



УКРАЇНА

(19) UA

(11) 119648

(13) C2

(51) МПК

C07D 413/12 (2006.01)

A01P 13/02 (2006.01)

C07D 413/14 (2006.01)

C07D 417/12 (2006.01)

C07D 417/14 (2006.01)

A01N 43/88 (2006.01)

A01N 43/86 (2006.01)

МІНІСТЕРСТВО
ЕКОНОМІЧНОГО
РОЗВИТКУ І ТОРГІВЛІ
УКРАЇНИ

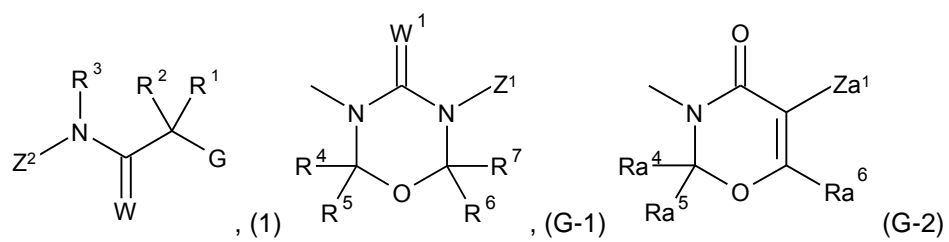
(12) ОПИС ДО ПАТЕНТУ НА ВИНАХІД

(21) Номер заявки: а 2016 03615	(72) Винахідник(и): Накая Йошіхіко (JP), Масузава Йошіхіде (JP), Хотта Хіроясу (JP), Інаба Масамітсу (JP), Міякадо Юкі (JP), Фурухасі Такамаса (JP)
(22) Дата подання заявки: 11.09.2014	(73) Власник(и): СІНГЕНТА ПАРТІСІПЕЙШНС АГ, Schwarzwaldallee 215, 4058 Basel, Switzerland (CH)
(24) Дата, з якої є чинними права на винахід: 25.07.2019	(74) Представник: Петров Андрій Володимирович, реєстр. №139
(31) Номер попередньої заявки відповідно до Паризької конвенції: 2013-188211, 2013-188213	(56) Перелік документів, взятих до уваги експертизою: JP 2007 182456, A, 19.07.2007 EP 0 747 352, A, 11.12.1996 US 6 028 032, A, 22.02.2000 JP 8151364, A, 11.06.1996 JP 11057932, A, 13.07.1999 JP 2001097958, A, 10.04.2001 JP 200197958, A, 10.04.2001 WO 2008096398, A, 14.08.2008 CN 103159744, A, 19.06.2013
(32) Дата подання попередньої заявки відповідно до Паризької конвенції: 11.09.2013, 11.09.2013	
(33) Код держави-учасниці Паризької конвенції, до якої подано попередню заявку: JP, JP	
(41) Публікація відомостей про заявку: 25.05.2016, Бюл.№ 10	
(46) Публікація відомостей про видачу патенту: 25.07.2019, Бюл.№ 14	
(86) Номер та дата подання міжнародної заявки, поданої відповідно до Договору РСТ: РСТ/JP2014/074142, 11.09.2014	

(54) ГЕТЕРОЦИКЛІЧНА АМІДНА СПОЛУКА Й ГЕРБІЦИД**(57) Реферат:**

Гетероциклічна амідна сполука, представлена формулою (1); а також гербіцид, що містить гетероциклічну амідну сполуку. У формулі G являє собою групу, представлену формулою (G-1) або (G-2); кожний з W і W¹ незалежно являє собою атом кисню тощо; кожний з Z¹ і Z^{a1} являє собою фенільну групу тощо; Z² являє собою ароматичний гетероцикл; кожний з R¹ і R² незалежно являє собою C₁-C₆алкільну групу тощо; R₃ являє собою атом водню, C₁-C₆алкільну групу тощо; а також кожний з R⁴, R^{a4}, R⁵, R^{a5}, R⁶, R^{a6} і R⁷ незалежно являє собою атом водню тощо.

UA 119648 C2



Галузь техніки

[0001] Даний винахід відноситься до нової гетероциклічної амідної сполуки і її солей, а також до пестицидів, зокрема, гербіцидів, що містять гетероциклічну амідну сполуку і її солі як активний компонент. Крім того, пестицид у даному винаході означає інсектицид, акарицид, нематодид, гербіцид, фунгіцид тощо в галузі сільського господарства й садівництва.

Попередній рівень техніки

[0002] Наприклад, в посиланнях на патенти 1-10 і посиланнях на непатентні документи 1-4 розкриті деякі типи гетероциклічної амідної сполуки, але було відсутнє будь-яке розкриття, що відноситься до гетероциклічних амідних сполук за даним винаходом.

Попередні бібліографічні посилання

Посилання на патенти

[0003] [Посилання на патент 1] Викладений для загального ознайомлення опис міжнародної заявки № 2010/119906.

[Посилання на патент 2] Викладений для загального ознайомлення опис міжнародної заявки № 95/18113.

[Посилання на патент 3] Викладений для загального ознайомлення опис міжнародної заявки № 95/22523.

[Посилання на патент 4] Викладений для загального ознайомлення опис заявки на європейський патент № 122761.

[Посилання на патент 5] Викладений для загального ознайомлення опис заявки на патент США № 4289524.

[Посилання на патент 6] Викладений для загального ознайомлення опис заявки на європейський патент № 22653.

[Посилання на патент 7] Викладена для загального ознайомлення публікація заявки на патент Японії № 61/-212575.

[Посилання на патент 8] Викладена для загального ознайомлення публікація заявки на патент Японії № 4/-89485.

[Посилання на патент 9] Викладена для загального ознайомлення публікація заявки на патент Японії № 8/-311026.

[Посилання на патент 10] Викладена для загального ознайомлення публікація заявки на патент Японії № 2007/-182456.

Посилання на непатентні документи

[0004] [Посилання на непатентний документ 1] Journal of Heterocyclic Chemistry, 2005, Vol. 42, p.711;

[Посилання на непатентний документ 2] Synthetic Communications, 1996, Vol.26, p.3217;

[Посилання на непатентний документ 3] Bulletin of the Chemical Society of Japan, 1989, Vol.62, p.1930;

[Посилання на непатентний документ 4] Journal of Organic Chemistry, 1964, Vol.29, p.2777.

Короткий опис винаходу

Проблема, яка вирішується за допомогою винаходу

[0005] Мета даного винаходу полягає у забезпеченні хімічної речовини, що застосовується як активний компонент гербіциду, який надійно проявляє ефективність проти різних бур'янів у більш низьких дозах і є дуже безпечним, і за допомогою якого повинні зменшитись такі проблеми, як забруднення ґрунту і вплив на наступні культури.

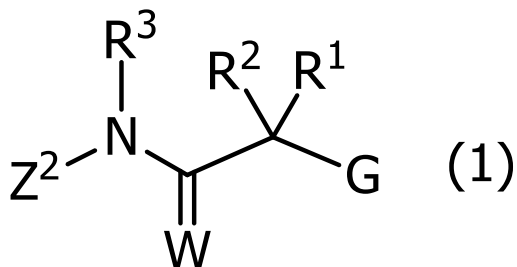
Засоби вирішення проблеми

[0006] Автори даного винаходу в результаті багаторазового й ретельного дослідження з метою вирішення вищевказаних проблем виявили, що нові гетероциклічні амідні сполуки за даним винаходом, представлені наступною формулою (1), являють собою дуже корисні сполуки, які мають відмінну гербіцидну активність в якості гербіцидів і високу безпеку щодо цільових культур, а також практично не виявляють жодних шкідливих ефектів щодо організмів, які не є мішенню, таких як ссавці, риби й корисні комахи, і, таким чином, прийшли до даного винаходу.

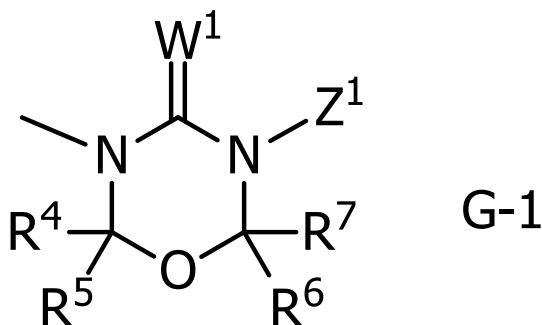
[0007] Тобто даний винахід відноситься до [1]-[14] нижче.

[1] Гетероциклічна амідна сполука, представлена формулою (1):

[Хім. 1]

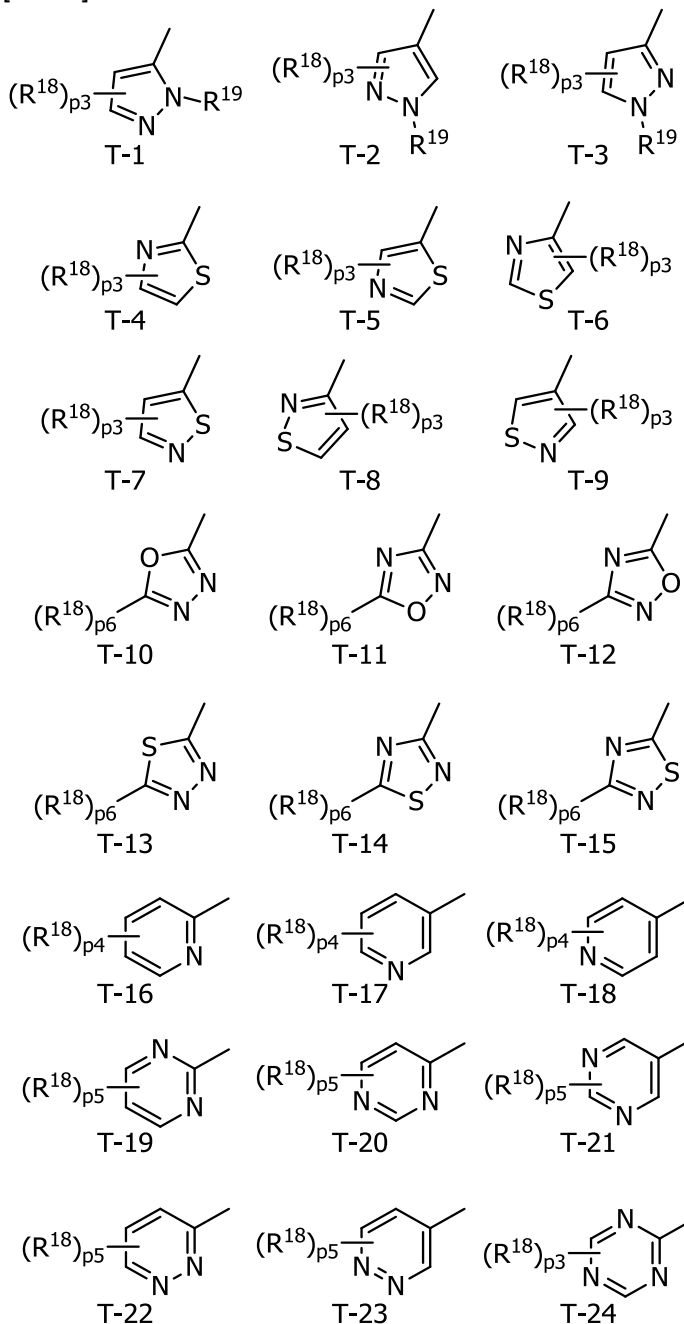


[у формулі W являє собою атом кисню або атом сірки,
кожний з R¹ і R² незалежно являє собою атом водню, C₁-C₆алкіл або (C₁-C₆)алкіл,
необов'язково заміщений R⁸, або ж за допомогою спільного утворення R¹ і R² C₂-C₆алкіленового
ланцюга, R¹ і R² разом зі зв'язуючим атомом вуглецю можуть утворювати 3-7-членне кільце,
R³ являє собою атом водню, C₁-C₆алкіл або (C₁-C₆)алкіл, необов'язково заміщений R⁹,
R⁸ являє собою атом галогену або -OR¹⁰,
R⁹ являє собою атом галогену або -OR¹¹,
кожний з R¹⁰ і R¹¹ незалежно являє собою атом водню або C₁-C₆алкіл,
G являє собою кільце, представлене G-1 або G-2,
(а) якщо G являє собою кільце, представлене G-1,
[Хім. 2]

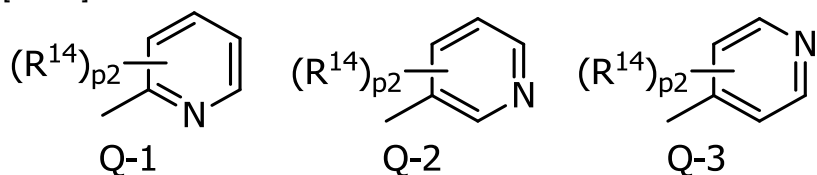


W¹ являє собою атом кисню або атом сірки,
Z¹ являє собою C₁-C₆алкіл, (C₁-C₆)алкіл, необов'язково заміщений R¹², C₃-C₆циклоалкіл, (C₃-
C₆)циклоалкіл, необов'язково заміщений R¹², C₂-C₆алкеніл, (C₂-C₆)алкеніл, необов'язково
заміщений R¹², C₂-C₆алкініл, (C₂-C₆)алкініл, необов'язково заміщений R¹², феніл, феніл,
заміщений (R¹³)_{p1} або Q-1-Q-3, і
Z² являє собою ароматичне гетероциклічне кільце, представлене будь-яким з T-1 - T-24,

[Xim. 3]



- кожний з R^4 , R^5 , R^6 і R^7 незалежно являє собою атом водню або C_1 - C_6 алкіл,
 Q-1 - Q-3 являють собою ароматичні гетероциклічні кільця, відповідно представлені
 5 наступними структурними формулами,
 [Xim. 4]



- R^{12} являє собою атом галогену, феніл або $-OR^{15}$,
 R^{13} являє собою атом галогену, C_1 - C_6 алкіл, C_1 - C_6 галогеналкіл або $-OR^{16}$, і якщо p_1 являє
 10 собою ціле число 2 або більше, кожний з R^{13} може бути аналогічним або відмінним,
 більш того, якщо 2 R^{13} є суміжними, 2 суміжних R^{13} за допомогою утворення $-CH_2CH_2CH_2-$, $-CH_2CH_2O-$, $-CH_2OCH_2-$, $-OCH_2O-$, $-CH_2CH_2S-$, $-CH_2SCH_2-$, $-CH_2CH_2CH_2CH_2-$, $-CH_2CH_2CH_2O-$, $-CH_2CH_2OCH_2-$, $-CH_2OCH_2O-$, $-OCH_2CH_2O-$, $-CH_2CH_2CH_2S-$, $-OCH_2CH_2S-$ або $-CH=CH-CH=CH-$

можуть утворювати 5-членне кільце або 6-членне кільце разом з атомом вуглецю, з яким зв'язаний кожний з 2 R^{13} , і в даному випадку атоми водню, зв'язані з кожним атомом вуглецю, що утворює кільце, необов'язково можуть бути заміщені атомом(-ами) галогену, C_1 - C_6 алкільною групою(-ами) або C_1 - C_6 галогеналкільною групою(-ами),

5 R^{14} являє собою атом галогену, C_1 - C_6 алкіл, C_1 - C_6 галогеналкіл або $-OR^{17}$, і якщо p_2 являє собою ціле число 2 або більше, кожний з R^{14} може бути аналогічним або відмінним,

більш того, якщо 2 R^{14} є суміжними, 2 суміжних R^{14} за допомогою утворення $-CH_2CH_2CH_2-$, $-CH_2CH_2O-$, $-CH_2OCH_2-$, $-OCH_2O-$, $-CH_2CH_2S-$, $-CH_2SCH_2-$, $-CH_2CH_2CH_2CH_2-$, $-CH_2CH_2CH_2O-$, $-CH_2CH_2OCH_2-$, $-CH_2OCH_2O-$, $-OCH_2CH_2O-$, $-CH_2CH_2CH_2S-$, $-OCH_2CH_2S-$ або $-CH=CH-CH=CH-$ можуть утворювати 5-членне кільце або 6-членне кільце разом з атомом вуглецю, з яким зв'язаний кожний з 2 R^{14} , і в даному випадку атоми водню, зв'язані з кожним атомом вуглецю, що утворює кільце, необов'язково можуть бути заміщені атомом(-ами) галогену, C_1 - C_6 алкільною групою(-ами) або C_1 - C_6 галогеналкільною групою(-ами),

R^{15} являє собою атом водню або C_1 - C_6 алкіл,

15 R^{16} являє собою атом водню, C_1 - C_6 алкіл, C_1 - C_6 галогеналкіл або феніл,

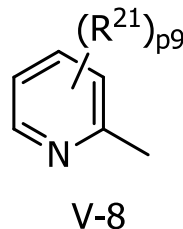
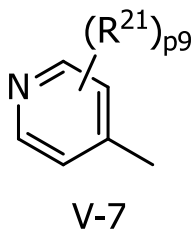
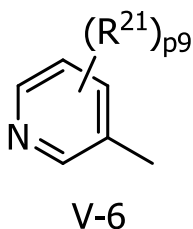
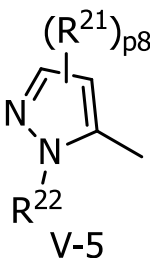
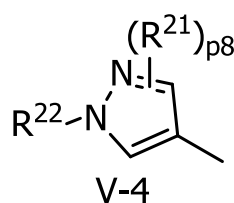
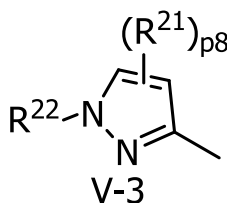
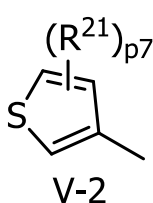
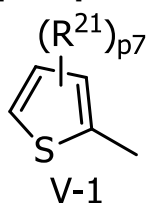
R^{17} являє собою C_1 - C_6 алкіл, C_1 - C_6 галогеналкіл або феніл,

R^{18} являє собою атом галогену, C_1 - C_6 алкіл, C_1 - C_6 галогеналкіл, C_3 - C_6 циклоалкіл, ціано-, $C(O)OR^{20}$, феніл, $-OR^{23}$, нітро-, $-N(R^{24})R^{25}$, $-S(O)_qR^{26}$ або V-1 - V-8, і якщо p_3 , p_4 або p_5 являють собою ціле число 2 або більше, кожний з R^{18} може бути аналогічним або відмінним,

20 більш того, якщо 2 R^{18} є суміжними, 2 суміжних R^{18} за допомогою утворення $-CH_2CH_2CH_2-$, $-CH_2CH_2O-$, $-CH_2OCH_2-$, $-OCH_2O-$, $-CH_2CH_2S-$, $-CH_2SCH_2-$, $-CH_2CH_2CH_2CH_2-$, $-CH_2CH_2CH_2O-$, $-CH_2CH_2OCH_2-$, $-CH_2OCH_2O-$, $-OCH_2CH_2O-$, $-CH_2CH_2CH_2S-$, $-OCH_2CH_2S-$ або $-CH=CH-CH=CH-$ можуть утворювати 5-членне кільце або 6-членне кільце разом з атомом вуглецю, з яким зв'язаний кожний з 2 R^{18} , і в даному випадку атоми водню, зв'язані з кожним атомом вуглецю, що утворює кільце, необов'язково можуть бути заміщені атомом(-ами) галогену, C_1 - C_6 алкільною групою(-ами) або C_1 - C_6 галогеналкільною групою(-ами),

V-1 - V-8 являють собою ароматичні гетероциклічні кільця, відповідно представлені наступними структурними формулами,

[Хім. 5]



30

кожний з R^{19} і R^{20} незалежно являє собою C_1 - C_6 алкіл або C_1 - C_6 галогеналкіл,

R^{21} являє собою атом галогену, C_1 - C_6 алкіл або C_1 - C_6 галогеналкіл, і якщо p_7 , p_8 або p_9 являють собою ціле число 2 або більше, кожний з R^{21} може бути аналогічним або відмінним,

35 більш того, якщо 2 R^{21} є суміжними, 2 суміжних R^{21} за допомогою утворення $-CH_2CH_2CH_2-$, $-CH_2CH_2O-$, $-CH_2OCH_2-$, $-OCH_2O-$, $-CH_2CH_2S-$, $-CH_2SCH_2-$, $-CH_2CH_2CH_2CH_2-$, $-CH_2CH_2CH_2O-$, $-CH_2CH_2OCH_2-$, $-CH_2OCH_2O-$, $-OCH_2CH_2O-$, $-CH_2CH_2CH_2S-$, $-OCH_2CH_2S-$ або $-CH=CH-CH=CH-$ можуть утворювати 5-членне кільце або 6-членне кільце разом з атомом вуглецю, з яким зв'язаний кожний з 2 R^{21} , і в даному випадку атоми водню, зв'язані з кожним атомом вуглецю, що утворює кільце, необов'язково можуть бути заміщені атомом(-ами) галогену, C_1 - C_6 алкільною групою(-ами) або C_1 - C_6 галогеналкільною групою(-ами),

40

R^{22} являє собою C_1 - C_6 алкіл або C_1 - C_6 галогеналкіл,

R^{23} являє собою атом водню, C_1 - C_6 алкіл, C_1 - C_6 галогеналкіл або феніл,

кожний з R^{24} і R^{25} незалежно являє собою атом водню або C_1 - C_6 алкіл, або ж R^{24} за допомогою утворення C_2 - C_6 алкіленового ланцюга разом з R^{25} може утворювати 3-7-членне

кільце разом зі зв'язуючим атомом азоту, і в даному випадку даний алкіленовий ланцюг може містити 1 атом кисню, атом сірки або атом азоту й може бути необов'язково заміщеним атомом(-ами) галогену, C₁-C₆алкільною групою(-ами), C₁-C₆галогеналкільною групою(-ами), C₁-C₆алкоксигрупою(-ами), формільною групою(-ами), C₁-C₆алкілкарбонільною групою(-ами), C₁-C₆алкоксикарбонільною групою(-ами) або оксогрупою(-ами),

R²⁶ являє собою C₁-C₆алкіл або C₁-C₆галогеналкіл,

p1 являє собою ціле число 1, 2, 3, 4 або 5,

p2 являє собою ціле число 0, 1, 2, 3 або 4,

p3 являє собою ціле число 0, 1 або 2,

p4 являє собою ціле число 0, 1, 2, 3 або 4,

p5 являє собою ціле число 0, 1, 2 або 3,

p6 являє собою ціле число 0 або 1,

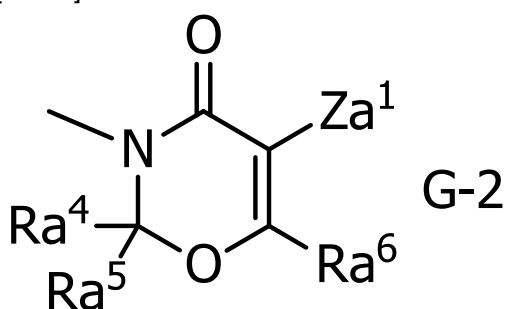
p7 являє собою ціле число 0, 1, 2 або 3,

p8 являє собою ціле число 0, 1 або 2,

p9 являє собою ціле число 0, 1, 2, 3 або 4, і

q являє собою ціле число 0, 1 або 2, або
(b) якщо G являє собою кільце, представлене G-2,

