкілтіо, аміно, C₁-C₆-алкіламіно, N,N-ді-(C₁-C₆)-алкіламіно, гетероцикліл, феніл; де гетероцикліл означає 5- або 6-членне насичене, частково ненасичене або ароматичне моноциклічне кільце, яке містить 1, 2, 3 або 4 гетероатоми з групи, що складається з O, N і S, як кільцеві члени; і де гетероциклільні і фенільні частини R³ можуть бути незаміщеними або заміщеними одним або декількома радикалами, вибраними з галогену, гідрокси, нітро, ціано, C₁-C₄-алкілу, C₁-C₄-галоалкілу, C₁-C₄-алкокси-C₁-C₄-алкілу, C₃-C₆-циклоалкілу, C₂-C₆-алкенілу, C₂-C₆-алкінілу, C₁-C₄-алкокси, C₁-C₄-галоалкокси, C₁-C₄-алкоксикарбонілу, C₁-C₄-алкілтіо, C₁-C₄-алкілсульфінілу, C₁-C₄-алкілсульфонілу, аміно, C₁-C₄-алкіламіно, N,N-ді-(C₁-C₄)-алкіламіно, гетероциклілу, фенілу;

X означає OR⁴;

R⁴ означає водень, C₁-C₆-алкіл, C₁-C₆-галоалкіл, C₁-C₆-ціаноалкіл, C₁-C₆-алкокси-C₁-C₆-алкіл, C₁-C₆-галоалкокси-C₁-C₆-алкіл, C₂-C₆-алкеніл, C₂-C₆-галоалкеніл, C₂-C₆-алкініл;

і їх застосовні в сільському господарстві солі,

за винятком ізоксазоло[5,4-b]піридинових сполук формули I, де

R¹ означає водень, R² означає циклопропіл, R³ означає CH₃, X означає OR⁴ і R⁴ означає водень, C₁-C₆-алкіл, ціанометил, або 2-C1-2-пропен-1-іл; і

R¹ означає водень, R² означає циклопропіл, R³ означає CH₂C(CH₃)₃, (CH₂)₂CH₃, CH(CH₃)₂, C(CH₃)₃, циклопропіл, феніл, 2-F-феніл, 4-F-феніл, 4-метилфеніл, 4-метоксифеніл, 2-фураніл, 1,3,5-триметил-1H-піразол-4-іл, 1-етил-5-метил-1H-піразол-4-іл, X означає OR⁴ і R⁴ означає водень, метил або етил; і

R¹ означає водень, R² означає метил, R³ означає CH₃, CH₂C(CH₃)₃, (CH₂)₂CH₃, CH(CH₃)₂, C(CH₃)₃, циклопропіл, феніл, 4-метилфеніл, 4-метоксифеніл, 3-метоксифеніл, 4-фторфеніл, 3,4-дихлорфеніл, 2-фураніл, 1,3,5-триметил-1H-піразол-4-іл, 1-етил-5-метил-1H-піразол-4-іл, X означає OR⁴ і R⁴ означає водень, метил або етил; і

R¹ означає водень, R² означає етил, R³ означає CH₃, (CH₂)₂CH₃, CH(CH₃)₂, CH₂C(CH₃)₃, циклопропіл, 1,3,5-триметил-1H-піразол-4-іл, X означає OR⁴ і R⁴ означає водень, метил або етил; і

R¹ означає водень, R² означає ізопропіл, R³ означає CH₃, CH₂C(CH₃)₃, (CH₂)₂CH₃, CH(CH₃)₂, C(CH₃)₃, циклопропіл, феніл, 3-метоксифеніл, 2-фураніл; X означає OR⁴ і R⁴ означає водень, метил або етил; та

метил, R^1 означає хлор, R^2 означає метил, циклопропіл, R^3 означає метил, X означає OR^4 і R^4 означає водень або метил.