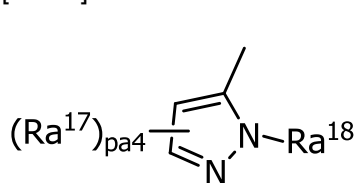
[Хім. 6]



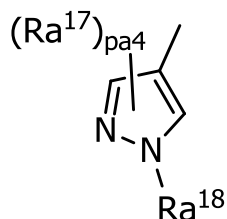
Za¹ являє собою феніл, феніл, заміщений (Ra¹³)_{pa1} або Qa-1 - Qa-8,

Z² являє собою ароматичне гетероциклічне кільце, представлене будь-яким з Та-1 - Та-13,

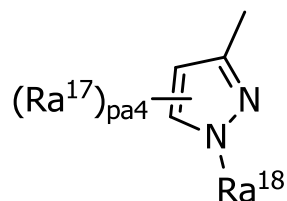
[Xim. 7]



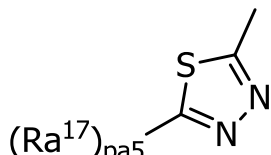
Ta-1



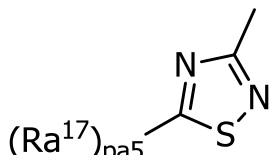
Ta-2



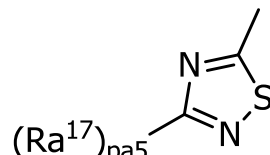
Ta-3



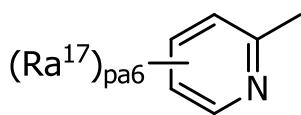
Ta-4



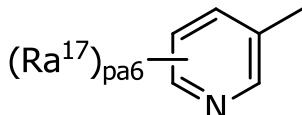
Ta-5



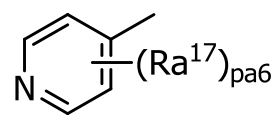
Ta-6



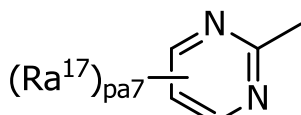
Ta-7



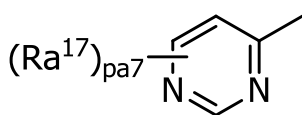
Ta-8



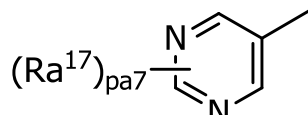
Ta-9



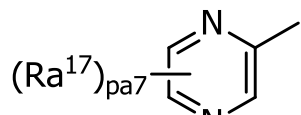
Ta-10



Ta-11



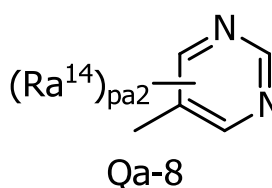
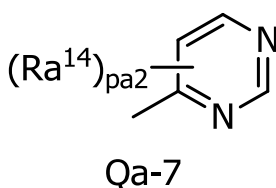
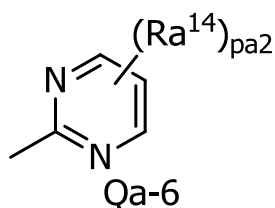
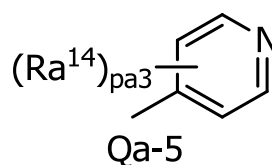
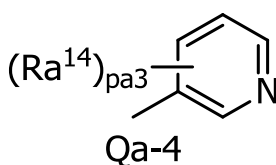
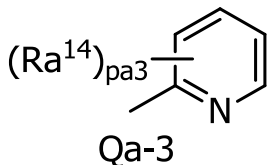
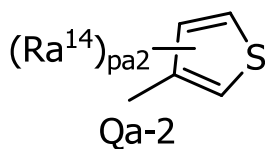
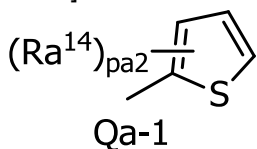
Ta-12



Ta-13

- кожний з Ra⁴ і Ra⁵ незалежно являє собою атом водню або C₁-C₆алкіл,
 Ra⁶ являє собою атом водню, C₁-C₆алкіл або (C₁-C₆)алкіл, необов'язково заміщений Ra⁹,
 5 Qa-1 - Qa-8 являють собою ароматичні гетероциклічні кільця, відповідно представлені наступними структурними формулами,

[Xim. 8]



Ra^9 являє собою атом галогену або $-ORa^{12}$,

Ra^{12} являє собою атом водню або C_1 - C_6 алкіл,

5 Ra^{13} являє собою атом галогену, C_1 - C_6 алкіл, C_1 - C_6 галогеналкіл або $-ORa^{15}$, і якщо $pa1$ являє собою ціле число 2 або більше, кожний з Ra^{13} може бути аналогічним або відмінним,

10 більш того, якщо 2 Ra^{13} є суміжними, 2 суміжних Ra^{13} за допомогою утворення $-CH_2CH_2CH_2-$, $-CH_2CH_2O-$, $-CH_2OCH_2-$, $-OCH_2O-$, $-CH_2CH_2S-$, $-CH_2SCH_2-$, $-CH_2CH_2CH_2CH_2-$, $-CH_2CH_2CH_2O-$, $-CH_2CH_2OCH_2-$, $-CH_2OCH_2O-$, $-OCH_2CH_2O-$, $-CH_2CH_2CH_2S-$, $-OCH_2CH_2S-$ або $-CH=CH-CH=CH-$ можуть утворювати 5-членне кільце або 6-членне кільце разом з атомом вуглецю, з яким зв'язаний кожний з 2 Ra^{13} , і в даному випадку атоми водню, зв'язані з кожним атомом вуглецю, що утворює кільце, необов'язково можуть бути заміщені атомом(-ами) галогену, C_1 - C_6 алкільною групою(-ами) або C_1 - C_6 галогеналкільною групою(-ами),

15 Ra^{14} являє собою атом галогену, C_1 - C_6 алкіл, C_1 - C_6 галогеналкіл або $-ORa^{16}$, і якщо $pa2$ або $pa3$ являє собою ціле число 2 або більше, кожний з Ra^{14} може бути аналогічним або відмінним,

20 більш того, якщо 2 Ra^{14} є суміжними, 2 суміжних Ra^{14} за допомогою утворення $-CH_2CH_2CH_2-$, $-CH_2CH_2O-$, $-CH_2OCH_2-$, $-OCH_2O-$, $-CH_2CH_2S-$, $-CH_2SCH_2-$, $-CH_2CH_2CH_2CH_2-$, $-CH_2CH_2CH_2O-$, $-CH_2CH_2OCH_2-$, $-CH_2OCH_2O-$, $-OCH_2CH_2O-$, $-CH_2CH_2CH_2S-$, $-OCH_2CH_2S-$ або $-CH=CH-CH=CH-$ можуть утворювати 5-членне кільце або 6-членне кільце разом з атомом вуглецю, з яким зв'язаний кожний з 2 Ra^{14} , і в даному випадку атоми водню, зв'язані з кожним атомом вуглецю, що утворює кільце, необов'язково можуть бути заміщені атомом(-ами) галогену, C_1 - C_6 алкільною групою(-ами) або C_1 - C_6 галогеналкільною групою(-ами),

Ra^{15} являє собою атом водню, C_1 - C_6 алкіл, C_1 - C_6 галогеналкіл або феніл,

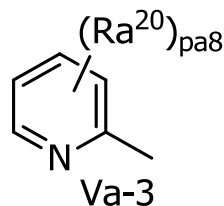
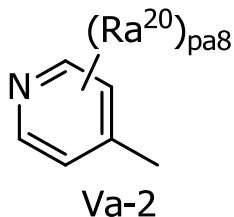
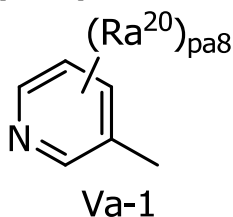
Ra^{16} являє собою C_1 - C_6 алкіл, C_1 - C_6 галогеналкіл або феніл,

25 Ra^{17} являє собою атом галогену, C_1 - C_6 алкіл, C_1 - C_6 галогеналкіл, C_3 - C_6 циклоалкіл, ціано, $-C(O)ORa^{19}$, феніл, $-ORa^{21}$, нітро, $-N(Ra^{22})Ra^{23}$, $-S(O)_{qa}Ra^{24}$ або $Va-1$ - $Va-3$, і якщо $pa4$, $pa6$ або $pa7$ являють собою ціле число 2 або більше, кожний з Ra^{17} може бути аналогічним або відмінним,

30 більш того, якщо 2 Ra^{17} є суміжними, 2 суміжних Ra^{17} за допомогою утворення $-CH_2CH_2CH_2-$, $-CH_2CH_2O-$, $-CH_2OCH_2-$, $-OCH_2O-$, $-CH_2CH_2S-$, $-CH_2SCH_2-$, $-CH_2CH_2CH_2CH_2-$, $-CH_2CH_2CH_2O-$, $-CH_2CH_2OCH_2-$, $-CH_2OCH_2O-$, $-OCH_2CH_2O-$, $-CH_2CH_2CH_2S-$, $-OCH_2CH_2S-$ або $-CH=CH-CH=CH-$ можуть утворювати 5-членне кільце або 6-членне кільце разом з атомом вуглецю, з яким зв'язаний кожний з 2 Ra^{17} , і в даному випадку атоми водню, зв'язані з кожним атомом вуглецю, що утворює кільце, необов'язково можуть бути заміщені атомом(-ами) галогену, C_1 - C_6 алкільною групою(-ами) або C_1 - C_6 галогеналкільною групою(-ами),

35 $Va-1$ - $Va-3$ являють собою ароматичні гетероциклічні кільця, відповідно представлені наступними структурними формулами,

[Хім. 9]



кожний з Ra^{18} і Ra^{19} незалежно являє собою C_1 - C_6 алкіл або C_1 - C_6 галогеналкіл,

Ra^{20} являє собою атом галогену, C_1 - C_6 алкіл або C_1 - C_6 галогеналкіл, і якщо $pa8$ являє собою

5 ціле число 2 або більше, кожний з Ra^{20} може бути аналогічним або відмінним,

більш того, якщо 2 Ra^{20} є суміжними, 2 суміжних Ra^{20} за допомогою утворення $-CH_2CH_2CH_2-$, $-CH_2CH_2O-$, $-CH_2OCH_2-$, $-OCH_2O-$, $-CH_2CH_2S-$, $-CH_2SCH_2-$, $-CH_2CH_2CH_2CH_2-$, $-CH_2CH_2CH_2O-$, $-CH_2CH_2OCH_2-$, $-CH_2OCH_2O-$, $-OCH_2CH_2O-$, $-CH_2CH_2CH_2S-$, $-OCH_2CH_2S-$ або $-CH=CH-CH=CH-$ можуть утворювати 5-членне кільце або 6-членне кільце разом з атомом вуглецю, з яким зв'язаний кожний з 2 R^{20} , і в даному випадку атоми водню, зв'язані з кожним атомом вуглецю, що утворює кільце, необов'язково можуть бути заміщені атомом(-ами) галогену, C_1 - C_6 алкільною групою(-ами) або C_1 - C_6 галогеналкільною групою(-ами),

Ra^{21} являє собою C_1 - C_6 алкіл, C_1 - C_6 галогеналкіл або феніл,

кожний з Ra^{22} і Ra^{23} незалежно являє собою атом водню або C_1 - C_6 алкіл, або ж Ra^{22} за допомогою утворення C_2 - C_6 алкіленового ланцюга разом з Ra^{23} може утворювати 3-7-членне кільце разом зі зв'язуючим атомом азоту, і в даному випадку даний алкіленовий ланцюг може містити 1 атом кисню, атом сірки або атом азоту і може бути необов'язково заміщеним атомом(-ами) галогену, C_1 - C_6 алкільною групою(-ами), C_1 - C_6 галогеналкільною групою(-ами), C_1 - C_6 алкоксигрупою(-ами), формільною групою(-ами), C_1 - C_6 алкілкарбонільною групою(-ами) або

C_1 - C_6 алкоксикарбонільною групою(-ами),

Ra^{24} являє собою C_1 - C_6 алкіл або C_1 - C_6 галогеналкіл,

$pa1$ являє собою ціле число 1, 2, 3, 4 або 5,

$pa2$ являє собою ціле число 0, 1, 2 або 3,

$pa3$ являє собою ціле число 0, 1, 2, 3 або 4,

$pa4$ являє собою ціле число 0, 1 або 2,

$pa5$ являє собою ціле число 0 або 1,

$pa6$ являє собою ціле число 0, 1, 2, 3 або 4,

$pa7$ являє собою ціле число 0, 1, 2 або 3,

$pa8$ являє собою ціле число 0, 1, 2, 3 або 4, і

qa являє собою ціле число 0, 1 або 2], або їх сіль.

[0008] [2]

Гетероциклічна амідна сполука або її сіль, зазначена у вищевказаному [1], яка характеризується тим, що G являє собою кільце, представлене G-1.

[0009] [3]

Гетероциклічна амідна сполука або її сіль, зазначена у вищевказаному [2], яка характеризується тим, що

R^4 , R^5 , R^6 і R^7 являють собою атоми водню,

кожний з R^8 , R^9 , R^{12} і R^{14} незалежно являє собою атом галогену,

R^{16} являє собою атом водню, C_1 - C_6 алкіл або C_1 - C_6 галогеналкіл,

R^{18} являє собою атом галогену, C_1 - C_6 алкіл, C_1 - C_6 галогеналкіл, C_3 - C_6 циклоалкіл, ціано, $-C(O)OR^{20}$, феніл, $-OR^{23}$, нітро, $-S(O)_2R^{26}$, V-2, V-5 або V-6, і якщо $p3$, $p4$ або $p5$ являють собою ціле число 2 або більше, кожний з R^{18} може бути аналогічним або відмінним,

більш того, якщо 2 R^{18} є суміжними, 2 суміжних R^{18} за допомогою утворення $-CH_2CH_2CH_2-$, $-CH_2CH_2O-$, $-CH_2OCH_2-$, $-OCH_2O-$, $-CH_2CH_2S-$, $-CH_2SCH_2-$, $-CH_2CH_2CH_2CH_2-$, $-CH_2CH_2CH_2O-$, $-CH_2CH_2OCH_2-$, $-CH_2OCH_2O-$, $-OCH_2CH_2O-$, $-CH_2CH_2CH_2S-$, $-OCH_2CH_2S-$ або $-CH=CH-CH=CH-$ можуть утворювати 5-членне кільце або 6-членне кільце разом з атомом вуглецю, з яким зв'язаний кожний з 2 R^{18} , і в даному випадку атоми водню, зв'язані з кожним атомом вуглецю, що утворює кільце, необов'язково можуть бути заміщені атомом(-ами) галогену, C_1 - C_6 алкільною групою(-ами) або C_1 - C_6 галогеналкільною групою(-ами), і

R^{21} являє собою атом галогену.

[0010] [4]

Гетероциклічна амідна сполука або її сіль, зазначена у вищевказаному [3], яка характеризується тим, що

W являє собою атом кисню,

кожний з R^1 і R^2 незалежно являє собою атом водню або C_1 - C_6 алкіл, або ж за допомогою утворення R^1 разом з R^2 C_2 алкіленового ланцюга R^1 і R^2 можуть утворювати 3-членне кільце разом зі зв'язуючим атомом вуглецю,

5 R^3 являє собою атом водню або C_1 - C_6 алкіл,

R^{13} являє собою атом галогену, C_1 - C_6 алкіл, C_1 - C_6 галогеналкіл або $-OR^{16}$,

R^{16} являє собою C_1 - C_6 алкіл або C_1 - C_6 галогеналкіл,

R^{18} являє собою атом галогену, C_1 - C_6 алкіл, C_1 - C_6 галогеналкіл, C_3 - C_6 циклоалкіл, ціано, - $C(O)OR^{20}$, феніл, $-OR^{23}$, нітро, $-S(O)_qR^{26}$, V-2, V-5 або V-6, і якщо 2 R^{18} є суміжними, 2 суміжних R^{18} за допомогою утворення $-CH=CH-CH=CH-$ можуть утворювати 6-членне кільце разом з

10 атомом вуглецю, з яким зв'язаний кожний з 2 R^{18} ,

кожний з R^{20} і R^{22} незалежно являє собою C_1 - C_6 алкіл,

R^{23} являє собою C_1 - C_6 алкіл, C_1 - C_6 галогеналкіл або феніл, і

R^{26} являє собою C_1 - C_6 алкіл.

[0011] [5]

15 Гетероциклічна амідна сполука або її сіль, зазначена у вищевказаному [4], яка характеризується тим, що

Z^1 являє собою C_3 - C_6 циклоалкіл, (C_3 - C_6)циклоалкіл, необов'язково заміщений R^{12} , феніл, феніл, заміщений $(R^{13})_{p1}$ або Q-1 - Q-3,

20 Z^2 являє собою T-1, T-2, T-3, T-4, T-5, T-6, T-7, T-8, T-9, T-10, T-13, T-14, T-15, T-16, T-17, T-18, T-19, T-20, T-21, T-22, T-23 або T-24,

R^{13} являє собою атом галогену, C_1 - C_6 алкіл або $-OR^{16}$, і

R^{16} являє собою C_1 - C_6 алкіл.

[0012] [6]

25 Гетероциклічна амідна сполука або її сіль, зазначена у вищевказаному [5], яка характеризується тим, що

Z^2 являє собою T-1, T-2, T-3, T-4, T-7, T-10, T-13, T-14, T-15, T-16, T-17, T-18, T-19, T-20, T-21, T-22, T-23 або T-24.

[0013] [7]

30 Гетероциклічна амідна сполука або її сіль, зазначена у вищевказаному [6], яка характеризується тим, що

Z^1 являє собою феніл, феніл, заміщений $(R^{13})_{p1}$ або Q-2, і

Z^2 являє собою T-1, T-3, T-4, T-7, T-10, T-13, T-14, T-15, T-16, T-17, T-18, T-19, T-20, T-22 або T-24.

[0014] [8]

35 Гетероциклічна амідна сполука або її сіль, зазначена у вищевказаному [1], яка характеризується тим, що

G являє собою кільце, представлене G-2.

[0015] [9]

40 Гетероциклічна амідна сполука або її сіль, зазначена у вищевказаному [8], яка характеризується тим, що

кожний з R^1 і R^2 незалежно являє собою C_1 - C_6 алкіл або (C_1 - C_6)алкіл, необов'язково заміщений R^8 , або ж за допомогою спільного утворення R^1 і R^2 C_2 - C_6 алкіленового ланцюга, R^1 і R^2 разом зі зв'язуючим атомом вуглецю можуть утворювати 3-7 членне кільце,

R^3 являє собою атом водню,

45 R^8 являє собою атом галогену,

Ra^4 і Ra^5 являють собою атоми водню,

Ra^6 являє собою C_1 - C_6 алкіл або (C_1 - C_6)алкіл, необов'язково заміщений Ra^9 ,

Ra^9 являє собою атом галогену,

Ra^{13} являє собою атом галогену, C_1 - C_6 алкіл або C_1 - C_6 галогеналкіл, і якщо $pa1$ являє собою

50 ціле число 2 або більше, кожний з Ra^{13} може бути аналогічним або відмінним,

більш того, якщо 2 Ra^{13} є суміжними, 2 суміжних Ra^{13} за допомогою утворення $-CH_2CH_2CH_2-$, $-CH_2CH_2O-$, $-CH_2OCH_2-$, $-OCH_2O-$, $-CH_2CH_2S-$, $-CH_2SCH_2-$, $-CH_2CH_2CH_2CH_2-$, $-CH_2CH_2CH_2O-$, $-CH_2CH_2OCH_2-$, $-CH_2OCH_2O-$, $-OCH_2CH_2O-$, $-CH_2CH_2CH_2S-$, $-OCH_2CH_2S-$ або $-CH=CH-CH=CH-$ можуть утворювати 5-членне кільце або 6-членне кільце разом з атомом вуглецю, з яким зв'язаний кожний з 2 Ra^{13} , і в даному випадку атоми водню, зв'язані з кожним атомом вуглецю, що утворює кільце, необов'язково можуть бути заміщені атомом(-ами) галогену, C_1 - C_6 алкільною групою(-ами) або C_1 - C_6 галогеналкільною групою(-ами),

55 Ra^{14} являє собою атом галогену, C_1 - C_6 алкіл або C_1 - C_6 галогеналкіл, і якщо $pa2$ або $pa3$ являє собою ціле число 2 або більше, кожний з Ra^{14} може бути аналогічним або відмінним,

більш того, якщо 2 Ra^{14} є суміжними, 2 суміжних Ra^{14} за допомогою утворення $-CH_2CH_2CH_2-$, $-CH_2CH_2O-$, $-CH_2OCH_2-$, $-OCH_2O-$, $-CH_2CH_2S-$, $-CH_2SCH_2-$, $-CH_2CH_2CH_2CH_2-$, $-CH_2CH_2CH_2O-$, $-CH_2CH_2OCH_2-$, $-CH_2OCH_2O-$, $-OCH_2CH_2O-$, $-CH_2CH_2CH_2S-$, $-OCH_2CH_2S-$ або $-CH=CH-CH=CH-$ можуть утворювати 5-членне кільце або 6-членне кільце разом з атомом вуглецю, з яким зв'язаний кожний з 2 Ra^{14} , і в даному випадку атоми водню, зв'язані з кожним атомом вуглецю, що утворює кільце, необов'язково можуть бути заміщені атомом(-ами) галогену, C_1 - C_6 алкільною групою(-ами) або C_1 - C_6 галогеналкільною групою(-ами),

Ra^{17} являє собою атом галогену, C_1 - C_6 алкіл, C_1 - C_6 галогеналкіл, C_3 - C_6 циклоалкіл, ціано, $-C(O)ORa^{19}$, феніл, $-ORa^{21}$, нітро, $-S(O)_{qa}Ra^{24}$ або $Va-1$ - $Va-3$, і якщо $pa4$, $pa6$ або $pa7$ являють собою ціле число 2 або більше, кожний з Ra^{17} може бути аналогічним або відмінним,

більш того, якщо 2 Ra^{17} є суміжними, 2 суміжних Ra^{17} за допомогою утворення $-CH_2CH_2CH_2-$, $-CH_2CH_2O-$, $-CH_2OCH_2-$, $-OCH_2O-$, $-CH_2CH_2S-$, $-CH_2SCH_2-$, $-CH_2CH_2CH_2CH_2-$, $-CH_2CH_2CH_2O-$, $-CH_2CH_2OCH_2-$, $-CH_2OCH_2O-$, $-OCH_2CH_2O-$, $-CH_2CH_2CH_2S-$, $-OCH_2CH_2S-$ або $-CH=CH-CH=CH-$ можуть утворювати 5-членне кільце або 6-членне кільце разом з атомом вуглецю, з яким зв'язаний кожний з 2 Ra^{17} , і в даному випадку атоми водню, зв'язані з кожним атомом вуглецю, що утворює кільце, необов'язково можуть бути заміщені атомом(-ами) галогену, C_1 - C_6 алкільною групою(-ами) або C_1 - C_6 галогеналкільною групою(-ами), і

Ra^{20} являє собою атом галогену.

[0016] [10]

Гетероциклічна амідна сполука або її сіль, зазначена у вищевказаному [9], яка характеризується тим, що

W являє собою атом кисню,

кожний з R^1 , R^2 і Ra^6 незалежно являє собою C_1 - C_6 алкіл,

Ra^{13} являє собою атом галогену,

Ra^{14} являє собою атом галогену, і якщо 2 Ra^{14} є суміжними, 2 суміжних Ra^{14} за допомогою утворення $-CH=CH-CH=CH-$ можуть утворювати 6-членне кільце разом з атомом вуглецю, з яким зв'язаний кожний з 2 Ra^{14} ,

Ra^{17} являє собою атом галогену, C_1 - C_6 алкіл, C_1 - C_6 галогеналкіл, ціано, $-C(O)ORa^{19}$, феніл, $-ORa^{21}$, $-S(O)_{qa}Ra^{24}$ або $Va-1$, і якщо 2 Ra^{17} є суміжними, 2 суміжних Ra^{17} за допомогою утворення $-CH=CH-CH=CH-$ можуть утворювати 6-членне кільце разом з атомом вуглецю, з яким зв'язаний кожний з 2 Ra^{17} , і

кожний з Ra^{18} , Ra^{19} і Ra^{24} незалежно являє собою C_1 - C_6 алкіл.

[0017] [11]

Гетероциклічна амідна сполука або її сіль, зазначена у вищевказаному [10], яка характеризується тим, що

Za^1 являє собою феніл, феніл, заміщений $(Ra^{13})_{pa1}$, $Qa-1$, $Qa-2$, $Qa-3$, $Qa-4$, $Qa-5$ або $Qa-8$, і

Z^2 являє собою $Ta-2$, $Ta-4$, $Ta-5$, $Ta-6$, $Ta-7$, $Ta-8$, $Ta-9$, $Ta-11$ або $Ta-13$.

[0018] [12]

Гетероциклічна амідна сполука або її сіль, зазначена у вищевказаному [11], яка характеризується тим, що

Za^1 являє собою феніл, $Qa-1$, $Qa-2$, $Qa-4$, $Qa-5$ або $Qa-8$, і

Z^2 являє собою $Ta-2$, $Ta-4$, $Ta-6$, $Ta-7$, $Ta-8$, $Ta-9$, $Ta-11$ або $Ta-13$.

[0019] [13]

Пестицид, який характеризується тим, що 1 або 2 або більше вибраних з гетероциклічних амідних сполук або їх солей, зазначених у вищевказаних [1]-[12], містяться в якості активного компонента(-ів).

[0020] [14]

Гербіцид, який характеризується тим, що 1 або 2 або більше вибраних з гетероциклічних амідних сполук або їх солей, зазначених у вищевказаних [1]-[12], містяться в якості активного компонента(-ів).

Технічний результат винаходу

[0021] Сполуки за даним винаходом мають чудову гербіцидну активність проти різних бур'янів, високу безпеку щодо цільових культур, практично не мають шкідливого впливу щодо організмів, які не є мішенню, таких як ссавці, риби й корисні комахи, характеризуються низьким залишком і невеликим навантаженням на навколишнє середовище.

Отже, даний винахід може забезпечити гербіциди, застосовні на сільськогосподарських і садівничих полях, таких як рисові поля, сільськогосподарські угіддя і фруктові сади.

Варіанти здійснення винаходу

[0022] В залежності від природи замісників можуть бути присутніми Е-форма і Z-форма геометричних ізомерів у сполуках, включених в даний винахід, однак даний винахід включає в

себе такі Е-форми, Z-форми або суміші, які містять Е-форми і Z-форми в будь-яких пропорціях. Крім того, оптично активні форми, зумовлені наявністю 1 або 2 або більше асиметричних атомів вуглецю, присутні у сполуках, включених в даний винахід, однак даний винахід включає в себе усі оптично активні форми або рацемічні форми.

5 [0023] Серед сполук, включених у даний винахід, ті, які можуть бути перетворені в кислотно-адитивні солі за допомогою звичайних способів, наприклад, можуть бути перетворені в солі галогеноводневих кислот, таких як фтористоводнева кислота, соляна кислота, бромистоводнева кислота і йодистоводнева кислота, солі неорганічних кислот, таких як азотна кислота, сірчана кислота, фосфорна кислота, хлоратна кислота й перхлорна кислота, солі сульфонових кислот, таких як метансульфонова кислота, етансульфонова кислота, трифторметансульфонова кислота, бензолсульфонова кислота і п-толуолсульфонова кислота, солі карбонових кислот, таких як мурашина кислота, оцтова кислота, пропіонова кислота, трифтороцтова кислота, фумарова кислота, винна кислота, щавлева кислота, малеїнова кислота, яблучна кислота, бурштинова кислота, бензойна кислота, мигдальна кислота, аскорбінова кислота, молочна кислота, глюконова кислота і лимонна кислота, або солі амінокислот, таких як глютамінова кислота і аспарагінова кислота.

10 [0024] Як альтернатива, серед сполук, включених у даний винахід, є ті, які можуть бути перетворені в солі металів за допомогою звичайних способів, наприклад, можуть бути перетворені в солі лужних металів, таких як літій, натрій і калій, солі лужноземельних металів, таких як кальцій, барій і магній, або солі алюмінію.

20 [0025] Далі нижче наведені конкретні приклади різних груп-замісників, зазначених в даному описі. В даному документі, відповідно, n- означає нормальний, i- ізо, втор- вторинний і трет- третинний, а також Ph означає феніл.

25 [0026] Як атоми галогену в даному описі згадуються атом фтору, атом хлору, атом бромі й атом йоду. Крім того, в даному описі вираз "галоген" також вказує на ці атоми галогену.

[0027] Вираз C_a-C_b алкіл у даному описі означає лінійну або розгалужену вуглеводневу групу, утворену a-b атомами вуглецю, і при цьому, наприклад, метильна група, етильна група, n-пропільна група, ізопропільна група, n-бутильна група, ізобутильна група, втор-бутильна група, трет-бутильна група, n-пентильна група, 1,1-диметилпропільна група, n-гексильна група і їм подібні згадуються як конкретні приклади, і їх вибирають в діапазоні відповідної зазначеної кількості атомів вуглецю.

30 [0028] Вираз C_a-C_b циклоалкіл у даному описі означає циклічну вуглеводневу групу, утворену a-b атомами вуглецю і здатну утворювати одинарне 3-членне-6-членне кільце або зчленовану кільцеву структуру. Крім того, кожне кільце може бути необов'язково заміщене алкільною групою(-ами) в діапазоні зазначеної кількості атомів вуглецю. Наприклад, циклопропільна група, 1-метилциклопропільна група, 2-метилциклопропільна група, 2,2-диметилциклопропільна група, циклобутильна група, циклопентильна група, циклогексильна група тощо згадуються як конкретні приклади і вибираються в діапазоні відповідної зазначеної кількості атомів вуглецю.

40 [0029] Вираз C_a-C_b алкеніл у даному описі означає ненасичену вуглеводневу групу, яка є лінійною або розгалуженою і складеною з a-b атомів вуглецю, а також містить 1 або 2 або більше подвійних зв'язків в молекулі, і при цьому, наприклад, вінільна група, 1-пропенільна група, 2-пропенільна група, 1-метилетенільна група, 2-бутенільна група, 2-метил-2-пропенільна група, 3-метил-2-бутенільна група, 1,1-диметил-2-пропенільна група тощо згадуються як конкретні приклади і вибираються в діапазоні відповідної зазначеної кількості атомів вуглецю.

45 [0030] Вираз C_a-C_b алкініл у даному описі означає ненасичену вуглеводневу групу, яка є лінійною або розгалуженою і складеною з a-b атомів вуглецю, а також містить 1 або 2 або більше потрійних зв'язків в молекулі, і при цьому, наприклад, етинільна група, 1-пропінільна група, 2-пропінільна група, 1-бутинільна група, 2-бутинільна група, 3-бутинільна група, 1,1-диметил-2-пропінільна група тощо згадуються як конкретні приклади і вибираються в діапазоні відповідної зазначеної кількості атомів вуглецю.

50 [0031] Вираз C_a-C_b галогеналкіл у даному описі означає лінійну або розгалужену вуглеводневу групу, утворену a-b атомами вуглецю, де атом(-и) водню, зв'язаний з атомами вуглецю, необов'язково заміщений атомом(-ами) галогену. В даному випадку, якщо ці атоми галогену заміщені 2 або більше атомами галогену, вони можуть бути аналогічними або відмінними. Наприклад, фторметильна група, хлорметильна група, бромметильна група, йодметильна група, дифторметильна група, дихлорметильна група, трифторметильна група, хлордифторметильна група, трихлорметильна група, бромдифторметильна група, 2-фторетильна група, 2-хлоретильна група, 2-брометильна група, 2,2-дифторетильна група, 2,2,2-трифторетильна група, 2-хлор-2,2-дифторетильна група, 2,2,2-трихлоретильна група, 1,1,2,2-тетрафторетильна група, 2-хлор-1,1,2-трифторетильна група, пентафторетильна група, 3,3,3-

трифторпропільна група, 2,2,3,3,3-пентафторпропільна група, 1,1,2,3,3,3-гексафторпропільна група, гептафторпропільна група, 2,2,2-трифтор-1-(трифторметил)етильна група, 1,2,2,2-тетрафтор-1-(трифторметил)етильна група, 2,2,3,3,4,4,4-гептафторбутильна група, нонафторбутильна група та їм подібні згадуються як конкретні приклади і вибираються в

5 діапазоні відповідної зазначеної кількості атомів вуглецю.

[0032] Вираз C_a-C_b алкокси у даному описі являє собою групу алкіл-О-, маючи на увазі, як зазначено вище, що вона утворена а-в атомами вуглецю, і при цьому, наприклад, метоксигрупа, етоксигрупа, н-пропілоксигрупа, ізопропілоксигрупа, н-бутилоксигрупа, втор-бутилоксигрупа, ізобутилоксигрупа, трет-бутилоксигрупа, н-бутилоксигрупа, н-гексилоксигрупа та їм подібні

10 згадуються як конкретні приклади і вибираються в діапазоні відповідної зазначеної кількості атомів вуглецю.

[0033] Вираз C_a-C_b алкілкарбоніл у даному описі являє собою групу алкіл-С(О)-, маючи на увазі, як зазначено вище, що вона утворена а-в атомами вуглецю, і при цьому, наприклад, група $CH_3C(O)-$, група $CH_3CH_2C(O)-$, група $CH_3CH_2CH_2C(O)-$, група $(CH_3)_2CHC(O)-$, група $CH_3(CH_2)_3C(O)-$, група $(CH_3)_2CHCH_2C(O)-$, група $CH_3CH_2CH(CH_3)C(O)-$, група $(CH_3)_3CC(O)-$, група $CH_3(CH_2)_4C(O)-$, група $CH_3(CH_2)_5C(O)-$ та їм подібні згадуються як конкретні приклади і

15 вибираються в діапазоні відповідної зазначеної кількості атомів вуглецю.

[0034] Вираз C_a-C_b алкоксикарбоніл у даному описі являє собою групу алкіл-О-С(О)-, маючи на увазі, як зазначено вище, що вона утворена а-в атомами вуглецю, і при цьому, наприклад, група $CH_3\cdot C(O)-$, група $CH_3CH_2\cdot C(O)-$, група $CH_3CH_2CH_2\cdot C(O)-$, група $(CH_3)_2CHOC(O)-$, група $CH_3(CH_2)_3\cdot C(O)-$, група $(CH_3)_2CHCH_2\cdot C(O)-$, група $(CH_3)_3COC(O)-$ та їм подібні згадуються як конкретні приклади і вибираються в діапазоні відповідної зазначеної кількості атомів вуглецю.

20

[0035] Вираз, такий як (C_a-C_b) алкіл, необов'язково заміщений R^8 , у даному описі являє собою алкільну групу, маючи на увазі, як зазначено вище, що вона утворена а-в атомами вуглецю, де атом(-и) водню, зв'язаний з атомами вуглецю, необов'язково заміщений будь-яким R^8 і вибирається в діапазоні відповідної зазначеної кількості атомів вуглецю. В даному випадку, якщо 2 або більше замісників R^8 присутні у відповідних (C_a-C_b) алкільних групах, відповідні R^8 можуть бути аналогічними або відмінними.

25

[0036] Вираз, такий як (C_a-C_b) циклоалкіл, необов'язково заміщений R^{12} , у даному описі являє собою циклоалкільну групу, маючи на увазі, як зазначено вище, що вона утворена а-в атомами вуглецю, де атом(-и) водню, зв'язаний з атомами вуглецю, необов'язково заміщений будь-яким R^{12} і вибирається в діапазоні відповідної зазначеної кількості атомів вуглецю. В даному випадку, якщо 2 або більше замісників R^{12} присутні у відповідних (C_a-C_b) циклоалкільних групах, відповідні R^{12} можуть бути аналогічними або відмінними, крім того, заміщені положення можуть знаходитись в циклічній частині структури або частині бічного ланцюга, або ж вони можуть знаходитись в обох з них.

30

[0037] Вираз, такий як (C_a-C_b) алкеніл, необов'язково заміщений R^{12} , у даному описі являє собою алкенільну групу, маючи на увазі, як зазначено вище, що вона утворена а-в атомами вуглецю, де атом(-и) водню, зв'язаний з атомами вуглецю, необов'язково заміщений будь-яким R^{12} і вибирається в діапазоні відповідної зазначеної кількості атомів вуглецю. В даному випадку, якщо 2 або більше замісників R^{12} присутні у відповідних (C_a-C_b) алкенільних групах, відповідні R^{12} можуть бути аналогічними або відмінними.

40

[0038] Вираз, такий як (C_a-C_b) алкініл, необов'язково заміщений R^{12} , у даному описі являє собою алкінільну групу, маючи на увазі, як зазначено вище, що вона утворена а-в атомами вуглецю, де атом(-и) водню, зв'язаний з атомами вуглецю, необов'язково заміщений будь-яким R^{12} і вибирається в діапазоні відповідної зазначеної кількості атомів вуглецю. В даному випадку, якщо 2 або більше замісників R^{12} присутні у відповідних (C_a-C_b) алкінільних групах, відповідні R^{12} можуть бути аналогічними або відмінними.

45

[0039] Як конкретні приклади виразу "за допомогою спільного утворення R^1 і R^2 C_2-C_6 алкіленового ланцюга R^1 і R^2 разом зі зв'язуючим атомом вуглецю можуть утворювати 3-7-членне кільце" в даному описі згадуються, наприклад, циклопропан, циклобутан, циклопентан, циклогексан та їм подібні і вибираються в діапазоні відповідної зазначеної кількості атомів вуглецю.

50

[0040] Як конкретні приклади виразів

" R^{24} за допомогою утворення C_2-C_6 алкіленового ланцюга разом з R^{25} може утворювати 3-7-членне кільце разом зі зв'язуючим атомом азоту, і в даному випадку даний алкіленовий ланцюг може містити 1 атом кисню, атом сірки або атом азоту"

55

та

" Ra^{22} за допомогою утворення C_2-C_6 алкіленового ланцюга разом з Ra^{23} може утворювати 3-7-членне кільце разом зі зв'язуючим атомом азоту, і в даному випадку даний алкіленовий

60

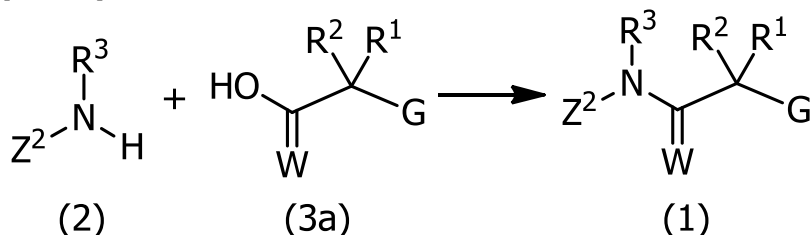
ланцюг може містити 1 атом кисню, атом сірки або атом азоту" в даному описі, наприклад, азиридин, азетидин, азетидин-2-он, піролідін, піролідін-2-он, оксазолідін, оксазолідін-2-он, тіазолідін, тіазолідін-2-он, імідазолідін, імідазолідін-2-он, піперидін, піперидін-2-он, морфолін, тетрагідро-1,3-оксазин-2-он, тіоморфолін, тетрагідро-1,3-тіазин-2-он, піперазин, тетрагідропіримідін-2-он, гомопіперидін, гомопіперидін-2-он та їм подібні згадуються і вибираються в діапазоні відповідної зазначеної кількості атомів вуглецю.

[0041] Далі нижче описані способи одержання сполук за даним винаходом.

Спосіб одержання А

Гетероциклічні амідні сполуки, представлені формулою (1), можуть, наприклад, бути одержані за допомогою здійснення реакції сполуки, представлені формулою (2), і сполуки, представлені формулою (3а).

[Хім. 10]



[0042] Сполуки за даним винаходом, представлені формулою (1) [у формулі G, W, Z², R¹, R² і R³ мають ті ж самі значення, як зазначено вище], можуть бути одержані за допомогою здійснення реакції сполук, представлених формулою (2) [у формулі Z² і R³ мають ті ж самі значення, як зазначено вище], або їх солей і сполук, представлених формулою (3а) [у формулі G, W, R¹ і R² мають ті ж самі значення, як зазначено вище], або їх солей із застосуванням розчинника або без нього, із застосуванням за необхідності основи і за необхідності конденсуючого засобу, за необхідності після додавання добавок.

В даній реакції може застосовуватись від 0,1 до 100 еквівалентів сполуки, представлені формулою (3а), на еквівалент сполуки, представлені формулою (2).

[0043] Якщо застосовується розчинник, то застосовуваний розчинник повинен бути інертним по відношенню до реакції, і при цьому слід зазначити, наприклад, полярні розчинники, такі як N,N-диметилформамід, N,N-диметилацетамід, ацетонітрил, диметилсульфоксид і 1,3-диметил-2-імідазоліон, етери, такі як діетиловий етер, тетрагідрофуран, 1,4-діоксан, 1,2-диметоксіетан і дифеніловий етер, ароматичні вуглеводні, такі як бензол, толуол і ксилол, галогеновані вуглеводні, такі як метиленхлорид, хлороформ, чотирьоххлористий вуглець і 1,2-дихлоретан, а також аліфатичні вуглеводні, такі як н-пентан і н-гексан. Ці розчинники можуть застосовуватись окремо або можуть застосовуватись суміші з 2 або більше з них.

[0044] Якщо застосовується основа, то в якості основи може застосовуватись органічна основа, така як триетиламін, піридин, 4-(диметиламіно)піридин, або неорганічна основа, така як карбонат калію або карбонат натрію, при цьому може застосовуватись від 0,1 до 50 еквівалентів на еквівалент сполуки, представлені формулою (2).

[0045] Якщо застосовується конденсуючий засіб, то в якості застосовуваного конденсуючого засобу слід зазначити 1Н-бензотриазол-1-ілокси-трис(диметиламіно)фосфонію гексафторфосфат, N,N'-дициклогексилкарбодіімід, 1-(3-диметиламінопропіл)-3-етилкарбодіімиду гідроклорид, 2-хлор-1-метилпіридинію йодид та їм подібні, при цьому може застосовуватись від 0,1 до 50 еквівалентів на еквівалент сполуки, представлені формулою (2).

[0046] Якщо застосовується добавка, то в якості застосовуваної добавки слід зазначити 3Н-[1,2,3]триазол[4,5-б]піридин-3-ол, 1-гідроксибензотриазол і їм подібні, при цьому може застосовуватись від 0,1 до 50 еквівалентів на еквівалент сполуки, представлені формулою (2).

[0047] Температура реакції може бути встановлена при будь-якій температурі від -78°C до температури кипіння реакційної суміші, при цьому час реакції варіюється в залежності від концентрацій субстратів реакції і температури реакції, але зазвичай встановлюється в діапазоні від 5 хвилин до 100 годин.

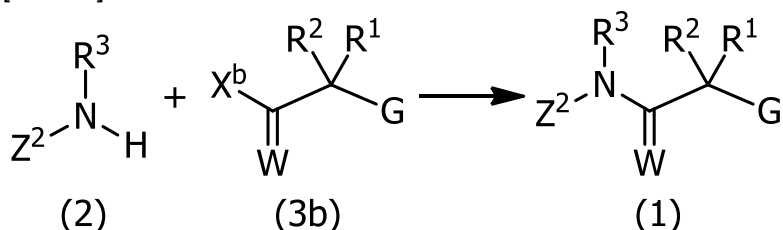
Деякі сполуки, представлені формулою (2), являють собою відомі сполуки і деякі з них можуть бути одержані як комерційні продукти.

Деякі сполуки, представлені формулою (3а), являють собою відомі сполуки і можуть бути одержані загальновідомими способами. Наприклад, вони можуть бути легко одержані способами, описаними у викладеному для загального ознайомлення описі міжнародної заявки № 95/18113 тощо.

[0048] Спосіб одержання В

Гетероциклічні амідні сполуки, представлені формулою (1), наприклад, можуть бути одержані за допомогою здійснення реакції сполуки, представлені формулою (2), і сполуки, представлені формулою (3b).

[Хім. 11]



[0049] Сполуки за даним винаходом, представлені формулою (1), можуть бути одержані за допомогою здійснення реакції сполуки, представлені формулою (2), або її солей і сполуки, представлені формулою (3b) [у формулі X^b являє собою групу, що відходить, таку як атом галогену, при цьому G, W, R^1 і R^2 мають ті ж самі значення, як зазначено вище], або її солей, із застосуванням розчинника або без нього, із застосуванням за необхідності основи.

В даній реакції може застосовуватись від 0,1 до 100 еквівалентів сполуки, представлені формулою (3b), на еквівалент сполуки, представлені формулою (2).

[0050] Якщо застосовується розчинник, то застосовуваний розчинник повинен бути інертним по відношенню до реакції і при цьому слід зазначити, наприклад, полярні розчинники, такі як N,N-диметилформамід, N,N-диметилацетамід, ацетонітрил, диметилсульфоксид і 1,3-диметил-2-імідазоліон, етери, такі як діетиловий етер, тетрагідрофуран, 1,4-діоксан, 1,2-диметоксіетан і дифеніловий етер, ароматичні вуглеводні, такі як бензол, толуол і ксилол, галогеновані вуглеводні, такі як метиленхлорид, хлороформ, чотирьоххлористий вуглець і 1,2-дихлоретан, а також аліфатичні вуглеводні, такі як н-пентан і н-гексан. Ці розчинники можуть застосовуватись окремо або можуть застосовуватись суміші з 2 або більше з них.

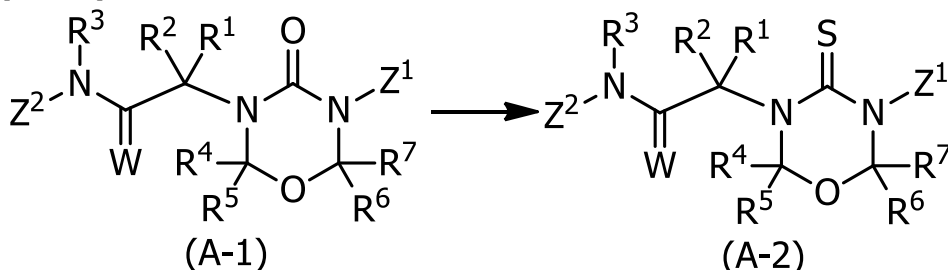
[0051] Якщо застосовується основа, то в якості основи можуть застосовуватись органічні основи, такі як триетиламін, піридин, 4-(диметиламіно)піридин, 1,8-діазабіцикло[5,4,0]-7-ундецен, або неорганічні основи, такі як карбонат калію, карбонат натрію і гідрид натрію, при цьому може застосовуватись від 0,1 до 50 еквівалентів на еквівалент сполуки, представлені формулою (2).