10. Ізоксазоло[5,4-*b*]піридинові сполуки формули I за п. 9, де

R^1 означає водень;

R^2 означає циклопропіл:

R³ означає водень, галоген, гідрокси, C₁-C₆-алкіл, C₁-C₆-галоалкіл, C₁-C₆-гідроксіалкіл, C₁-C₆-алкокси-C₁-C₆-алкіл, C₁-C₆-галоалкокси-C₁-C₆-алкіл, C₃-C₆-циклоалкіл-C₁-C₆-алкіл, C₃-C₆-галоциклоалкіл-C₁-C₆-алкіл, C₃-C₆-циклоалкіл, C₃-C₆-галоциклоалкіл, C₁-C₄-алкіл-C₃-C₆-циклоалкіл, C₃-C₆-циклоалкеніл, C₃-C₆-галоциклоалкеніл, феніл-C₁-C₄-алкіл, гетероцикліл-C₁-C₆-алкіл, C₂-C₆-алкеніл, C₂-C₆-галоалкеніл, C₂-C₆-алкініл, C₂-C₆-галоалкініл, C₁-C₆-алкокси, C₁-C₆-галоалкокси, C₁-C₆-алкілтіо, C₁-C₆-галоалкілтіо, аміно, C₁-C₆-алкіламіно, N,N-ді-(C₁-C₆)-алкіламіно, гетероцикліл, феніл; де гетероцикліл означає 5- або 6-членне насичене, частково ненасичене або ароматичне моноциклічне кільце, яке містить 1, 2, 3 або 4 гетероатоми з групи, що складається з O, N і S, як кільцеві члени; і де гетероциклільні і фенільні частини R³ можуть бути незаміщеними або заміщеними одним або декількома радикалами, вибраними з галогену, гідрокси, нітро, ціано, C₁-C₄-алкілу, C₁-C₄-галоалкілу, C₁-C₄-алкокси-C₁-C₄-алкілу, C₃-C₆-циклоалкілу, C₂-C₆-алкенілу, C₂-C₆-алкінілу, C₁-C₄-алкокси, C₁-C₄-галоалкокси, C₁-C₄-алкоксикарбонілу, C₁-C₄-алкілтіо, C₁-C₄-алкілсульфінілу, C₁-C₄-алкілсульфонілу, аміно, C₁-C₄-алкіламіно, N,N-ді-(C₁-C₄)-алкіламіно, гетероциклілу, фенілу;

X означає OR^4 :

R^4 означає водень, C_1 - C_6 -алкіл, C_1 - C_6 -галоалкіл, C_1 - C_6 -ціаноалкіл, C_1 - C_6 -алкокси- C_1 - C_6 -алкіл, C_1 - C_6 -галоалкокси- C_1 - C_6 -алкіл, C_2 - C_6 -алкеніл, C_2 - C_6 -галоалкеніл, C_2 - C_6 -алкініл;

і їх застосовні в сільському господарстві солі;

за винятком наступних сполук:

ізоксазоло[5,4-*b*]піридин-4-карбонова кислота, 6-циклопропіл-3-(2-фторфеніл)-метиловий ефір;

ізоксазол[5,4-*b*]піридин-4-карбонова кислота, 6-циклопропіл-3-метил-2-хлор-2-пропен-1-іловий ефір:

ізоксазоло[5,4-b]піридин-4-карбонова кислота, 3,6-дициклопропіл;

ізоксазол[5,4-*b*]піридин-4-карбонова кислота, 6-циклопропіл-3-(1-етил-5-метил-1Н-піразол-4-іл)-метиловий ефір;

ізоксазоло[5,4-*b*]піридин-4-карбонова кислота, 6-циклопропіл-3-(4-фторфеніл)-метиловий ефір;

ізоксазоло[5,4-*b*]піридин-4-карбонова кислота, 6-циклопропіл-3-(4-метоксифеніл)-метиловий ефір:

ізоксазоло[5,4-*b*]піридин-4-карбонова кислота, 6-циклопропіл-3-(4-метилфеніл)-метиловий ефір;

ізоксазоло[5,4-*b*]піридин-4-карбонова кислота, 6-циклопропіл-3-(1,3,5-триметил-1Н-піразол-4-іл);

ізоксазоло[5,4-*b*]піридин-4-карбонова кислота, 6-циклопропіл-3-метил-1-метилетиловий ефір;

ізоксазоло[5,4-b]піридин-4-карбонова кислота, 6-циклопропіл-3-метил-ціанометилловий ефір;

ізоксазоло[5,4-*b*]піридин-4-карбонова кислота, 6-циклопропіл-3-(1,1-диметилетил);

ізоксазоло[5,4-*b*]піридин-4-карбонова кислота, 6-циклопропіл-3-фенілметилловий ефір;

ізоксазол[5,4-b]піридин-4-карбонова кислота, 6-циклопропіл-3-(4-метоксифеніл);

ізоксазоло[5,4-*b*]піридин-4-карбонова кислота, 3,6-дициклопропіл-метиловий ефір;

ізоксазол[5,4-*b*]піридин-4-карбонова кислота, 3,6-дциклопропіл-етилловий ефір;
ізоксазол[5,4-*b*]піридин-4-карбонова кислота, 6-циклопропіл-3-(1,3,5-триметил-1Н-піразол-4-іл)-
метилловий ефір;

ізоксазоло[5,4-*b*]піридин-4-карбонова кислота, 6-циклопропіл-3-(2,2-диметилпропіл);

ізоксазол[5,4-*b*]піридин-4-карбонова кислота, 6-циклопропіл-3-(2,2-диметилпропіл)-метиловий ефір;

ізоксазол[5,4-*b*]піридин-4-карбонова кислота, 6-циклопропіл-3-(2,2-диметилпропіл)-етилловий ефір;

ізоксазоло[5,4-b]піридин-4-карбонова кислота, 6-циклопропіл-3-пропіл;

ізоксазоло[5,4-*b*]піридин-4-карбонова кислота, 6-циклопропіл-3-пропіл-метиловий ефір;

ізоксазоло[5,4-b]піридин-4-карбонова кислота, 6-циклопропіл-3-пропіл-етилловий ефір;

ізоксазоло[5,4-b]піридин-4-карбонова кислота, 6-циклопропіл-3-(2-фураніл);

ізоксазоло[5,4-*b*]піридин-4-карбонова кислота, 6-циклопропіл-3-(2-фураніл)-метиловий ефір;

ізоксазоло[5,4-*b*]піридин-4-карбонова кислота, 6-циклопропіл-3-(2-фураніл)-етилловий ефір;

ізоксазоло[5,4-*b*]піридин-4-карбонова кислота, 6-циклопропіл-3-феніл;

ізоксазоло[5,4-*b*]піридин-4-карбонова кислота, 6-циклопропіл-3-феніл-етилловий ефір;