Температура реакції може бути встановлена при будь-якій температурі від -78°C до температури кипіння реакційної суміші, при цьому час реакції варіюється в залежності від концентрацій субстратів реакції і температури реакції, але зазвичай встановлюється в діапазоні від 5 хвилин до 100 годин.

[0052] Спосіб одержання С

Гетероциклічні амідні сполуки, представлені формулою (A-2), наприклад, можуть бути одержані за допомогою здійснення реакції сполуки, представлені формулою (A-1), і сульфідуючого засобу.

[Хім. 12]



[0053] Сполуки за даним винаходом, представлені формулою (A-2) [у формулі W, Z^1 , Z^2 , R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 і R^7 мають ті ж самі значення, як зазначено вище], можуть бути одержані за допомогою здійснення реакції сполуки, представлені формулою (A-1) [у формулі W, Z^1 , Z^2 , R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 і R^7 мають ті ж самі значення, як зазначено вище], або її солей і сульфідуючого засобу, із застосуванням розчинника або без нього, з додаванням за необхідності добавки(-ок).

В даній реакції може застосовуватись від 0,1 до 100 еквівалентів сульфідуючого засобу на еквівалент сполуки, представлені формулою (A-1).

В якості застосовуваного сульфідуючого засобу слід зазначити, наприклад, 2,4-біс(4-метоксифеніл)-1,3-дитіа-2,4-дифосфетан-2,4-дисульфід (реагент Лавессона) тощо.

[0054] Якщо застосовується розчинник, то застосовуваний розчинник повинен бути інертним по відношенню до реакції, і при цьому слід зазначити, наприклад, полярні розчинники, такі як N,N-диметилформамід, N,N-диметилацетамід, ацетонітрил, диметилсульфоксид і 1,3-диметил-2-імідазоліон, етери, такі як діетиловий етер, тетрагідрофуран, 1,4-діоксан, 1,2-диметоксіетан і дифеніловий етер, ароматичні вуглеводні, такі як бензол, толуол і ксилол, а також аліфатичні вуглеводні, такі як н-пентан і н-гексан. Ці розчинники можуть застосовуватись окремо або можуть застосовуватись суміші з 2 або більше з них.

[0055] Якщо застосовується добавка, то в якості добавки можуть застосовуватись етери, такі як 1,4,7,10,13,16-гексаоксабіцикло-октадекан, солі четвертинного амонію, такі як тетра-н-бутиламонію бромід тощо, при цьому може застосовуватись від 0,1 до 50 еквівалентів на еквівалент сполуки, представленої формулою (A-1).

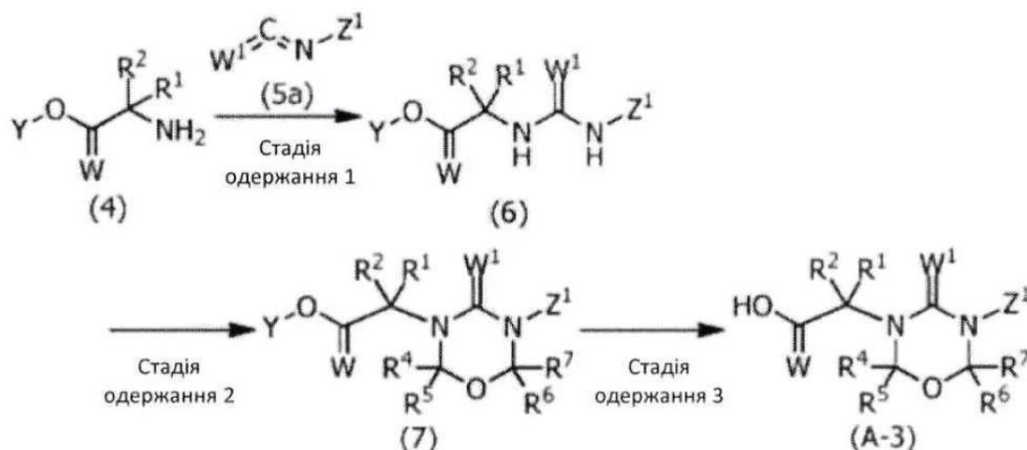
Температура реакції може бути встановлена при будь-якій температурі від -78°C до температури кипіння реакційної суміші, при цьому час реакції варіюється в залежності від концентрацій субстратів реакції і температури реакції, але зазвичай встановлюється в діапазоні від 5 хвилин до 100 годин.

[0056] У способах одержання A-C сполуки за даним винаходом можуть бути одержані за допомогою звичайної обробки реакційної суміші після закінчення реакції, такої як безпосереднє концентрування або концентрування після розчинення в органічному розчиннику і промивання водою, або виливання у воду з льодом і концентрування після екстракції органічним розчинником. Крім того, якщо необхідне очищення, вони можуть бути виділені і очищені за допомогою будь-яких способів очищення, таких як перекристалізація, фракціонування способом колонкової хроматографії, тонкошарової хроматографії й рідинної хроматографії.

[0057] Деякі сполуки, представлені формулою (A-3), можуть бути синтезовані згідно зі схемою реакції 1.

Схема реакції 1

[Xim. 13]



[0058] (Стадія одержання 1)

Сполуки, представлені формулою (6) [у формулі Y, W, W¹, Z¹, R¹ і R² мають ті ж самі значення, як зазначено вище], можуть бути одержані за допомогою здійснення реакції сполуки, представленої формулою (4) [у формулі Y являє собою C₁-C₆алкіл, такий як метил або етил, або бензил, при цьому W, R¹ і R² мають ті ж самі значення, як зазначено вище], або її солей і сполуки, представленої формулою (5a) [у формулі W¹ і Z¹ мають ті ж самі значення, як зазначено вище], або її солей, із застосуванням розчинника або без нього, із застосуванням за необхідності основи.

В даній реакції може застосовуватись від 0,1 до 100 еквівалентів сполуки, представленої формулою (5a), на еквівалент сполуки, представленої формулою (4).

[0059] Якщо застосовується розчинник, то застосовуваний розчинник повинен бути інертним по відношенню до реакції, і при цьому слід зазначити, наприклад, полярні розчинники, такі як N,N-диметилформамід, N,N-диметилацетамід, ацетонітрил, диметилсульфоксид і 1,3-диметил-2-імідазоліон, етери, такі як діетиловий етер, тетрагідрофуран, 1,4-діоксан, 1,2-диметоксіетан і дифеніловий етер, ароматичні вуглеводні, такі як бензол, толуол і ксилол, галогеновані вуглеводні, такі як метиленхлорид, хлороформ, чотирьоххлористий вуглець і 1,2-дихлоретан, а також аліфатичні вуглеводні, такі як н-пентан і н-гексан. Ці розчинники можуть застосовуватись окремо або можуть застосовуватись суміші з 2 або більше з них.

[0060] Якщо застосовується основа, то в якості основи можуть застосовуватись органічні основи, такі як триетиламін, піридин, 4-(диметиламіно)піридин і діізопропілетиламін, або неорганічні основи, такі як карбонат калію або карбонат натрію, при цьому може застосовуватись від 0,1 до 50 еквівалентів на еквівалент сполуки, представленої формулою (4).

5 Температура реакції може бути встановлена при будь-якій температурі від -78°C до температури кипіння реакційної суміші, при цьому час реакції варіюється в залежності від концентрацій субстратів реакції і температури реакції, але зазвичай встановлюється в діапазоні від 5 хвилин до 100 годин.

10 [0061] Сполуки, представлені формулою (6), можуть бути одержані за допомогою здійснення звичайної обробки реакційної суміші після закінчення реакції за допомогою безпосереднього концентрування або концентрування після розчинення в органічному розчиннику і промивання водою, або виливання у воду з льодом і концентрування після екстракції органічним розчинником. Крім того, якщо необхідне очищення, вони можуть бути виділені і очищені за допомогою будь-яких способів очищення, таких як перекристалізація, фракціонування способом

15 колонкової хроматографії, тонкошарової хроматографії й рідинної хроматографії. Крім того, сполуки, представлені формулою (6), одержані цим способом, можуть застосовуватись як такі на наступній стадії реакції без виділення і очищення.

Деякі сполуки, представлені формулою (4) і формулою (5a), являють собою відомі сполуки, і деякі з них можуть бути одержані як комерційні продукти.

20 [0062] (Стадія одержання 2)

Сполуки, представлені формулою (7) [у формулі Y, W, W¹, Z¹, R¹, R², R⁴, R⁵, R⁶ і R⁷ мають ті ж самі значення, як зазначено вище], можуть бути одержані за допомогою здійснення реакції сполуки, представленої формулою (6), або її солей і формальдегіду, із застосуванням розчинника або без нього, із застосуванням за необхідності кислоти.

25 В даній реакції може застосовуватись від 0,1 до 100 еквівалентів формальдегіду на еквівалент сполуки, представленої формулою (6).

Як приклад застосовуваного формальдегіду слід зазначити, наприклад, формалін, параформальдегід тощо.

30 [0063] Якщо застосовується розчинник, то застосовуваний розчинник повинен бути інертним по відношенню до реакції, і при цьому слід зазначити, наприклад, полярні розчинники, такі як N,N-диметилформамід, N,N-диметилацетамід, ацетонітрил, диметилсульфоксид і 1,3-диметил-2-імідазоліон, ароматичні вуглеводні, такі як бензол, толуол і ксилол, галогеновані вуглеводні, такі як метиленхлорид, хлороформ, чотириохлористий вуглець і 1,2-дихлоретан, а також аліфатичні вуглеводні, такі як n-пентан і n-гексан. Ці розчинники можуть застосовуватись

35 окремо або можуть застосовуватись суміші з 2 або більше з них. Якщо застосовується кислота, то в якості кислоти може застосовуватись соляна кислота, сірчана кислота, мурашина кислота, оцтова кислота, трифтороцтова кислота, метансульфонова кислота тощо, при цьому може застосовуватись від 0,1 до 100 еквівалентів на еквівалент сполуки, представленої формулою (6).

40 Температура реакції може бути встановлена при будь-якій температурі від -78°C до температури кипіння реакційної суміші, при цьому час реакції варіюється в залежності від концентрацій субстратів реакції і температури реакції, але зазвичай встановлюється в діапазоні від 5 хвилин до 100 годин.

45 [0064] Сполуки, представлені формулою (7), можуть бути одержані за допомогою звичайної обробки реакційної суміші після закінчення реакції за допомогою безпосереднього концентрування або концентрування після розчинення в органічному розчиннику і промивання водою, або виливання у воду з льодом і концентрування після екстракції органічним розчинником. Крім того, якщо необхідне очищення, вони можуть бути виділені і очищені за допомогою будь-яких способів очищення, таких як перекристалізація, фракціонування способом

50 колонкової хроматографії, тонкошарової хроматографії й рідинної хроматографії. Крім того, сполуки, представлені формулою (7), одержані цим способом, можуть застосовуватись як такі на наступній стадії реакції без виділення і очищення.

[0065] (Стадія одержання 3)

55 Сполуки, представлені формулою (A-3) [у формулі W, W¹, Z¹, R¹, R², R⁴, R⁵, R⁶ і R⁷ R₃ мають ті ж самі значення, як зазначено вище], можуть бути одержані за допомогою здійснення реакції сполуки, представленої формулою (7), або її солей і основи, із застосуванням розчинника або без нього.

В якості основи можуть застосовуватись органічні основи, такі як триетиламін, піридин, 4-(диметиламіно)піридин, або неорганічні основи, такі як карбонат калію, карбонат натрію,

гідроксид калію або гідроксид натрію, при цьому може застосовуватись від 0,1 до 100 еквівалентів на еквівалент сполуки, представленої формулою (7).

[0066] Якщо застосовується розчинник, то застосовуваний розчинник повинен бути інертним по відношенню до реакції, і при цьому слід зазначити, наприклад, полярні розчинники, такі як N,N-диметилформамід, N,N-диметилацетамід, ацетонітрил, диметилсульфоксид і 1,3-диметил-2-імідазоліон і вода, етери, такі як діетиловий етер, тетрагідрофуран, 1,4-діоксан, 1,2-диметоксіетан і дифеніловий етер, спирти, такі як метанол і етанол, ароматичні вуглеводні, такі як бензол, толуол і ксилол, а також аліфатичні вуглеводні, такі як н-пентан і н-гексан. Ці розчинники можуть застосовуватись окремо або можуть застосовуватись суміші з 2 або більше з них.

Температура реакції може бути встановлена при будь-якій температурі від -78°C до температури кипіння реакційної суміші, при цьому час реакції варіюється в залежності від концентрацій субстратів реакції і температури реакції, але зазвичай встановлюється в діапазоні від 5 хвилин до 100 годин.

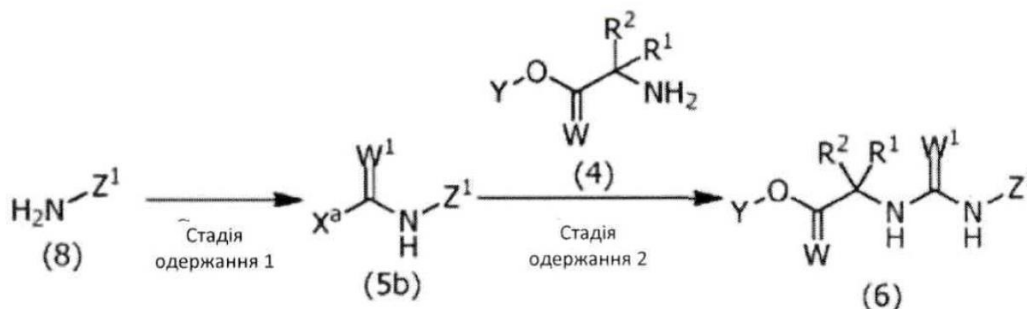
[0067] Проміжні сполуки для одержання, які є вихідними матеріалами для способу одержання А, можуть бути одержані за допомогою звичайної обробки реакційної суміші після закінчення реакції за допомогою безпосереднього концентрування або концентрування після розчинення в органічному розчиннику і промивання водою, або виливання у воду з льодом і концентрування після екстракції органічним розчинником. Крім того, якщо необхідне очищення, вони можуть бути виділені і очищені за допомогою будь-яких способів очищення, таких як перекристалізація, фракціонування способом колонкової хроматографії, тонкошарової хроматографії й рідинної хроматографії.

Крім того, одержані цим способом проміжні сполуки для одержання можуть застосовуватись як такі на наступній стадії реакції без виділення й очищення.

[0068] Деякі сполуки, представлені формулою (6), можуть бути синтезовані згідно зі схемою реакції 2, показаною нижче.

Схема реакції 2

[Хім. 14]



[0069] (Стадія одержання 1)

Сполуки, представлені формулою (5b) [у формулі X^a являє собою групу, що відходить, таку як атом хлору, 1-імідазоліл, 4-нітрофеноксі або трихлорметоксі, при цьому W^1 і Z^1 мають ті ж самі значення, як зазначено вище], можуть бути одержані за допомогою здійснення реакції сполуки, представленої формулою (8) [у формулі Z^1 має те ж саме значення, як зазначено вище], або її солей та карбонілюючого засобу, із застосуванням розчинника або без нього, із застосуванням за необхідності основи.

В даній реакції може застосовуватись від 0,1 до 100 еквівалентів карбонілюючого засобу на еквівалент сполуки, представленої формулою (8).

В якості застосовуваного карбонілюючого засобу слід зазначити, наприклад, трифосген, 1,1'-карбонілдіімідазол, (4-нітрофеніл)хлорформіат тощо.

[0070] Якщо застосовується розчинник, то застосовуваний розчинник повинен бути інертним по відношенню до реакції, і при цьому слід зазначити, наприклад, полярні розчинники, такі як N,N-диметилформамід, N,N-диметилацетамід, ацетонітрил, диметилсульфоксид і 1,3-диметил-2-імідазоліон, етери, такі як діетиловий етер, тетрагідрофуран, 1,4-діоксан, 1,2-диметоксіетан і дифеніловий етер, ароматичні вуглеводні, такі як бензол, толуол і ксилол, галогеновані вуглеводні, такі як метиленхлорид, хлороформ, чотирьоххлористий вуглець і 1,2-дихлоретан, а також аліфатичні вуглеводні, такі як н-пентан і н-гексан. Ці розчинники можуть застосовуватись окремо або можуть застосовуватись суміші з 2 або більше з них.

[0071] Якщо застосовується основа, то в якості основи можуть застосовуватись органічні основи, такі як триетиламін, піридин, 4-(диметиламіно)піридин і діізопропілетиламін, або

неорганічні основи, такі як карбонат калію або карбонат натрію, при цьому може застосовуватись від 0,1 до 50 еквівалентів на еквівалент сполуки, представленої формулою (8).

Температура реакції може бути встановлена при будь-якій температурі від -78°C до температури кипіння реакційної суміші, при цьому час реакції варіюється в залежності від концентрацій субстратів реакції і температури реакції, але зазвичай встановлюється в діапазоні від 5 хвилин до 100 годин.

[0072] Сполуки, представлені формулою (5b), можуть бути одержані за допомогою звичайної обробки реакційної суміші після закінчення реакції за допомогою безпосереднього концентрування або концентрування після розчинення в органічному розчиннику і промивання водою, або виливання у воду з льодом і концентрування після екстракції органічним розчинником. Крім того, якщо необхідне очищення, вони можуть бути виділені й очищені за допомогою будь-яких способів очищення, таких як перекристалізація, фракціонування способом колонкової хроматографії, тонкошарової хроматографії й рідинної хроматографії.

Крім того, сполуки, представлені формулою (5b) і одержані цим способом, можуть застосовуватись як такі на наступній стадії реакції без виділення й очищення.

Деякі сполуки, представлені формулою (8), являють собою відомі сполуки і деякі з них можуть бути одержані як комерційні продукти.

[0073] (Стадія одержання 2)

Сполуки, представлені формулою (6), можуть бути одержані за допомогою здійснення реакції сполуки, представленої формулою (5b), або її солей і сполуки, представленої формулою (4), або її солей із застосуванням розчинника або без нього, із застосуванням за необхідності основи.

В даній реакції може застосовуватись від 0,1 до 100 еквівалентів сполуки, представленої формулою (4), на еквівалент сполуки, представленої формулою (5b).

[0074] Якщо застосовується розчинник, то застосовуваний розчинник повинен бути інертним по відношенню до реакції, і при цьому слід зазначити, наприклад, полярні розчинники, такі як N,N-диметилформамід, N,N-диметилацетамід, ацетонітрил, диметилсульфоксид і 1,3-диметил-2-імідазоліон, етери, такі як діетиловий етер, тетрагідрофуран, 1,4-діоксан, 1,2-диметоксіетан і дифеніловий етер, ароматичні вуглеводні, такі як бензол, толуол і ксилол, галогеновані вуглеводні, такі як метиленхлорид, хлороформ, чотирьоххлористий вуглець і 1,2-дихлоретан, а також аліфатичні вуглеводні, такі як n-пентан і n-гексан. Ці розчинники можуть застосовуватись окремо або можуть застосовуватись суміші з 2 або більше з них.

[0075] Якщо застосовується основа, то в якості основи можуть застосовуватись органічні основи, такі як триетиламін, піридин, 4-(диметиламіно)піридин і діізопропілетиламін, або неорганічні основи, такі як карбонат калію або карбонат натрію, при цьому може застосовуватись від 0,1 до 50 еквівалентів на еквівалент сполуки, представленої формулою (5b).

Температура реакції може бути встановлена при будь-якій температурі від -78°C до температури кипіння реакційної суміші, при цьому час реакції варіюється в залежності від концентрацій субстратів реакції і температури реакції, але зазвичай встановлюється в діапазоні від 5 хвилин до 100 годин.

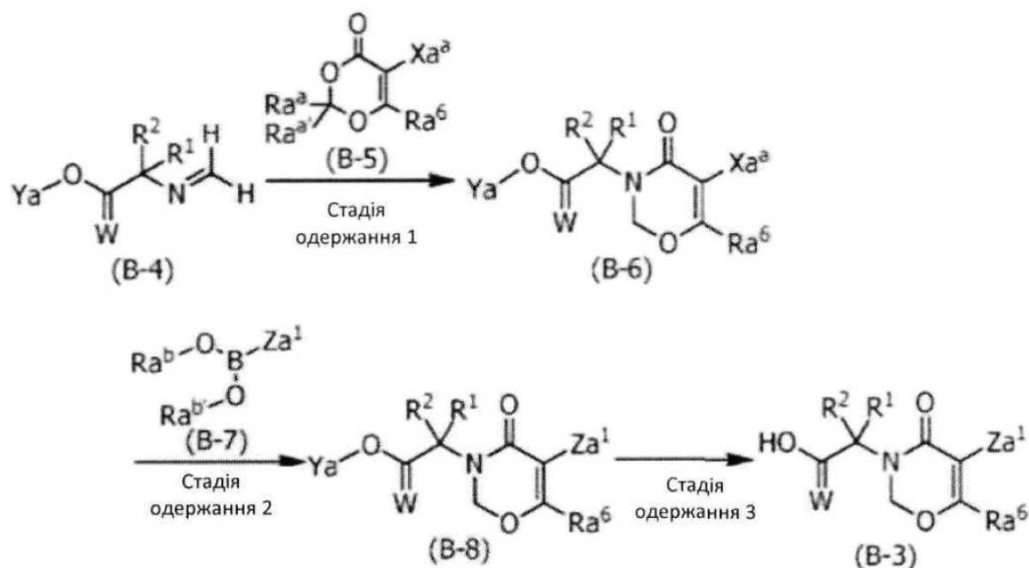
[0076] Сполуки, представлені формулою (6), можуть бути одержані за допомогою звичайної обробки реакційної суміші після закінчення реакції за допомогою безпосереднього концентрування або концентрування після розчинення в органічному розчиннику і промивання водою, або виливання у воду з льодом і концентрування після екстракції органічним розчинником. Крім того, якщо необхідне очищення, вони можуть бути виділені і очищені за допомогою будь-яких способів очищення, таких як перекристалізація, фракціонування способом колонкової хроматографії, тонкошарової хроматографії й рідинної хроматографії.

Крім того, сполуки, представлені формулою (6), одержані цим способом, можуть застосовуватись як такі на наступній стадії реакції без виділення й очищення.

[0077] Деякі сполуки, представлені формулою (B-3), можуть бути синтезовані згідно зі схемою реакції 3, показаною нижче.

Схема реакції 3

[Хім. 15]



[0078] (Стадія одержання 1)

Сполуки, представлені формулою (B-6) [у формулі X^a , Y^a , W , R^1 , R^2 і R^a мають ті ж самі значення, як зазначено вище], можуть бути одержані за допомогою здійснення реакції сполуки, представлені формулою (B-4) [у формулі Y^a являє собою C_1 - C_6 алкіл, такий як метил або етил, або C_1 - C_6 алкіл, заміщений фенолом або п-нітрофенолом або їм подібні, при цьому W , R^1 і R^2 мають ті ж самі значення, як зазначено вище], або її солей і сполуки, представлені формулою (B-5) [у формулі X^a являє собою атом галогену, такий як атом броду або атом йоду, R^a і R^b являють собою C_1 - C_6 алкіл, такий як метил, при цьому R^a має те ж саме значення, як зазначено вище], або її солей із застосуванням розчинника або без нього, із застосуванням за необхідності кислоти.

В даній реакції може застосовуватись від 0,1 до 100 еквівалентів сполуки, представлені формулою (B-5), на еквівалент сполуки, представлені формулою (B-4).

[0079] Якщо застосовується розчинник, то застосовуваний розчинник повинен бути інертним по відношенню до реакції, і при цьому слід зазначити, наприклад, полярні розчинники, такі як N,N-диметилформамід, N,N-диметилацетамід, ацетонітрил, диметилсульфоксид і 1,3-диметил-2-імідазоліон, етери, такі як діетиловий етер, тетрагідрофуран, 1,4-діоксан, 1,2-диметоксіетан і дифеніловий етер, ароматичні вуглеводні, такі як бензол, толуол і ксилол, галогеновані вуглеводні, такі як метиленхлорид, хлороформ, чотирьоххлористий вуглець і 1,2-дихлоретан, а також аліфатичні вуглеводні, такі як н-пентан і н-гексан. Ці розчинники можуть застосовуватись окремо або можуть застосовуватись суміші з 2 або більше з них.

[0080] Якщо застосовується кислота, то в якості кислоти може застосовуватись соляна кислота, сірчана кислота, мурашина кислота, оцтова кислота, трифтороцтова кислота, метансульфонова кислота тощо, при цьому може застосовуватись від 0,1 до 100 еквівалентів на еквівалент сполуки, представлені формулою (B-4).

Температура реакції може бути встановлена при будь-якій температурі від -78°C до температури кипіння реакційної суміші, при цьому час реакції варіюється в залежності від концентрацій субстратів реакції і температури реакції, але зазвичай встановлюється в діапазоні від 5 хвилин до 100 годин.

[0081] Сполуки, представлені формулою (B-4), можуть бути одержані за допомогою звичайної обробки реакційної суміші після закінчення реакції за допомогою безпосереднього концентрування або концентрування після розчинення в органічному розчиннику і промивання водою, або виливання у воду з льодом і концентрування після екстракції органічним розчинником. Крім того, якщо необхідне очищення, вони можуть бути виділені й очищені за допомогою будь-яких способів очищення, таких як перекристалізація, фракціонування способом колонкової хроматографії, тонкошарової хроматографії й рідинної хроматографії.

Крім того, сполуки, представлені формулою (B-6), одержані цим способом, можуть застосовуватись як такі на наступній стадії реакції без виділення й очищення.

Деякі сполуки, представлені формулою (B-4), являють собою відомі сполуки і можуть бути одержані загальновідомими способами. Наприклад, вони можуть бути легко одержані

способами, описаними у викладеному для загального ознайомлення описі міжнародної заявки № 95/18113 тощо.

Деякі сполуки, представлені формулою (B-5), являють собою відомі сполуки і можуть бути одержані загальновідомими способами. Наприклад, вони можуть бути легко одержані способами, описаними у викладеній для загального ознайомлення публікації заявки на патент Японії № 4-89485 тощо.

[0082] (Стадія одержання 2)

Сполуки, представлені формулою (B-8) [у формулі Y_a , Za^1 , W , R^1 , R^2 і Ra^6 мають ті ж самі значення, як зазначено вище], можуть бути одержані за допомогою здійснення реакції сполуки, представленої формулою (B-6), або її солей і сполуки, представленої формулою (B-7) [у формулі Ra^b і Ra^b являють собою атом водню або C_1 - C_6 алкіл, такий як метил, при цьому Za^1 має те ж саме значення, як зазначено вище], або її солей із застосуванням розчинника або без нього, із застосуванням за необхідності основи і за необхідності каталізатора, після додавання за необхідності добавок.

В даній реакції може застосовуватись від 0,1 до 100 еквівалентів сполуки, представленої формулою (B-7), на еквівалент сполуки, представленої формулою (B-6).

[0083] Якщо застосовується розчинник, то застосовуваний розчинник повинен бути інертним по відношенню до реакції, і при цьому слід зазначити, наприклад, полярні розчинники, такі як N,N-диметилформамід, N,N-диметилацетамід, ацетонітрil, диметилсульфоксид, а також 1,3-диметил-2-імідазолінон і воду, етери, такі як діетиловий етер, тетрагідрофуран, 1,4-діоксан, 1,2-диметоксіетан і дифеніловий етер, спирти, такі як метанол і етанол, ароматичні вуглеводні, такі як бензол, толуол і ксилол, галогеновані вуглеводні, такі як метиленхлорид, хлороформ, чотирьоххлористий вуглець і 1,2-дихлоретан, а також аліфатичні вуглеводні, такі як n-пентан і n-гексан. Ці розчинники можуть застосовуватись окремо або можуть застосовуватись суміші з 2 або більше з них.

[0084] Якщо застосовується основа, то в якості основи можуть застосовуватись органічні основи, такі як триетиламін, піридин, 4-(диметиламіно)піридин і діізопропілетиламін, або неорганічні основи, такі як карбонат калію й карбонат натрію, при цьому може застосовуватись від 0,1 до 50 еквівалентів на еквівалент сполуки, представленої формулою (B-6).

Якщо застосовується каталізатор, то в якості застосовуваного каталізатора слід зазначити, наприклад, комплексні каталізатори, такі як дихлорбіс(трифенілфосфін)паладій, тетракіс(трифенілфосфін)паладій і [1,3-біс(2,6-діізопропілфеніл)імідазол-2-іліден](3-хлорпіридил)паладію(2) дихлорид, при цьому може застосовуватись від 0,001 до 0,5 еквівалента на еквівалент сполуки, представленої формулою (B-6).

Якщо застосовується добавка, то в якості добавки можуть застосовуватись етери, такі як 1,4,7,10,13,16-гексаокса-циклооктадекан, солі четвертинного амонію, такі як тетра-н-бутиламонію бромід тощо, при цьому може застосовуватись від 0,1 до 50 еквівалентів на еквівалент сполуки, представленої формулою (B-6).

Температура реакції може бути встановлена при будь-якій температурі від -78°C до температури кипіння реакційної суміші, при цьому час реакції варіюється в залежності від концентрацій субстратів реакції і температури реакції, але зазвичай встановлюється в діапазоні від 5 хвилин до 100 годин.

[0085] Сполуки, представлені формулою (B-8), можуть бути одержані за допомогою звичайної обробки реакційної суміші після закінчення реакції за допомогою безпосереднього концентрування або концентрування після розчинення в органічному розчиннику і промивання водою, або виливання у воду з льодом і концентрування після екстракції органічним розчинником. Крім того, якщо необхідне очищення, вони можуть бути виділені і очищені за допомогою будь-яких способів очищення, таких як перекристалізація, фракціонування способом колонкової хроматографії, тонкошарової хроматографії й рідинної хроматографії.

Крім того, сполуки, представлені формулою (B-8), одержані цим способом, можуть застосовуватись як такі на наступній стадії реакції без виділення й очищення.

Деякі сполуки, представлені формулою (B-7), являють собою відомі сполуки і деякі з них можуть бути одержані загальновідомими способами як комерційні продукти.

[0086] (Стадія одержання 3)

Сполуки, представлені формулою (B-3) [у формулі W , Za^1 , R^1 , R^2 і Ra^6 мають ті ж самі значення, як зазначено вище], можуть бути одержані за допомогою здійснення реакції сполуки, представленої формулою (B-8), або її солей і основи із застосуванням розчинника або без нього.

В якості застосовуваної основи можуть застосовуватись органічні основи, такі як триетиламін, піридин і 4-(диметиламіно)піридин, або неорганічні основи, такі як карбонат калію,

карбонат натрію, гідроксид калію і гідроксид натрію, при цьому може застосовуватись від 0,1 до 100 еквівалентів на еквівалент сполуки, представленої формулою (B-8).

[0087] Якщо застосовується розчинник, то застосовуваний розчинник повинен бути інертним по відношенню до реакції, і при цьому слід зазначити, наприклад, полярні розчинники, такі як N,N-диметилформамід, N,N-диметилацетамід, ацетонітрил, диметилсульфоксид, а також 1,3-диметил-2-імідазолінон і воду, етери, такі як діетиловий етер, тетрагідрофуран, 1,4-діоксан, 1,2-диметоксіетан і дифеніловий етер, спирти, такі як метанол і етанол, ароматичні вуглеводні, такі як бензол, толуол і ксилол, а також аліфатичні вуглеводні, такі як n-пентан і n-гексан. Ці розчинники можуть застосовуватись окремо або можуть застосовуватись суміші з 2 або більше з них.

[0088] Температура реакції може бути встановлена при будь-якій температурі від -78°C до температури кипіння реакційної суміші, при цьому час реакції варіюється в залежності від концентрацій субстратів реакції і температури реакції, але зазвичай встановлюється в діапазоні від 5 хвилин до 100 годин.

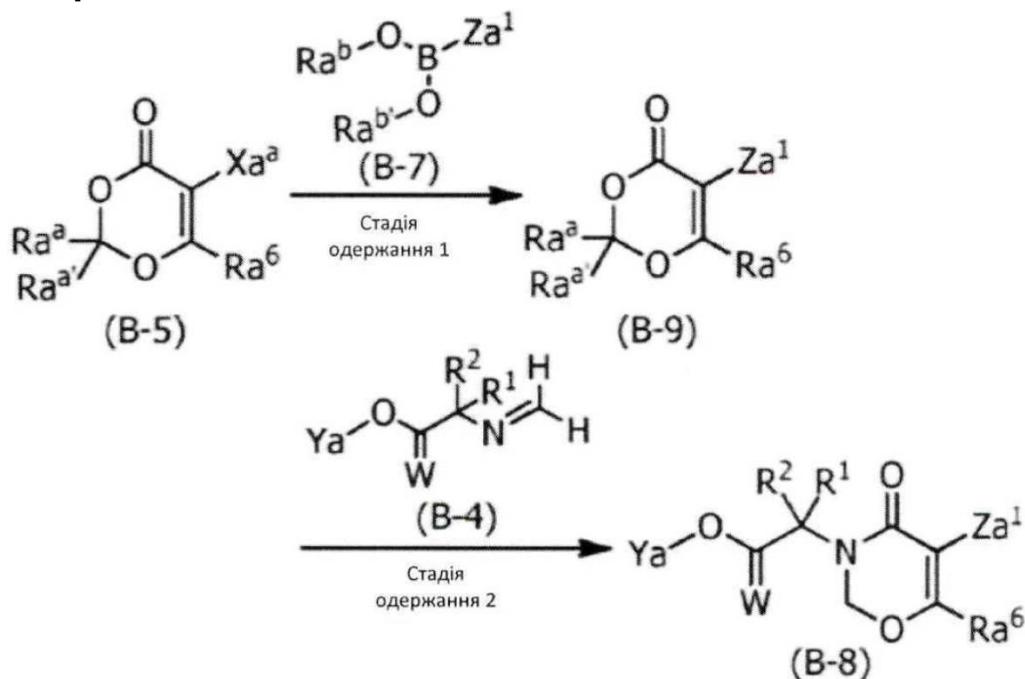
[0089] Проміжні сполуки для одержання, які є вихідними матеріалами для способу одержання A, можуть бути одержані за допомогою звичайної обробки реакційної суміші після закінчення реакції за допомогою безпосереднього концентрування або концентрування після розчинення в органічному розчиннику і промивання водою, або виливання у воду з льодом і концентрування після екстракції органічним розчинником. Крім того, якщо необхідне очищення, вони можуть бути виділені й очищені за допомогою будь-яких способів очищення, таких як перекристалізація, фракціонування способом колонкової хроматографії, тонкошарової хроматографії й рідинної хроматографії.

Крім того, одержані цим способом проміжні сполуки для одержання можуть застосовуватись як такі на наступній стадії реакції без виділення й очищення.

[0090] Деякі сполуки, представлені формулою (B-8), можуть бути синтезовані згідно зі схемою реакції 4, показаною нижче.

Схема реакції 4

[Xim. 16]



[0091] (Стадія одержання 1)

Сполуки, представлені формулою (B-9) [у формулі Za^1 , Ra^a , $Ra^{a'}$ і Ra^6 мають ті ж самі значення, як зазначено вище], можуть бути одержані за допомогою здійснення реакції сполуки, представленої формулою (B-5), або її солей і сполуки, представленої формулою (B-7), або її солей із застосуванням розчинника або без нього, із застосуванням за необхідності основи і за необхідності каталізатора, за необхідності після додавання добавок.

В даній реакції може застосовуватись від 0,1 до 100 еквівалентів сполуки, представленої формулою (B-7), на еквівалент сполуки, представленої формулою (B-5).

[0092] Якщо застосовується розчинник, то застосовуваний розчинник повинен бути інертним по відношенню до реакції, і при цьому слід зазначити, наприклад, полярні розчинники, такі як

N,N-диметилформамід, N,N-диметилацетамід, ацетонітрил, диметилсульфоксид, а також 1,3-диметил-2-імідазолінон і воду, етери, такі як діетиловий етер, тетрагідрофуран, 1,4-діоксан, 1,2-диметоксіетан і дифеніловий етер, спирти, такі як метанол і етанол, ароматичні вуглеводні, такі як бензол, толуол і ксилол, галогеновані вуглеводні, такі як метиленхлорид, хлороформ, чотирьоххлористий вуглець і 1,2-дихлоретан, а також аліфатичні вуглеводні, такі як н-пентан і н-гексан. Ці розчинники можуть застосовуватись окремо або можуть застосовуватись суміші з 2 або більше з них.

[0093] Якщо застосовується основа, то в якості основи можуть застосовуватись органічні основи, такі як триетиламін, піридин, 4-(диметиламіно)піридин і діізопропілетиламін, або неорганічні основи, такі як карбонат калію й карбонат натрію, при цьому може застосовуватись від 0,1 до 50 еквівалентів на еквівалент сполуки, представленої формулою (B-5).

Якщо застосовується каталізатор, то в якості каталізатора слід зазначити, наприклад, комплексні каталізатори, такі як дихлорбіс(трифенілфосфін)паладій, тетракіс(трифенілфосфін)паладій і [1,3-біс(2,6-діізопропілфеніл)імідазол-2-іліден](3-хлорпіридил)паладію(2) дихлорид, при цьому може застосовуватись від 0,001 до 0,5 еквівалента на еквівалент сполуки, представленої формулою (B-5).

Якщо застосовується добавка, то в якості добавки можуть застосовуватись етери, такі як 1,4,7,10,13,16-гексаокса-циклооктадекан, солі четвертинного амонію, такі як тетра-н-бутиламонію бромід тощо, при цьому може застосовуватись від 0,1 до 50 еквівалентів на еквівалент сполуки, представленої формулою (B-5).

Температура реакції може бути встановлена при будь-якій температурі від -78°C до температури кипіння реакційної суміші, при цьому час реакції варіюється в залежності від концентрацій субстратів реакції і температури реакції, але зазвичай встановлюється в діапазоні від 5 хвилин до 100 годин.

[0094] Сполуки, представлені формулою (B-9), можуть бути одержані за допомогою звичайної обробки реакційної суміші після закінчення реакції за допомогою безпосереднього концентрування або концентрування після розчинення в органічному розчиннику і промивання водою, або виливання у воду з льодом і концентрування після екстракції органічним розчинником. Крім того, якщо необхідне очищення, вони можуть бути виділені й очищені за допомогою будь-яких способів очищення, таких як перекристалізація, фракціонування способом колонкової хроматографії, тонкошарової хроматографії й рідинної хроматографії.

Крім того, сполуки, представлені формулою (B-9), одержані цим способом, можуть застосовуватись як такі на наступній стадії реакції без виділення й очищення.

[0095] (Стадія одержання 2)

Сполуки, представлені формулою (B-8), можуть бути одержані за допомогою здійснення реакції сполуки, представленої формулою (B-4), або її солей і сполуки, представленої формулою (B-9), або її солей із застосуванням розчинника або без нього, із застосуванням за необхідності кислоти.

В даній реакції може застосовуватись від 0,1 до 100 еквівалентів сполуки, представленої формулою (B-9), на еквівалент сполуки, представленої формулою (B-4).

[0096] Якщо застосовується розчинник, то застосовуваний розчинник повинен бути інертним по відношенню до реакції і при цьому слід зазначити, наприклад, полярні розчинники, такі як N,N-диметилформамід, N,N-диметилацетамід, ацетонітрил, диметилсульфоксид і 1,3-диметил-2-імідазолінон, етери, такі як діетиловий етер, тетрагідрофуран, 1,4-діоксан, 1,2-диметоксіетан і дифеніловий етер, ароматичні вуглеводні, такі як бензол, толуол і ксилол, галогеновані вуглеводні, такі як метиленхлорид, хлороформ, чотирьоххлористий вуглець і 1,2-дихлоретан, а також аліфатичні вуглеводні, такі як н-пентан і н-гексан. Ці розчинники можуть застосовуватись окремо або можуть застосовуватись суміші з 2 або більше з них.

[0097] Якщо застосовується кислота, то в якості застосовуваної кислоти може застосовуватись соляна кислота, сірчана кислота, мурашина кислота, оцтова кислота, трифтороцтова кислота, метансульфонова кислота тощо, при цьому може застосовуватись від 0,1 до 100 еквівалентів на еквівалент сполуки, представленої формулою (B-4).

Температура реакції може бути встановлена при будь-якій температурі від -78°C до температури кипіння реакційної суміші, при цьому час реакції варіюється в залежності від концентрацій субстратів реакції і температури реакції, але зазвичай встановлюється в діапазоні від 5 хвилин до 100 годин.

[0098] Сполуки, представлені формулою (B-8), можуть бути одержані за допомогою звичайної обробки реакційної суміші після закінчення реакції за допомогою безпосереднього концентрування або концентрування після розчинення в органічному розчиннику і промивання водою, або виливання у воду з льодом і концентрування після екстракції органічним

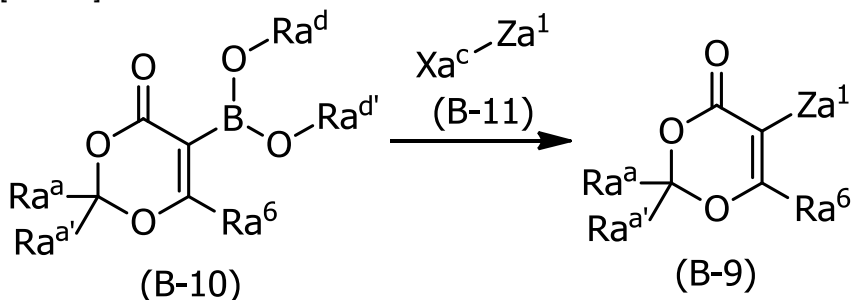
розчинником. Крім того, якщо необхідне очищення, вони можуть бути виділені й очищені за допомогою будь-яких способів очищення, таких як перекристалізація, фракціонування способом колонкової хроматографії, тонкошарової хроматографії й рідинної хроматографії.

Крім того, сполуки, представлені формулою (B-8), одержані цим способом, можуть застосовуватись як такі на наступній стадії реакції без виділення й очищення.

[0099] Деякі сполуки, представлені формулою (B-9), можуть бути синтезовані згідно зі схемою реакції 5, показаною нижче.

Схема реакції 5

[Xim. 17]



[0100] Сполуки, представлені формулою (B-9), можуть бути одержані за допомогою здійснення реакції сполуки, представлені формулою (B-10) [у формулі Ra^d і $Ra^{d'}$ являють собою атом водню або C_1 - C_6 алкіл, такий як метил, при цьому Ra^a , $Ra^{a'}$ і Ra^6 мають ті ж самі значення, як зазначено вище], або її солей і сполуки, представлені формулою (B-11) [у формулі Xa^c являє собою атом галогену, такий як атом бромі або атом йоду, при цьому Za^1 має ті ж самі значення, як зазначено вище], або її солей із застосуванням розчинника або без нього, із застосуванням за необхідності основи, за необхідності розчинника, за необхідності після додавання добавок.

В даній реакції може застосовуватись від 0,1 до 100 еквівалентів сполуки, представлені формулою (B-11), на еквівалент сполуки, представлені формулою (B-10).

[0101] Якщо застосовується розчинник, то застосовуваний розчинник повинен бути інертним по відношенню до реакції, і при цьому слід зазначити, наприклад, полярні розчинники, такі як N,N-диметилформамід, N,N-диметилацетамід, ацетонітрил, диметилсульфоксид, а також 1,3-диметил-2-імідазолінон і воду, етери, такі як діетиловий етер, тетрагідрофуран, 1,4-діоксан, 1,2-диметоксіетан і дифеніловий етер, спирти, такі як метанол і етанол, ароматичні вуглеводні, такі як бензол, толуол і ксилол, галогеновані вуглеводні, такі як метиленхлорид, хлороформ, чотирьоххлористий вуглець і 1,2-дихлоретан, а також аліфатичні вуглеводні, такі як n-пентан і n-гексан. Ці розчинники можуть застосовуватись окремо або можуть застосовуватись суміші з 2 або більше з них.

[0102] Якщо застосовується основа, то в якості застосовуваної основи можуть застосовуватись органічні основи, такі як триетиламін, піридин, 4-(диметиламіно)піридин і діізопропілетиламін, або неорганічні основи, такі як карбонат калію й карбонат натрію, при цьому може застосовуватись від 0,1 до 50 еквівалентів на еквівалент сполуки, представлені формулою (B-10).

Якщо застосовується каталізатор, то в якості застосовуваного каталізатора слід зазначити, наприклад, комплексні каталізатори, такі як дихлорбіс(трифенілфосфін)паладій, тетракіс(трифенілфосфін)паладій і [1,3-біс(2,6-діізопропілфеніл)імідазол-2-іліден](3-хлорпіридил)паладію(2) дихлорид, при цьому може застосовуватись від 0,001 до 0,5 еквівалента на еквівалент сполуки, представлені формулою (B-10).

Якщо застосовується добавка, то в якості добавки можуть застосовуватись етери, такі як 1,4,7,10,13,16-гексаокса-циклооктадекан, солі четвертинного амонію, такі як тетра-н-бутиламонію бромід тощо, при цьому може застосовуватись від 0,1 до 50 еквівалентів на еквівалент сполуки, представлені формулою (B-10).

Температура реакції може бути встановлена при будь-якій температурі від -78°C до температури кипіння реакційної суміші, при цьому час реакції варіюється в залежності від концентрацій субстратів реакції і температури реакції, але зазвичай встановлюється в діапазоні від 5 хвилин до 100 годин.

[0103] Сполуки, представлені формулою (B-9), можуть бути одержані за допомогою звичайної обробки реакційної суміші після закінчення реакції за допомогою безпосереднього концентрування або концентрування після розчинення в органічному розчиннику і промивання водою, або виливання у воду з льодом і концентрування після екстракції органічним

розчинником. Крім того, якщо необхідне очищення, вони можуть бути виділені й очищені за допомогою будь-яких способів очищення, таких як перекристалізація, фракціонування способом колонкової хроматографії, тонкошарової хроматографії й рідинної хроматографії.

Крім того, сполуки, представлені формулою (B-9), одержані цим способом, можуть застосовуватись як такі на наступній стадії реакції без виділення й очищення.

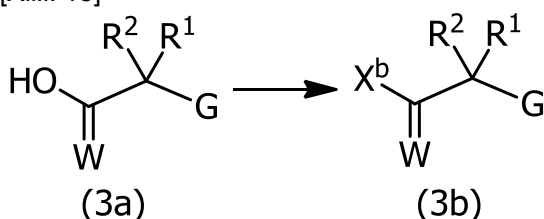
Деякі сполуки, представлені формулою (B-10), являють собою відомі сполуки і можуть бути одержані загальновідомими способами. Наприклад, вони легко можуть бути одержані способами, описаними в Organic Letters, 2006, Vol.8, p.305.