- ізоксазоло[5,4-*b*]піридин-4-карбонова кислота, 6-циклопропіл-3-метил;
ізоксазоло[5,4-*b*]піридин-4-карбонова кислота, 6-циклопропіл-3-метил-метиловий ефір;
ізоксазоло[5,4-*b*]піридин-4-карбонова кислота, 6-циклопропіл-3-метил-етиловий ефір;
ізоксазоло[5,4-*b*]піридин-4-карбонова кислота, 6-циклопропіл-3-(1-метилетил);
5 ізоксазоло[5,4-*b*]піридин-4-карбонова кислота, 6-циклопропіл-3-(1-метилетил)-метиловий ефір;
ізоксазоло[5,4-*b*]піридин-4-карбонова кислота, 6-циклопропіл-3-(1-метилетил)-етиловий ефір.
11. Ізоксазоло[5,4-*b*]піридинові сполуки формули I за п. 9, де
 R^1 означає водень, галоген, C_1-C_6 -алкіл, C_1-C_6 -галоалкіл;
 R^2 означає водень, C_1-C_6 -алкіл, C_1-C_6 -галоалкіл, C_1-C_6 -гідроксіалкіл, C_3-C_6 -циклоалкіл, C_3-C_6 -
10 галоциклоалкіл, C_2-C_6 -алкеніл, C_2-C_6 -алкініл;
 R^3 водень, галоген, гідрокси, C_1-C_6 -алкіл, C_1-C_6 -галоалкіл, C_1-C_6 -гідроксіалкіл, C_1-C_6 -алкокси- C_1 -
 C_6 -алкіл, C_1-C_6 -галоалкокси- C_1-C_6 -алкіл, C_3-C_6 -циклоалкіл- C_1-C_6 -алкіл, C_3-C_6 -галоциклоалкіл- C_1 -
 C_6 -алкіл, C_3-C_6 -циклоалкіл, C_3-C_6 -галоциклоалкіл, C_1-C_4 -алкіл- C_3-C_6 -циклоалкіл, C_3-C_6 -
циклоалкеніл, C_3-C_6 -галоциклоалкеніл, феніл- C_1-C_6 -алкіл, гетероцикліл- C_1-C_6 -алкіл, C_2-C_6 -
15 алкеніл, C_2-C_6 -галоалкеніл, C_2-C_6 -алкініл, C_2-C_6 -галоалкініл, C_1-C_6 -алкокси, C_1-C_6 -галоалкокси,
 C_1-C_6 -алкілтіо, C_1-C_6 -галоалкілтіо, аміно, C_1-C_6 -алкіламіно, N,N -ді- (C_1-C_6) -алкіламіно,
гетероцикліл, феніл; де гетероцикліл означає 5- або 6-членне насичене, частково ненасичене
або ароматичне моноциклічне кільце, яке містить 1, 2, 3 або 4 гетероатоми з групи, що
20 складається з O, N і S, як кільцеві члени; і де гетероциклільні і фенільні частини R^3 можуть бути
незаміщеними або заміщеними одним або декількома радикалами, вибраними з галогену,
гідрокси, нітро, ціано, C_1-C_4 -алкілу, C_1-C_4 -галоалкілу, C_1-C_4 -алкокси- C_1-C_4 -алкілу, C_3-C_6 -
циклоалкілу, C_2-C_6 -алкенілу, C_2-C_6 -алкінілу, C_1-C_4 -алкокси, C_1-C_4 -галоалкокси, C_1-C_4 -
алкоксикарбонілу, C_1-C_4 -алкілтіо, C_1-C_4 -алкілсульфінілу, C_1-C_4 -алкілсульфонілу, аміно, C_1-C_4 -
алкіламіно, N,N -ді- (C_1-C_4) -алкіламіно, гетероциклілу, фенілу;
25 X означає OR^4 ;
 R^4 означає водень;
і їх застосовні в сільському господарстві солі;
за винятком наступних сполук:
ізоксазоло[5,4-*b*]піридин-4-карбонова кислота, 3,6-дициклопропіл;
30 ізоксазоло[5,4-*b*]піридин-4-карбонова кислота, 6-циклопропіл-3-(1,3,5-триметил-1H-піразол-4-іл);
ізоксазоло[5,4-*b*]піридин-4-карбонова кислота, 6-циклопропіл-3-(1,1-диметилетил);
ізоксазоло[5,4-*b*]піридин-4-карбонова кислота, 6-циклопропіл-3-(4-метоксифеніл);
ізоксазоло[5,4-*b*]піридин-4-карбонова кислота, 6-циклопропіл-3-(2,2-диметилпропіл);
ізоксазоло[5,4-*b*]піридин-4-карбонова кислота, 6-циклопропіл-3-пропіл;
35 ізоксазоло[5,4-*b*]піридин-4-карбонова кислота, 6-циклопропіл-3-(2-фураніл);
ізоксазоло[5,4-*b*]піридин-4-карбонова кислота, 6-циклопропіл-3-феніл;
ізоксазоло[5,4-*b*]піридин-4-карбонова кислота, 6-циклопропіл-3-метил;
ізоксазоло[5,4-*b*]піридин-4-карбонова кислота, 6-циклопропіл-3-(1-метилетил);
ізоксазоло[5,4-*b*]піридин-4-карбонова кислота, 3,6-диметил;
40 ізоксазоло[5,4-*b*]піридин-4-карбонова кислота, 6-метил-3-пропіл;
ізоксазоло[5,4-*b*]піридин-4-карбонова кислота, 6-метил-3-(1-метилетил);
ізоксазоло[5,4-*b*]піридин-4-карбонова кислота, 6-метил-3-(1,1-диметилетил);
ізоксазоло[5,4-*b*]піридин-4-карбонова кислота, 6-метил-3-(2,2-диметилпропіл);
ізоксазоло[5,4-*b*]піридин-4-карбонова кислота, 6-метил-3-циклопропіл;
45 ізоксазоло[5,4-*b*]піридин-4-карбонова кислота, 6-метил-3-феніл;
ізоксазоло[5,4-*b*]піридин-4-карбонова кислота, 6-метил-3-(4-метилфеніл);
ізоксазоло[5,4-*b*]піридин-4-карбонова кислота, 6-метил-3-(3-метоксифеніл);
ізоксазоло[5,4-*b*]піридин-4-карбонова кислота, 6-метил-3-(4-метоксифеніл);
ізоксазоло[5,4-*b*]піридин-4-карбонова кислота, 6-метил-3-(4-фторфеніл);
50 ізоксазоло[5,4-*b*]піридин-4-карбонова кислота, 6-метил-3-(3,4-дихлорфеніл);
ізоксазоло[5,4-*b*]піридин-4-карбонова кислота, 6-метил-3-(2-фураніл);
ізоксазоло[5,4-*b*]піридин-4-карбонова кислота, 6-метил-3-(1,3,5-триметил-1H-піразол-4-іл);
ізоксазоло[5,4-*b*]піридин-4-карбонова кислота, 6-метил-3-(1-етил-5-метил-1H-піразол-4-іл);
ізоксазоло[5,4-*b*]піридин-4-карбонова кислота, 6-етил-3-метил;
55 ізоксазоло[5,4-*b*]піридин-4-карбонова кислота, 6-етил-3-пропіл;
ізоксазоло[5,4-*b*]піридин-4-карбонова кислота, 6-етил-3-(1-метилетил);
ізоксазоло[5,4-*b*]піридин-4-карбонова кислота, 6-етил-3-(2,2-диметилпропіл);
ізоксазоло[5,4-*b*]піридин-4-карбонова кислота, 6-етил-3-циклопропіл;
ізоксазоло[5,4-*b*]піридин-4-карбонова кислота, 6-етил-3-(1,3,5-триметил-1H-піразол-4-іл);
60 ізоксазоло[5,4-*b*]піридин-4-карбонова кислота, 6-(1-метилетил)-3-метил;