Деякі сполуки, представлені формулою (B-11), являють собою відомі сполуки і деякі з них можуть бути одержані як комерційні продукти.

[0104] Деякі сполуки, представлені формулою (3b), можуть бути синтезовані згідно зі схемою реакції 6, показаною нижче.

Схема реакції 6

[Хім. 18]



[0105] Сполуки, представлені формулою (3b), можуть бути одержані за допомогою здійснення реакції сполуки, представлені формулою (3a), або її солей і галогенізуючого засобу, із застосуванням розчинника або без нього, із застосуванням за необхідності основи.

В якості застосовуваного галогенізуючого засобу слід зазначити, наприклад, тіонілхлорид, оксалілхлорид, фосфорилхлорид і їм подібні. Що стосується еквівалентів галогенізуючого засобу, може застосовуватись від 0,1 до 100 еквівалентів на еквівалент сполуки, представлені формулою (3a).

[0106] Якщо застосовується розчинник, то застосовуваний розчинник повинен бути інертним по відношенню до реакції, і при цьому слід зазначити, наприклад, полярні розчинники, такі як N,N-диметилформамід, N,N-диметилацетамід, ацетонітрил, диметилсульфоксид і 1,3-диметил-2-імідазоліон, етери, такі як діетиловий етер, тетрагідрофуран, 1,4-діоксан, 1,2-диметоксіетан і дифеніловий етер, ароматичні вуглеводні, такі як бензол, толуол і ксилол, галогеновані вуглеводні, такі як метиленхлорид, хлороформ, чотирьоххлористий вуглець і 1,2-дихлоретан, а також аліфатичні вуглеводні, такі як n-пентан і n-гексан. Ці розчинники можуть застосовуватись окремо або можуть застосовуватись суміші з 2 або більше з них.

[0107] Якщо застосовується основа, то в якості застосовуваної основи можуть застосовуватись органічні основи, такі як триетиламін, піридин і 4-(диметиламіно)піридин, або неорганічні основи, такі як карбонат калію й карбонат натрію, при цьому може застосовуватись від 0,1 до 50 еквівалентів на еквівалент сполуки, представлені формулою (3a). Ці основи можуть застосовуватись окремо або можуть застосовуватись суміші з 2 або більше з них.

Температура реакції може бути встановлена при будь-якій температурі від -78°C до температури кипіння реакційної суміші, при цьому час реакції варіюється в залежності від концентрацій субстратів реакції і температури реакції, але зазвичай встановлюється в діапазоні від 5 хвилин до 100 годин.

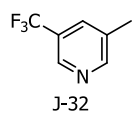
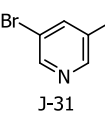
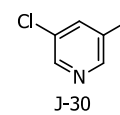
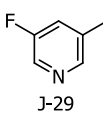
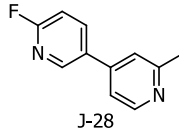
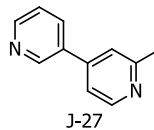
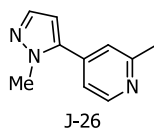
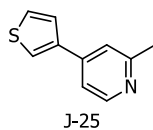
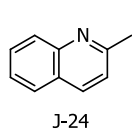
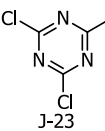
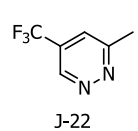
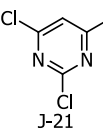
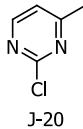
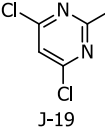
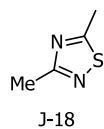
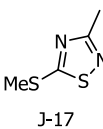
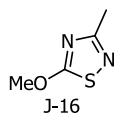
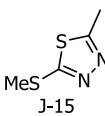
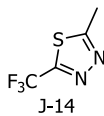
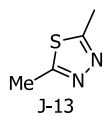
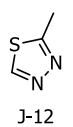
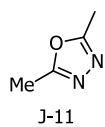
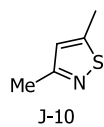
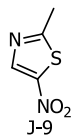
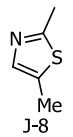
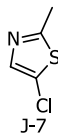
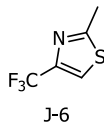
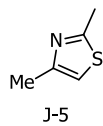
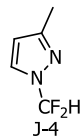
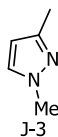
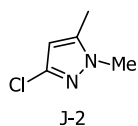
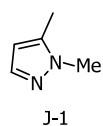
[0108] Проміжні сполуки для одержання, які являють собою вихідні матеріали для способу одержання B, можуть бути одержані за допомогою звичайної обробки після закінчення реакції.

Крім того, одержані цим способом проміжні сполуки для одержання можуть застосовуватись як такі на наступній стадії реакції без виділення й очищення.

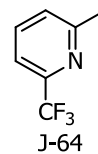
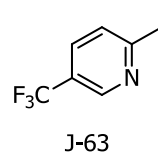
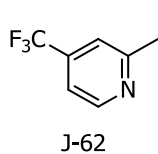
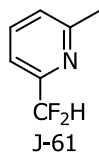
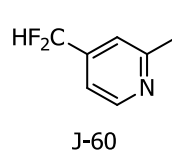
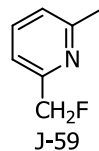
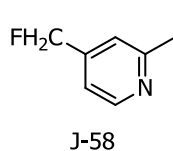
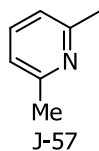
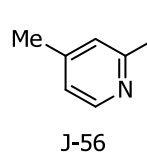
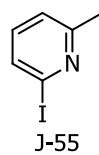
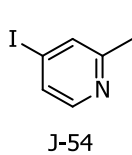
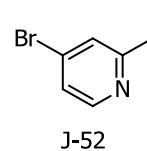
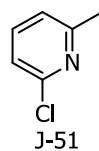
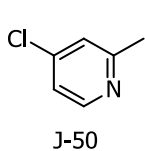
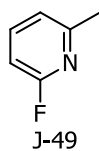
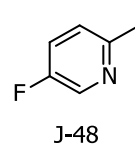
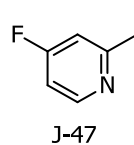
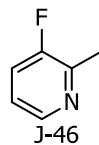
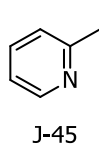
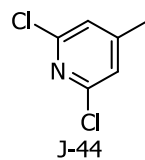
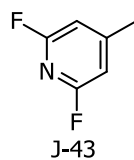
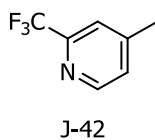
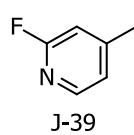
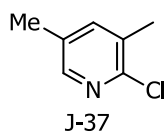
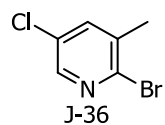
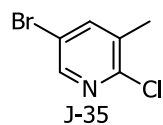
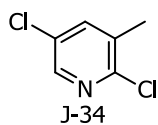
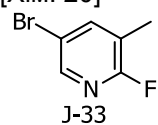
[0109] В якості активних сполук, включених в даний винахід, слід зазначити сполуки, показані в таблицях № 1-№ 2. Однак, сполуки в таблицях № 1-№ 2 наведено для прикладу й даний винахід не обмежується лише ними. Також в таблицях вираз Me являє собою метильну групу, і аналогічно нижче Et являє собою етильну групу, Pr являє собою пропильну групу, OMe являє собою метоксигрупу, OEt являє собою етоксигрупу, OPh являє собою феноксигрупу, SMe являє собою метилтіогрупу, Ph являє собою фенільну групу, CO₂Me являє собою метоксикарбонільну групу, n- означає нормальний, i- означає ізо і c- означає цикло, відповідно.

[0110] В таблицях структури ароматичних гетероциклічних кілець, представлених з J-1 по J-119 і з Ja-1 по Ja-85 відповідно, показані нижче.

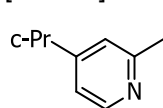
[Xim. 19]



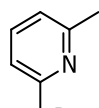
[Xim. 20]



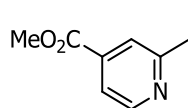
[Xim. 21]



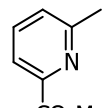
J-65



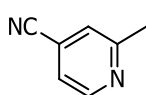
J-66



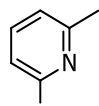
J-67



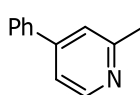
J-68



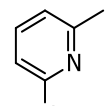
J-69



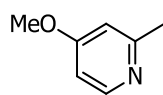
J-70



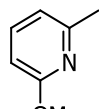
J-71



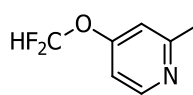
J-72



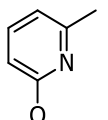
J-73



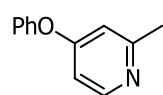
J-74



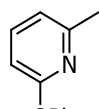
J-75



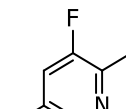
J-76



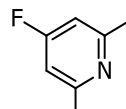
J-77



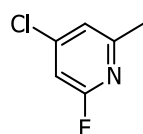
J-78



J-79



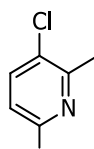
J-80



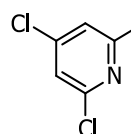
J-81



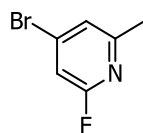
J-82



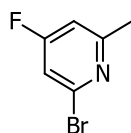
J-83



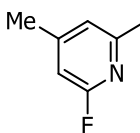
J-84



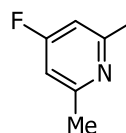
J-85



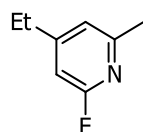
J-86



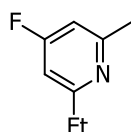
J-87



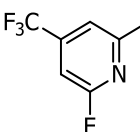
J-88



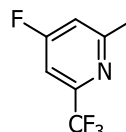
J-89



J-90

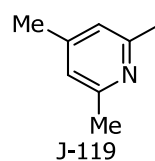
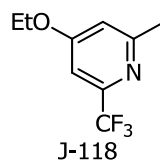
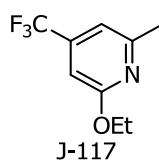
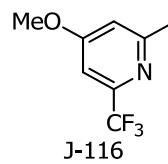
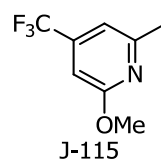
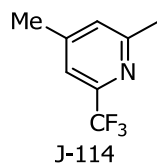
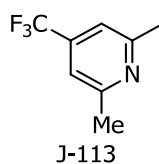
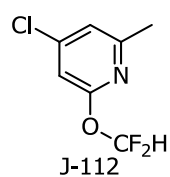
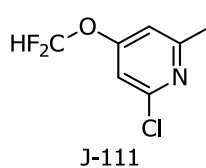
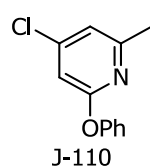
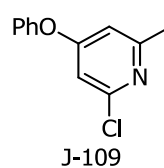
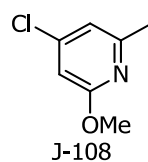
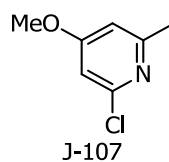
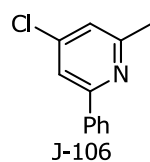
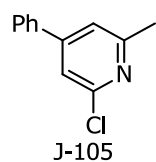
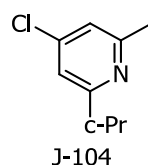
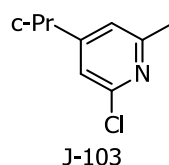
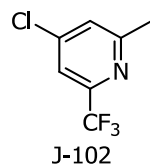
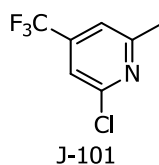
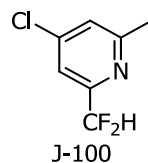
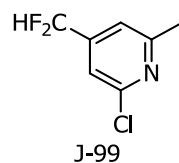
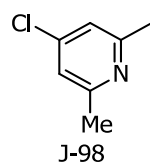
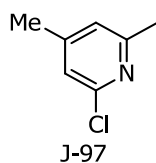
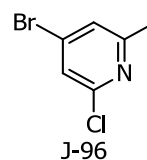
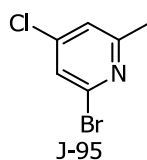
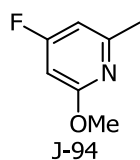
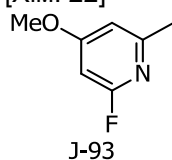


J-91

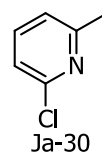
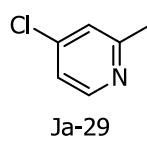
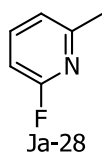
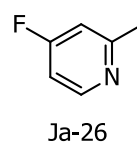
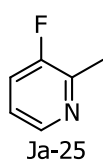
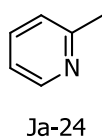
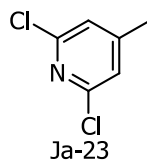
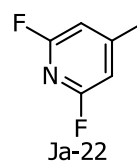
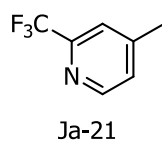
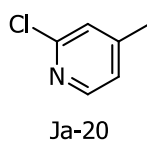
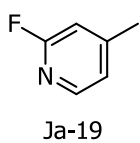
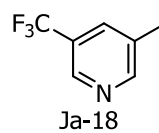
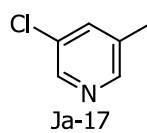
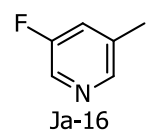
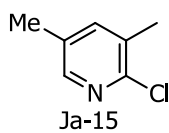
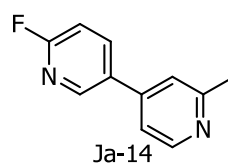
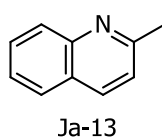
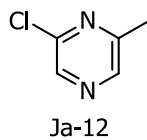
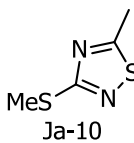
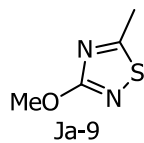
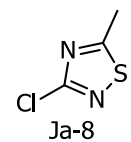
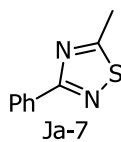
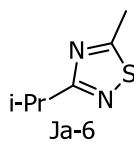
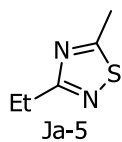
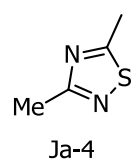
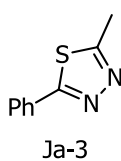
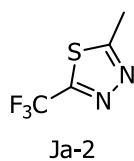
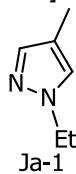


J-92

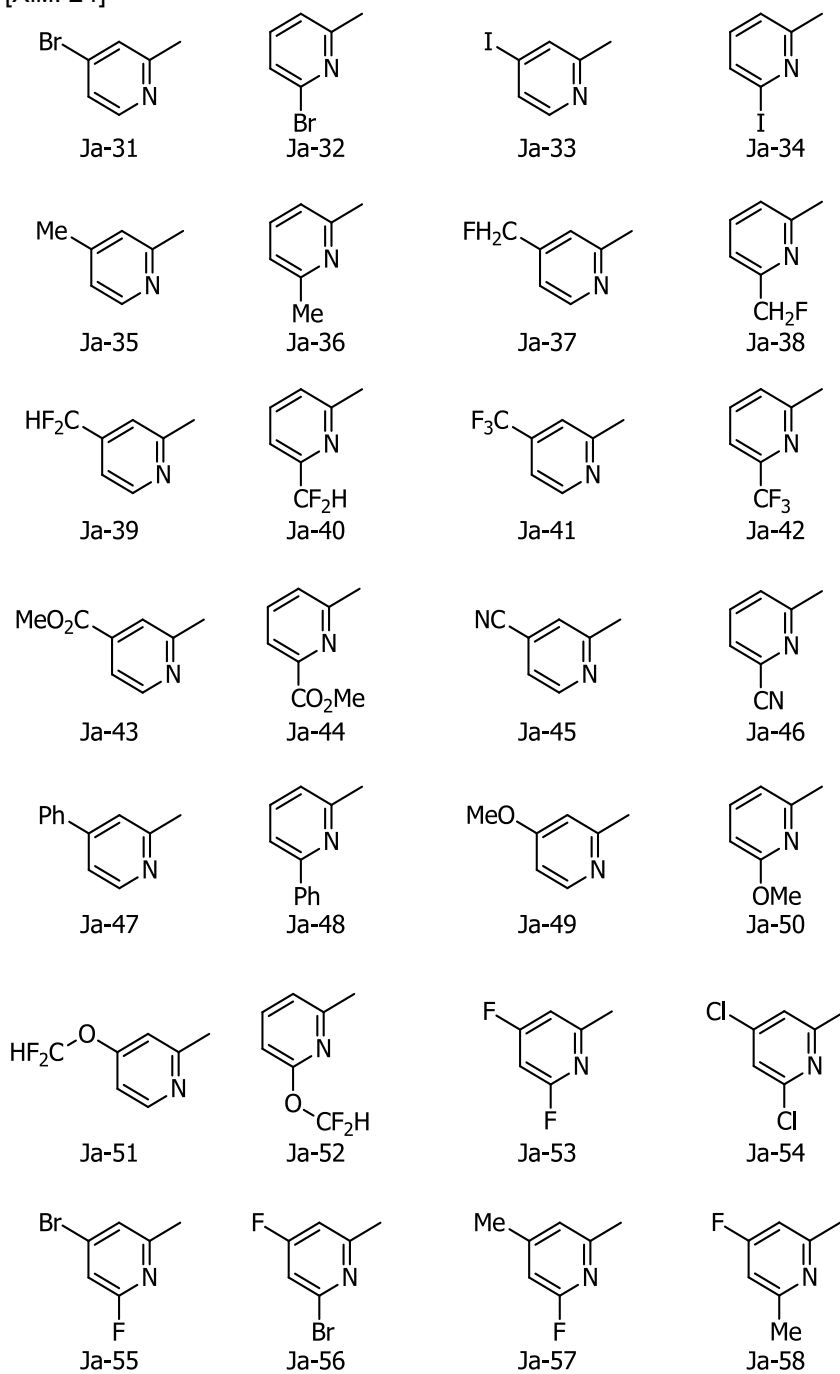
[Xim. 22]



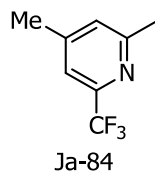
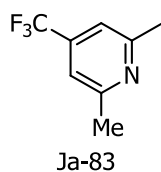
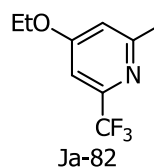
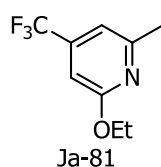
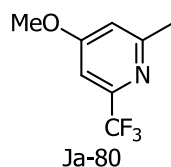
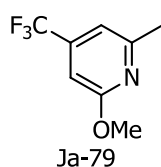
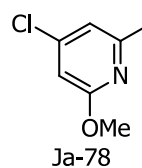
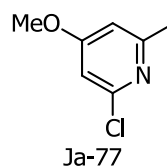
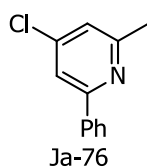
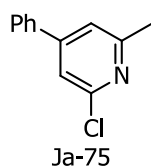
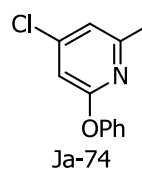
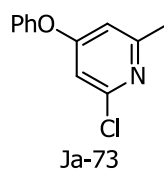
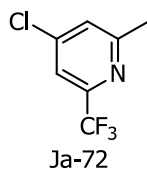
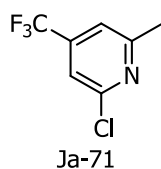
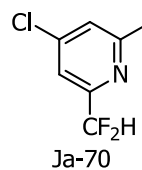
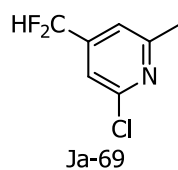
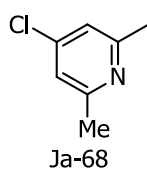
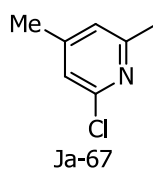
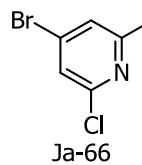
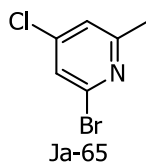
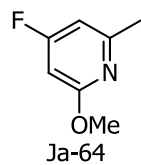
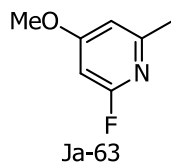
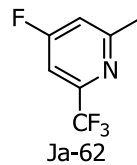
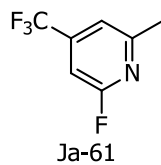
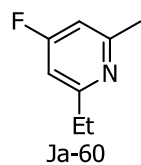
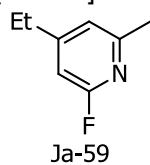
[Xim. 23]



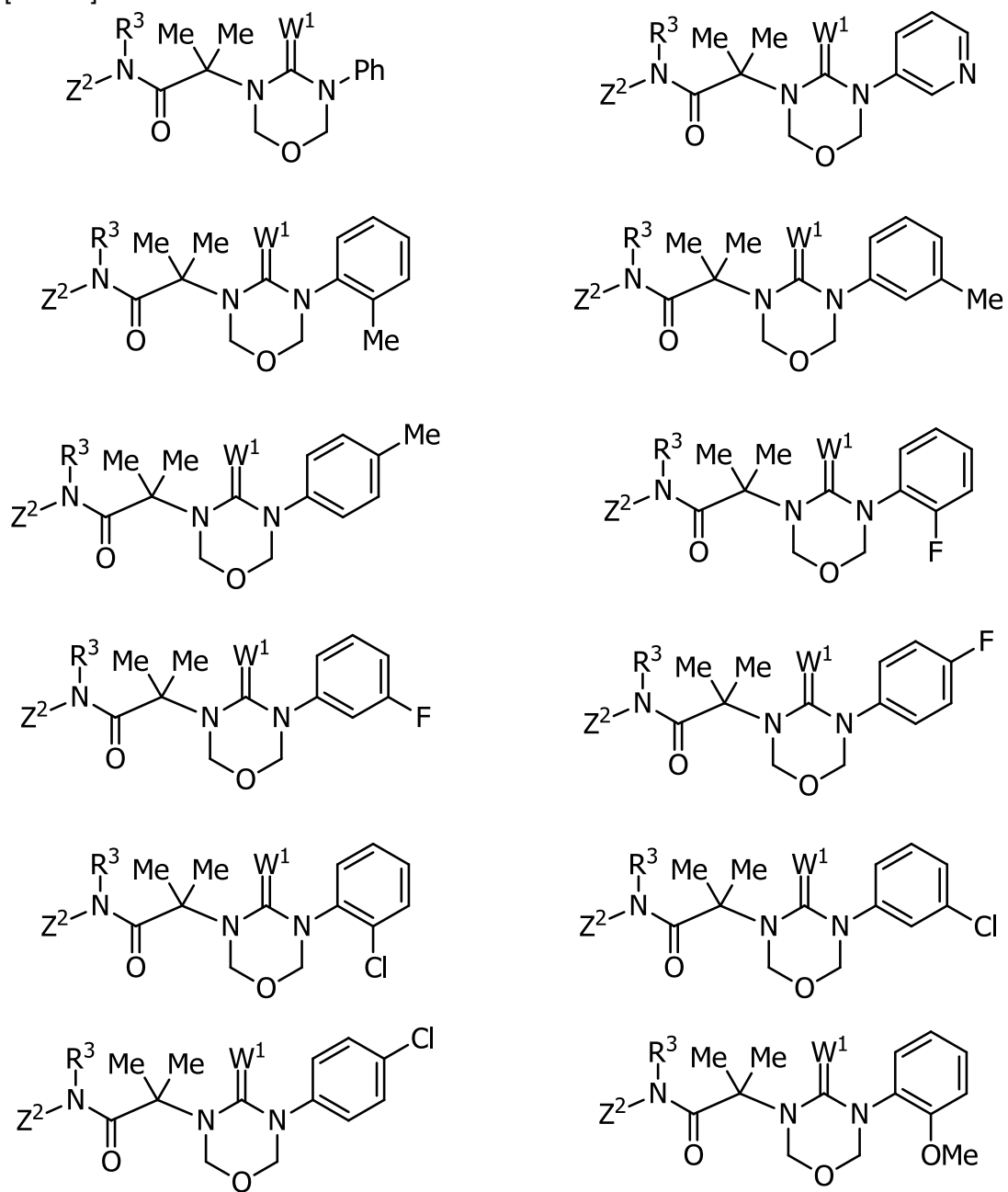
[Xim. 24]