- ізоксазоло[5,4-*b*]піридин-4-карбонова кислота, 6-(1-метилетил)-3-пропіл;
ізоксазоло[5,4-*b*]піридин-4-карбонова кислота, 3,6-біс(1-метилетил);
ізоксазоло[5,4-*b*]піридин-4-карбонова кислота, 6-(1-метилетил)-3-(1,1-диметилетил);
ізоксазоло[5,4-*b*]піридин-4-карбонова кислота, 6-(1-метилетил)-3-(2,2-диметилпропіл);
5 ізоксазоло[5,4-*b*]піридин-4-карбонова кислота, 6-(1-метилетил)-3-циклопропіл;
ізоксазоло[5,4-*b*]піридин-4-карбонова кислота, 6-(1-метилетил)-3-феніл;
ізоксазоло[5,4-*b*]піридин-4-карбонова кислота, 6-(1-метилетил)-3-(3-метоксифеніл);
ізоксазоло[5,4-*b*]піридин-4-карбонова кислота, 6-(1-метилетил)-3-(2-фураніл);
ізоксазоло[5,4-*b*]піридин-4-карбонова кислота, 5-хлор-6-циклопропіл-3-метил;
10 ізоксазоло[5,4-*b*]піридин-4-карбонова кислота, 5-хлор-3,5-диметил.
12. Ізоксазоло[5,4-*b*]піридинові сполуки формули I за п. 9, де
 R^1 означає водень;
 R^2 означає циклопропіл;
 R^3 означає 4-дифторметоксифеніл;
15 X означає OR^4 ;
 R^4 означає водень.
13. Гербіцидна суміш, яка містить гербіцидно ефективну кількість щонайменше однієї
ізоксазоло[5,4-*b*]піридинової сполуки формули I або застосовної в сільському господарстві солі I
за будь-яким з пп. 1-12 і гербіцидний або регулюючий ріст активний компонент, або сафенер,
20 або засіб захисту рослин для боротьби зі шкідниками, фітопатогенними грибами або
бактеріями.
14. Гербіцидна композиція, яка містить гербіцидно ефективну кількість щонайменше однієї
ізоксазоло[5,4-*b*]піридинової сполуки формули I або застосовної в сільському господарстві солі I
за будь-яким з пп. 1-12 і допоміжні речовини, звичайні для приготування засобів захисту рослин.
25 15. Спосіб одержання гербіцидної композиції за п. 14, який включає змішування гербіцидно
ефективної кількості щонайменше однієї ізоксазоло[5,4-*b*]піридинової сполуки формули I або
застосовної в сільському господарстві солі I за будь-яким з пп. 1-12 і допоміжних речовин,
звичайних для приготування засобів захисту рослин.
30 16. Спосіб боротьби з небажаною рослинністю, який включає забезпечення впливу гербіцидно
ефективної кількості щонайменше однієї ізоксазоло[5,4-*b*]піридинової сполуки формули I або
застосовної в сільському господарстві солі I за будь-яким з пп. 1-12, або суміші, або композиції
за п. 13 або 14, на рослини, їх насіння і/або місце їх розповсюдження.

Комп'ютерна верстка Т. Вахричева

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

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