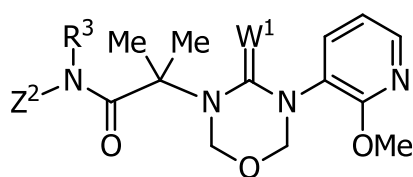
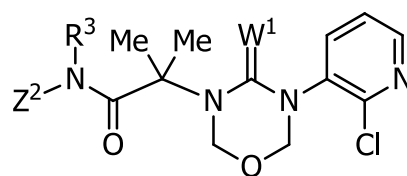
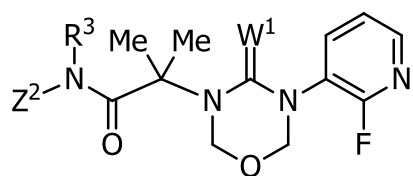
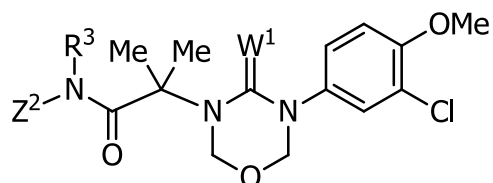
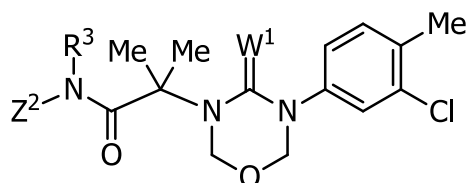
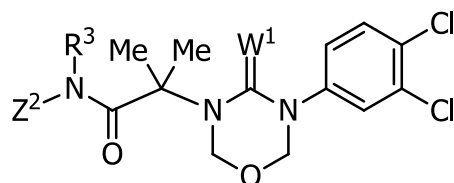
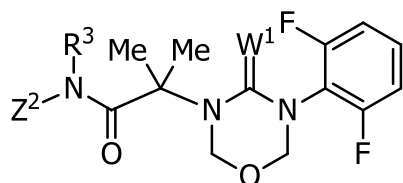
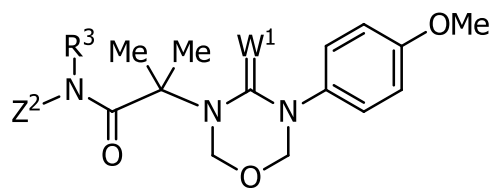
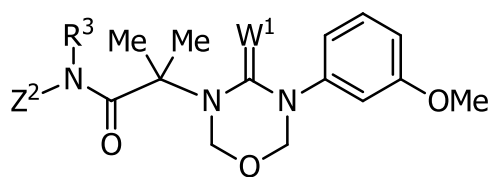
[Xim. 25]



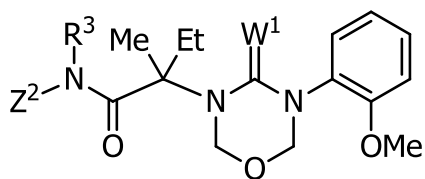
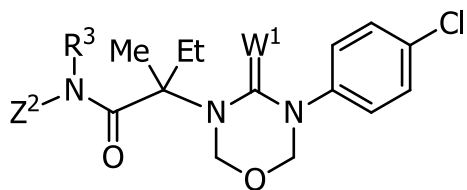
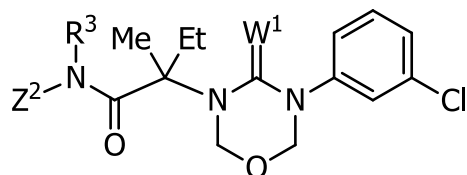
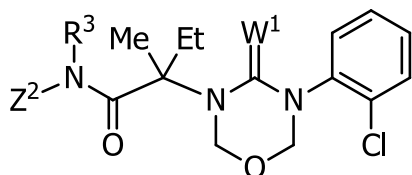
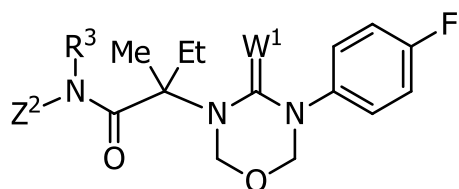
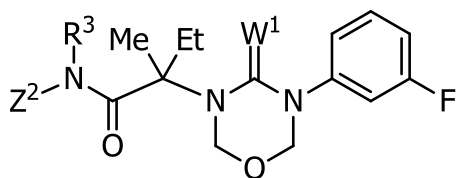
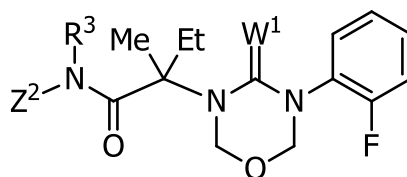
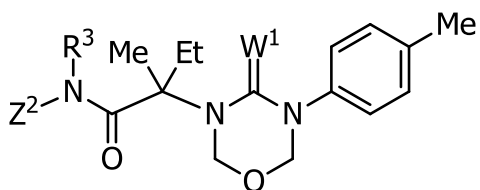
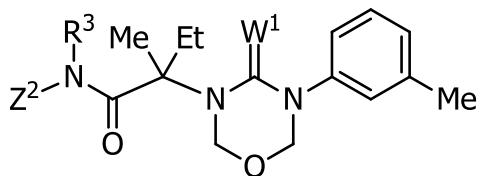
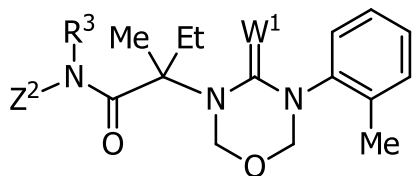
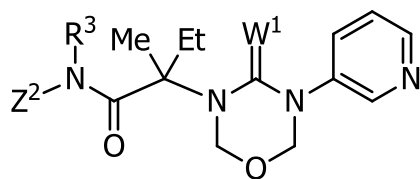
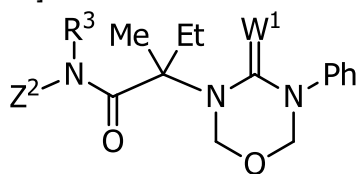
[0111] [Таблица № 1]
[Хим. 26]



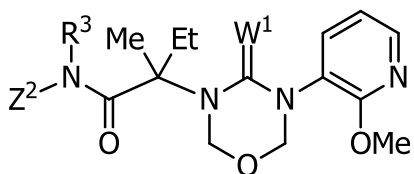
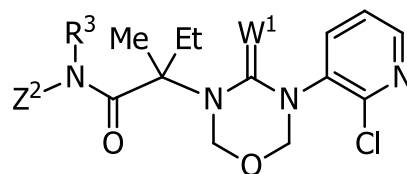
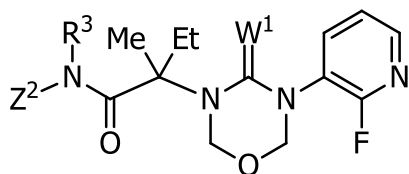
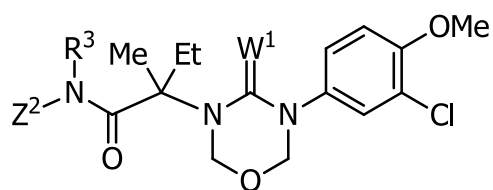
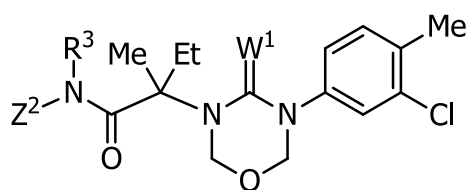
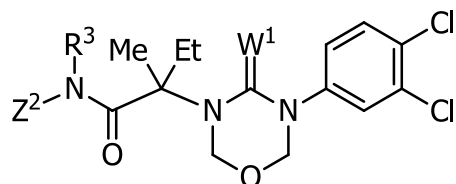
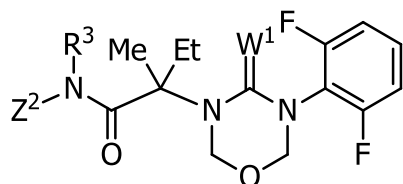
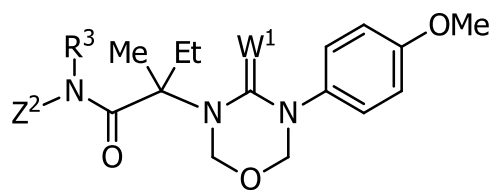
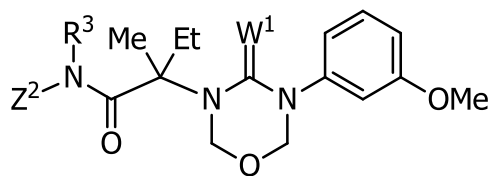
[Xim. 27]



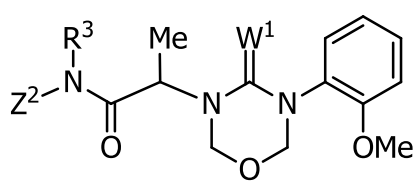
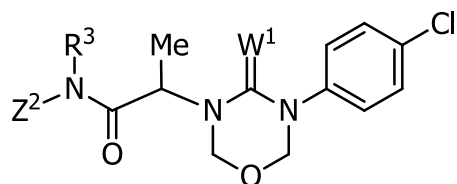
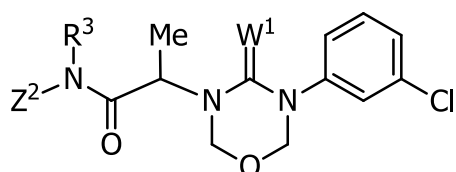
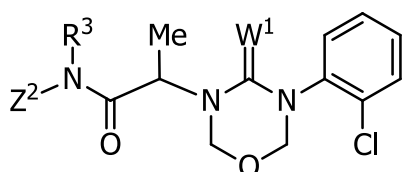
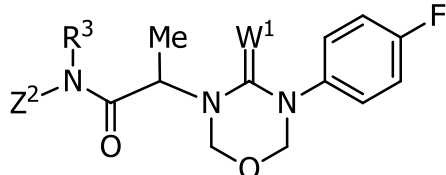
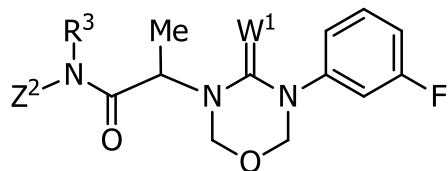
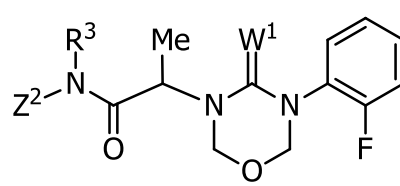
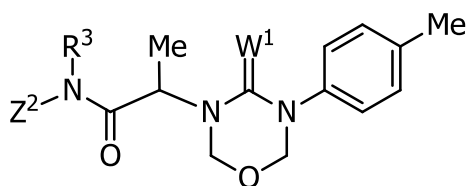
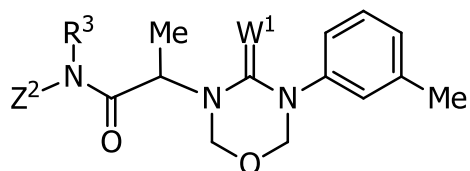
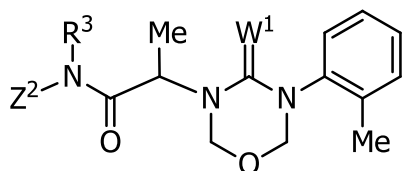
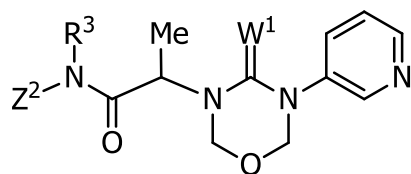
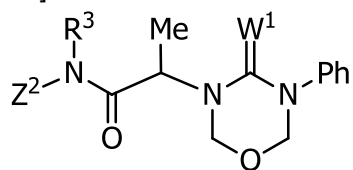
[Xim. 28]



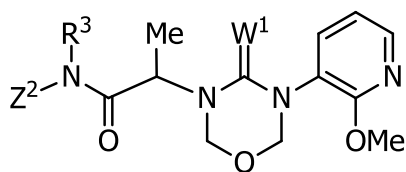
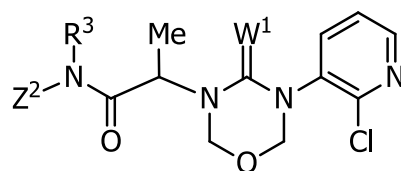
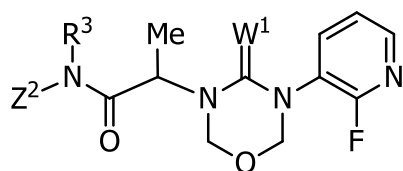
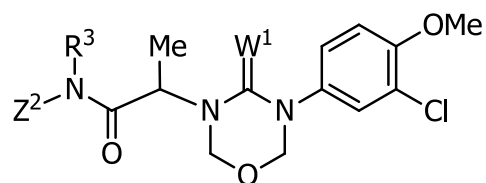
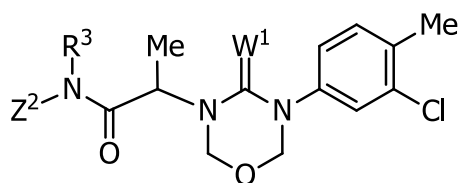
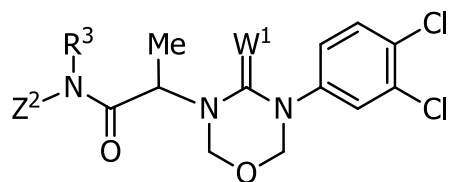
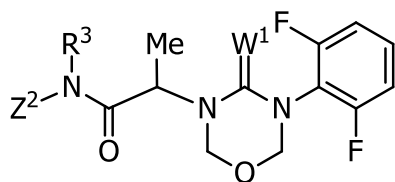
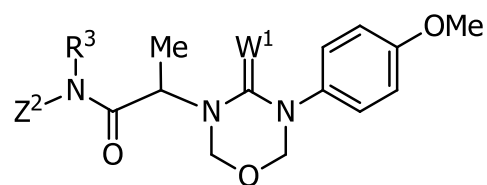
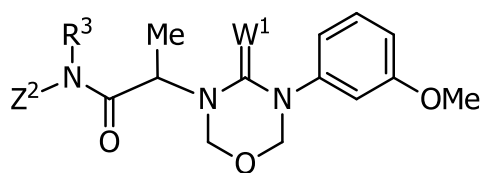
[Xim. 29]



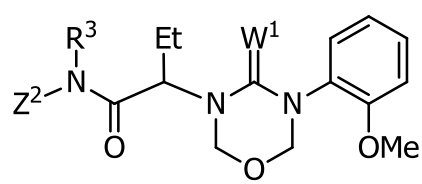
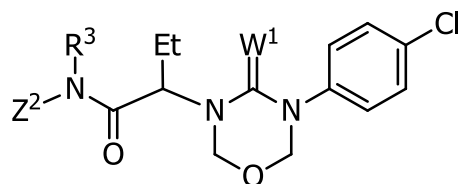
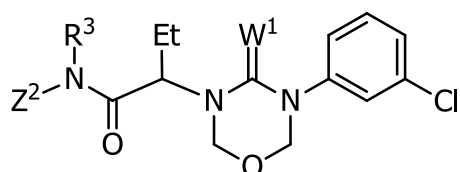
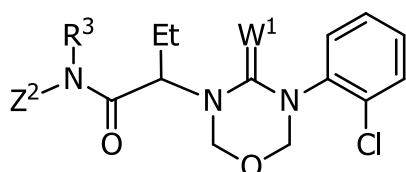
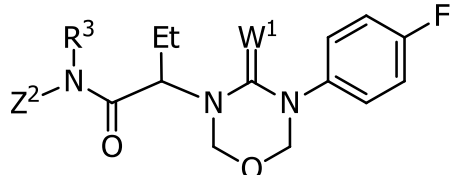
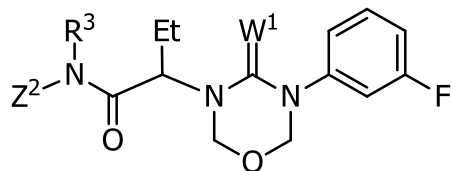
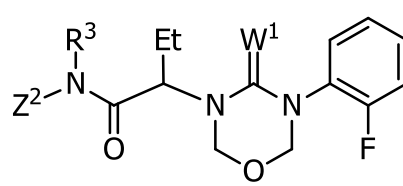
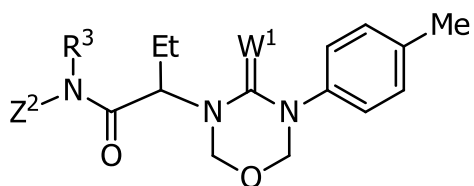
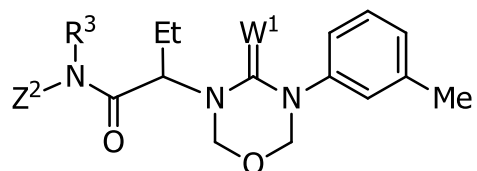
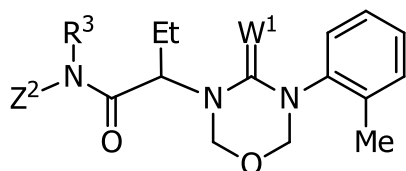
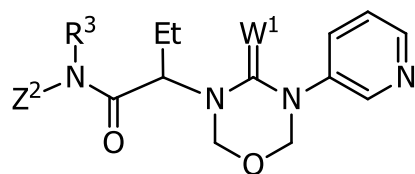
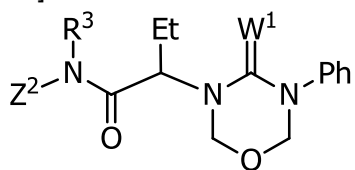
[Xim. 30]



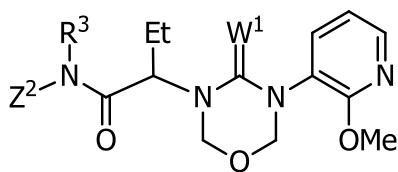
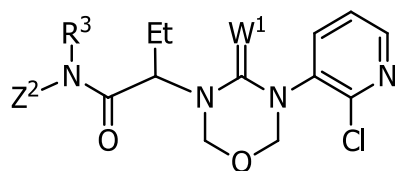
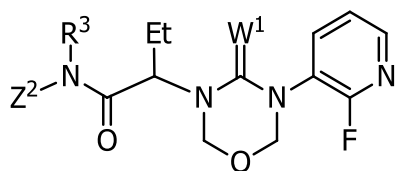
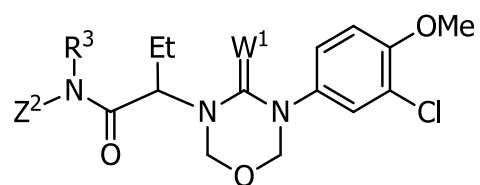
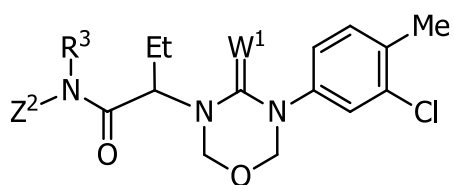
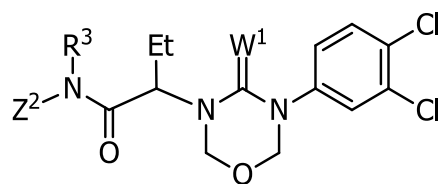
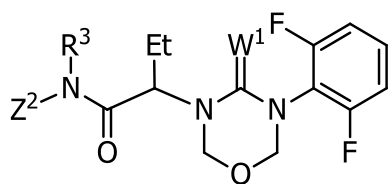
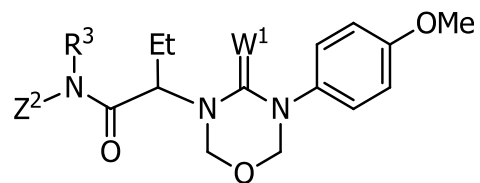
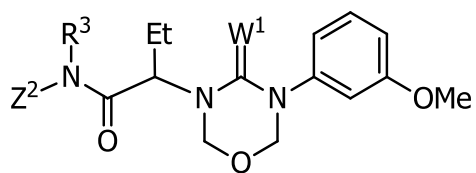
[Xim. 31]



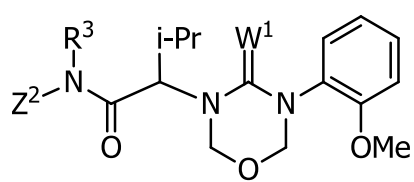
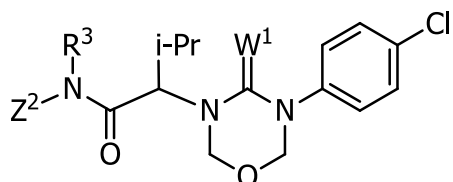
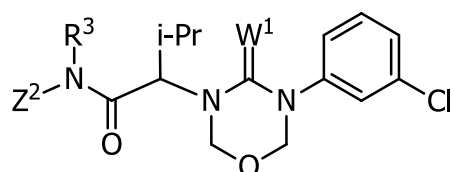
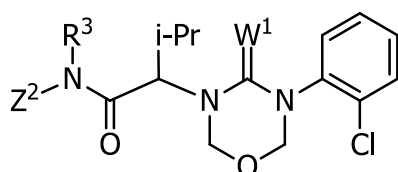
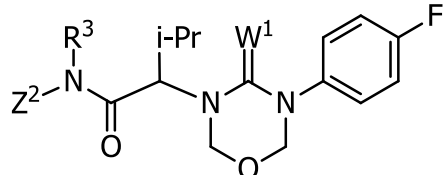
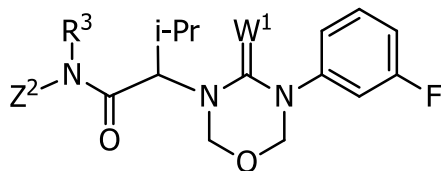
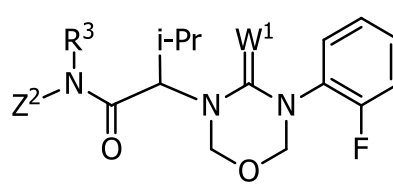
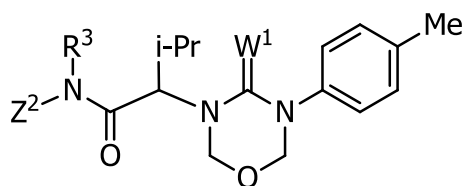
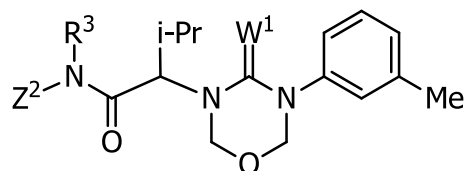
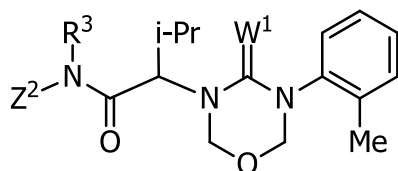
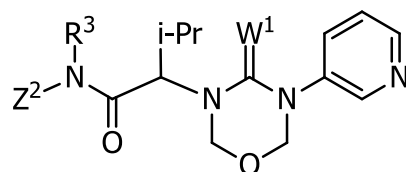
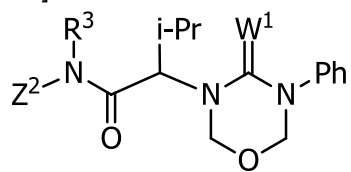
[Xim. 32]



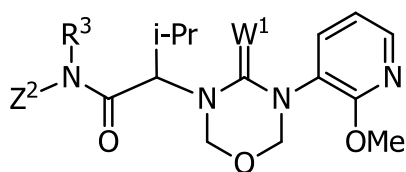
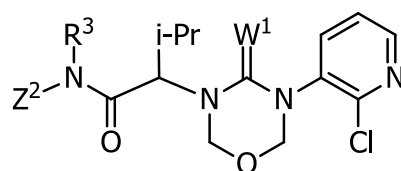
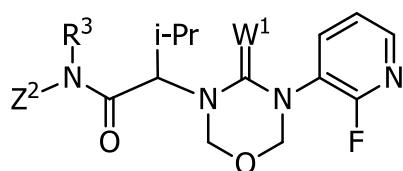
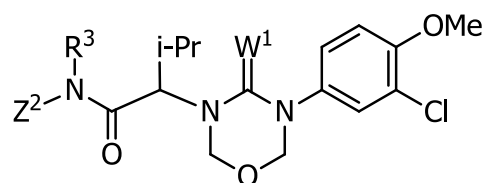
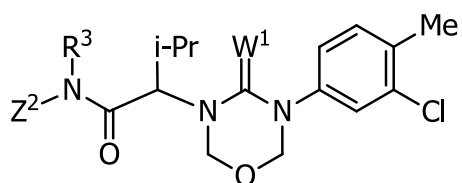
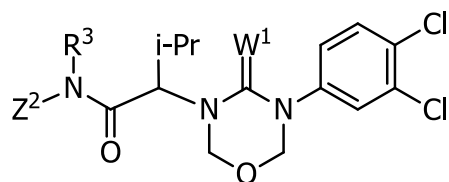
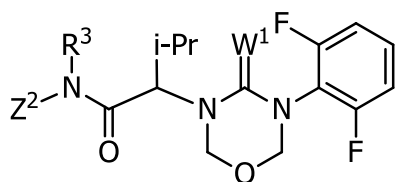
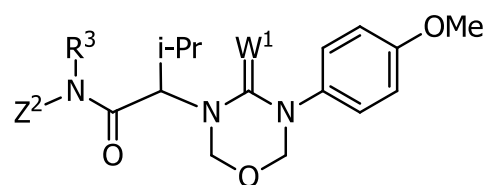
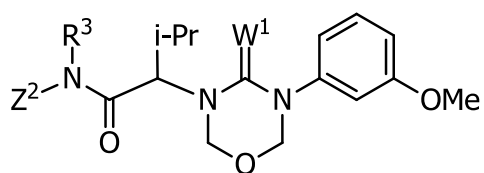
[Xim. 33]



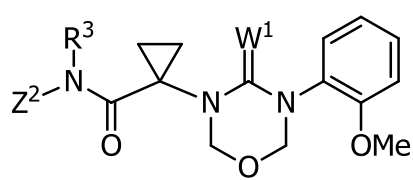
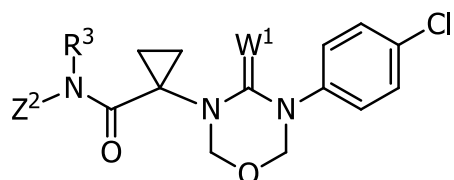
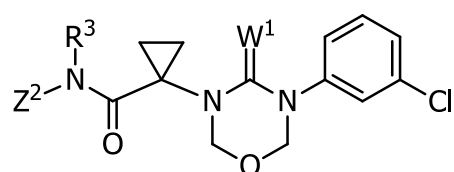
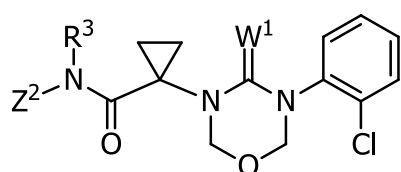
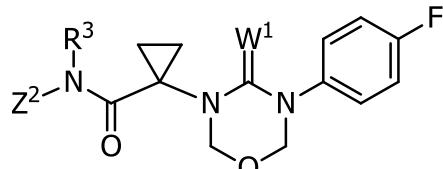
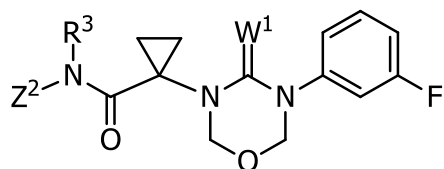
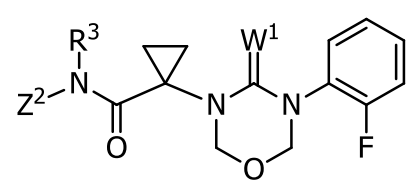
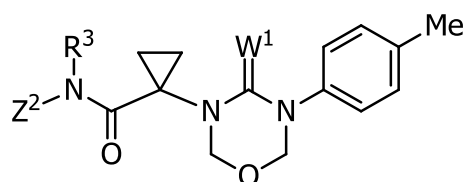
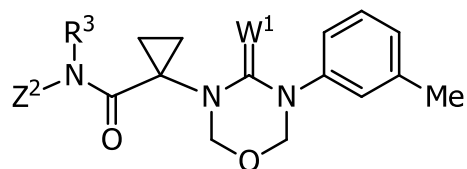
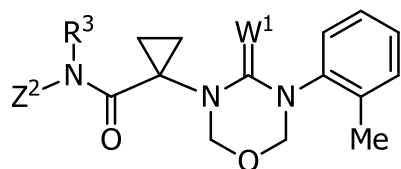
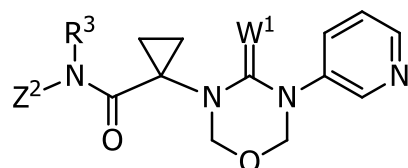
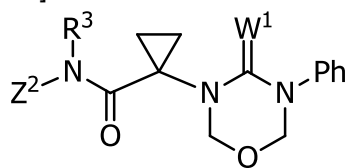
[Xim. 34]



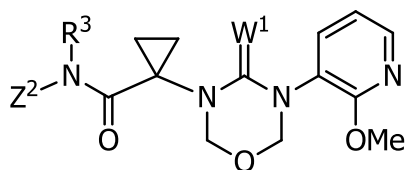
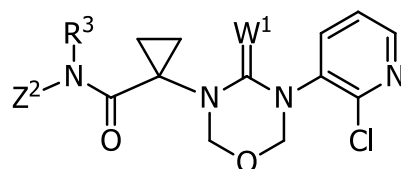
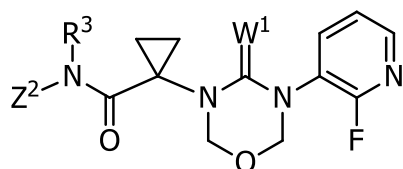
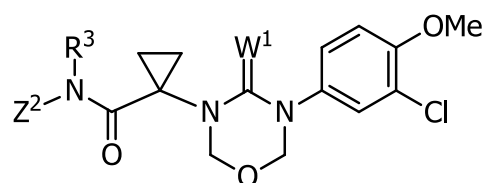
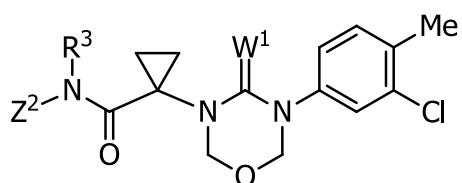
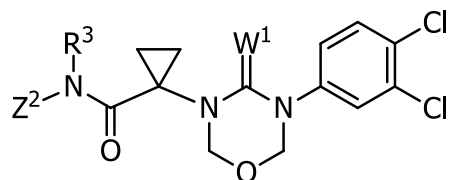
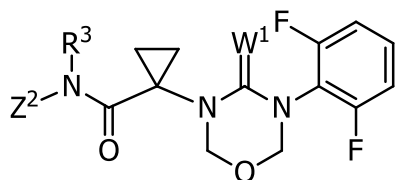
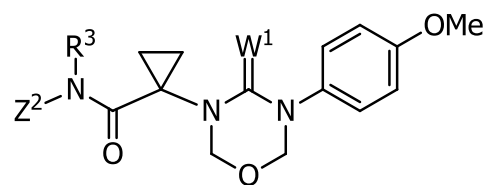
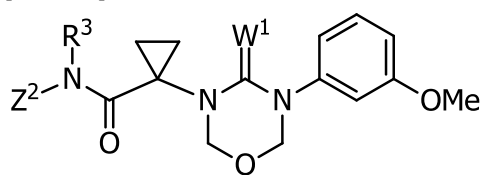
[Xim. 35]



[Xim. 36]



[Xim. 37]



[Таблица 1]

W^1	Z^2	R^3
0	J-1	H
0	J-2	H
0	J-3	H
0	J-4	H
0	J-5	H
0	J-6	H
0	J-7	H
0	J-8	H
0	J-9	H
0	J-10	H
0	J-11	H
0	J-12	H
0	J-13	H
0	J-14	H
0	J-15	H
0	J-16	H
0	J-17	H
0	J-18	H
0	J-19	H
0	J-20	H
0	J-21	H
0	J-22	H
0	J-23	H
0	J-24	H
0	J-25	H
0	J-26	H
0	J-27	H
0	J-28	H
0	J-29	H
0	J-30	H
0	J-31	H
0	J-32	H
0	J-33	H
0	J-34	H
0	J-35	H
0	J-36	H
0	J-37	H
0	J-38	H
0	J-39	H
0	J-40	H

W^1	Z^2	R^3
0	J-41	H
0	J-42	H
0	J-43	H
0	J-44	H
0	J-45	H
0	J-46	H
0	J-47	H
0	J-48	H
0	J-49	H
0	J-50	H
0	J-51	H
0	J-52	H
0	J-53	H
0	J-54	H
0	J-55	H
0	J-56	H
0	J-57	H
0	J-58	H
0	J-59	H
0	J-60	H
0	J-61	H
0	J-62	H
0	J-63	H
0	J-64	H
0	J-65	H
0	J-66	H
0	J-67	H
0	J-68	H
0	J-69	H
0	J-70	H
0	J-71	H
0	J-72	H
0	J-73	H
0	J-74	H
0	J-75	H
0	J-76	H
0	J-77	H
0	J-78	H
0	J-79	H
0	J-80	H

W^1	Z^2	R^3
0	J-81	H
0	J-82	H
0	J-83	H
0	J-84	H
0	J-85	H
0	J-86	H
0	J-87	H
0	J-88	H
0	J-89	H
0	J-90	H
0	J-91	H
0	J-92	H
0	J-93	H
0	J-94	H
0	J-95	H
0	J-96	H
0	J-97	H
0	J-98	H
0	J-99	H
0	J-100	H
0	J-101	H
0	J-102	H
0	J-103	H
0	J-104	H
0	J-105	H
0	J-106	H
0	J-107	H
0	J-108	H
0	J-109	H
0	J-110	H
0	J-111	H
0	J-112	H
0	J-113	H
0	J-114	H
0	J-115	H
0	J-116	H
0	J-117	H
0	J-118	H
0	J-119	H

Таблица 2]

W^1	Z^2	R^3
0	J-1	Me
0	J-2	Me
0	J-3	Me
0	J-4	Me
0	J-5	Me
0	J-6	Me
0	J-7	Me
0	J-8	Me
0	J-9	Me
0	J-10	Me
0	J-11	Me
0	J-12	Me
0	J-13	Me
0	J-14	Me
0	J-15	Me
0	J-16	Me
0	J-17	Me
0	J-18	Me
0	J-19	Me
0	J-20	Me
0	J-21	Me
0	J-22	Me
0	J-23	Me
0	J-24	Me
0	J-25	Me
0	J-26	Me
0	J-27	Me
0	J-28	Me
0	J-29	Me
0	J-30	Me
0	J-31	Me
0	J-32	Me
0	J-33	Me
0	J-34	Me
0	J-35	Me
0	J-36	Me
0	J-37	Me
0	J-38	Me
0	J-39	Me
0	J-40	Me

W^1	Z^2	R^3
0	J-41	Me
0	J-42	Me
0	J-43	Me
0	J-44	Me
0	J-45	Me
0	J-46	Me
0	J-47	Me
0	J-48	Me
0	J-49	Me
0	J-50	Me
0	J-51	Me
0	J-52	Me
0	J-53	Me
0	J-54	Me
0	J-55	Me
0	J-56	Me
0	J-57	Me
0	J-58	Me
0	J-59	Me
0	J-60	Me
0	J-61	Me
0	J-62	Me
0	J-63	Me
0	J-64	Me
0	J-65	Me
0	J-66	Me
0	J-67	Me
0	J-68	Me
0	J-69	Me
0	J-70	Me
0	J-71	Me
0	J-72	Me
0	J-73	Me
0	J-74	Me
0	J-75	Me
0	J-76	Me
0	J-77	Me
0	J-78	Me
0	J-79	Me
0	J-80	Me

W^1	Z^2	R^3
0	J-81	Me
0	J-82	Me
0	J-83	Me
0	J-84	Me
0	J-85	Me
0	J-86	Me
0	J-87	Me
0	J-88	Me
0	J-89	Me
0	J-90	Me
0	J-91	Me
0	J-92	Me
0	J-93	Me
0	J-94	Me
0	J-95	Me
0	J-96	Me
0	J-97	Me
0	J-98	Me
0	J-99	Me
0	J-100	Me
0	J-101	Me
0	J-102	Me
0	J-103	Me
0	J-104	Me
0	J-105	Me
0	J-106	Me
0	J-107	Me
0	J-108	Me
0	J-109	Me
0	J-110	Me
0	J-111	Me
0	J-112	Me
0	J-113	Me
0	J-114	Me
0	J-115	Me
0	J-116	Me
0	J-117	Me
0	J-118	Me
0	J-119	Me

[Таблица 3]

W^1	Z^2	R^3
0	J-1	Et
0	J-2	Et
0	J-3	Et
0	J-4	Et
0	J-5	Et
0	J-6	Et
0	J-7	Et
0	J-8	Et
0	J-9	Et
0	J-10	Et
0	J-11	Et
0	J-12	Et
0	J-13	Et
0	J-14	Et
0	J-15	Et
0	J-16	Et
0	J-17	Et
0	J-18	Et
0	J-19	Et
0	J-20	Et
0	J-21	Et
0	J-22	Et
0	J-23	Et
0	J-24	Et
0	J-25	Et
0	J-26	Et
0	J-27	Et
0	J-28	Et
0	J-29	Et
0	J-30	Et
0	J-31	Et
0	J-32	Et
0	J-33	Et
0	J-34	Et
0	J-35	Et
0	J-36	Et
0	J-37	Et
0	J-38	Et
0	J-39	Et
0	J-40	Et

W^1	Z^2	R^3
0	J-41	Et
0	J-42	Et
0	J-43	Et
0	J-44	Et
0	J-45	Et
0	J-46	Et
0	J-47	Et
0	J-48	Et
0	J-49	Et
0	J-50	Et
0	J-51	Et
0	J-52	Et
0	J-53	Et
0	J-54	Et
0	J-55	Et
0	J-56	Et
0	J-57	Et
0	J-58	Et
0	J-59	Et
0	J-60	Et
0	J-61	Et
0	J-62	Et
0	J-63	Et
0	J-64	Et
0	J-65	Et
0	J-66	Et
0	J-67	Et
0	J-68	Et
0	J-69	Et
0	J-70	Et
0	J-71	Et
0	J-72	Et
0	J-73	Et
0	J-74	Et
0	J-75	Et
0	J-76	Et
0	J-77	Et
0	J-78	Et
0	J-79	Et
0	J-80	Et

W^1	Z^2	R^3
0	J-81	Et
0	J-82	Et
0	J-83	Et
0	J-84	Et
0	J-85	Et
0	J-86	Et
0	J-87	Et
0	J-88	Et
0	J-89	Et
0	J-90	Et
0	J-91	Et
0	J-92	Et
0	J-93	Et
0	J-94	Et
0	J-95	Et
0	J-96	Et
0	J-97	Et
0	J-98	Et
0	J-99	Et
0	J-100	Et
0	J-101	Et
0	J-102	Et
0	J-103	Et
0	J-104	Et
0	J-105	Et
0	J-106	Et
0	J-107	Et
0	J-108	Et
0	J-109	Et
0	J-110	Et
0	J-111	Et
0	J-112	Et
0	J-113	Et
0	J-114	Et
0	J-115	Et
0	J-116	Et
0	J-117	Et
0	J-118	Et
0	J-119	Et

Таблица 4]

W^1	Z^2	R^3
0	J-1	n-Pr
0	J-2	n-Pr
0	J-3	n-Pr
0	J-4	n-Pr
0	J-5	n-Pr
0	J-6	n-Pr
0	J-7	n-Pr
0	J-8	n-Pr
0	J-9	n-Pr
0	J-10	n-Pr
0	J-11	n-Pr
0	J-12	n-Pr
0	J-13	n-Pr
0	J-14	n-Pr
0	J-15	n-Pr
0	J-16	n-Pr
0	J-17	n-Pr
0	J-18	n-Pr
0	J-19	n-Pr
0	J-20	n-Pr
0	J-21	n-Pr
0	J-22	n-Pr
0	J-23	n-Pr
0	J-24	n-Pr
0	J-25	n-Pr
0	J-26	n-Pr
0	J-27	n-Pr
0	J-28	n-Pr
0	J-29	n-Pr
0	J-30	n-Pr
0	J-31	n-Pr
0	J-32	n-Pr
0	J-33	n-Pr
0	J-34	n-Pr
0	J-35	n-Pr
0	J-36	n-Pr
0	J-37	n-Pr
0	J-38	n-Pr
0	J-39	n-Pr
0	J-40	n-Pr

W^1	Z^2	R^3
0	J-41	n-Pr
0	J-42	n-Pr
0	J-43	n-Pr
0	J-44	n-Pr
0	J-45	n-Pr
0	J-46	n-Pr
0	J-47	n-Pr
0	J-48	n-Pr
0	J-49	n-Pr
0	J-50	n-Pr
0	J-51	n-Pr
0	J-52	n-Pr
0	J-53	n-Pr
0	J-54	n-Pr
0	J-55	n-Pr
0	J-56	n-Pr
0	J-57	n-Pr
0	J-58	n-Pr
0	J-59	n-Pr
0	J-60	n-Pr
0	J-61	n-Pr
0	J-62	n-Pr
0	J-63	n-Pr
0	J-64	n-Pr
0	J-65	n-Pr
0	J-66	n-Pr
0	J-67	n-Pr
0	J-68	n-Pr
0	J-69	n-Pr
0	J-70	n-Pr
0	J-71	n-Pr
0	J-72	n-Pr
0	J-73	n-Pr
0	J-74	n-Pr
0	J-75	n-Pr
0	J-76	n-Pr
0	J-77	n-Pr
0	J-78	n-Pr
0	J-79	n-Pr
0	J-80	n-Pr

W^1	Z^2	R^3
0	J-81	n-Pr
0	J-82	n-Pr
0	J-83	n-Pr
0	J-84	n-Pr
0	J-85	n-Pr
0	J-86	n-Pr
0	J-87	n-Pr
0	J-88	n-Pr
0	J-89	n-Pr
0	J-90	n-Pr
0	J-91	n-Pr
0	J-92	n-Pr
0	J-93	n-Pr
0	J-94	n-Pr
0	J-95	n-Pr
0	J-96	n-Pr
0	J-97	n-Pr
0	J-98	n-Pr
0	J-99	n-Pr
0	J-100	n-Pr
0	J-101	n-Pr
0	J-102	n-Pr
0	J-103	n-Pr
0	J-104	n-Pr
0	J-105	n-Pr
0	J-106	n-Pr
0	J-107	n-Pr
0	J-108	n-Pr
0	J-109	n-Pr
0	J-110	n-Pr
0	J-111	n-Pr
0	J-112	n-Pr
0	J-113	n-Pr
0	J-114	n-Pr
0	J-115	n-Pr
0	J-116	n-Pr
0	J-117	n-Pr
0	J-118	n-Pr
0	J-119	n-Pr

Таблица 5]

W^1	Z^2	R^3
S	J-1	H
S	J-2	H
S	J-3	H
S	J-4	H
S	J-5	H
S	J-6	H
S	J-7	H
S	J-8	H
S	J-9	H
S	J-10	H
S	J-11	H
S	J-12	H
S	J-13	H
S	J-14	H
S	J-15	H
S	J-16	H
S	J-17	H
S	J-18	H
S	J-19	H
S	J-20	H
S	J-21	H
S	J-22	H
S	J-23	H
S	J-24	H
S	J-25	H
S	J-26	H
S	J-27	H
S	J-28	H
S	J-29	H
S	J-30	H
S	J-31	H
S	J-32	H
S	J-33	H
S	J-34	H
S	J-35	H
S	J-36	H
S	J-37	H
S	J-38	H
S	J-39	H
S	J-40	H

W^1	Z^2	R^3
S	J-41	H
S	J-42	H
S	J-43	H
S	J-44	H
S	J-45	H
S	J-46	H
S	J-47	H
S	J-48	H
S	J-49	H
S	J-50	H
S	J-51	H
S	J-52	H
S	J-53	H
S	J-54	H
S	J-55	H
S	J-56	H
S	J-57	H
S	J-58	H
S	J-59	H
S	J-60	H
S	J-61	H
S	J-62	H
S	J-63	H
S	J-64	H
S	J-65	H
S	J-66	H
S	J-67	H
S	J-68	H
S	J-69	H
S	J-70	H
S	J-71	H
S	J-72	H
S	J-73	H
S	J-74	H
S	J-75	H
S	J-76	H
S	J-77	H
S	J-78	H
S	J-79	H
S	J-80	H

W^1	Z^2	R^3
S	J-81	H
S	J-82	H
S	J-83	H
S	J-84	H
S	J-85	H
S	J-86	H
S	J-87	H
S	J-88	H
S	J-89	H
S	J-90	H
S	J-91	H
S	J-92	H
S	J-93	H
S	J-94	H
S	J-95	H
S	J-96	H
S	J-97	H
S	J-98	H
S	J-99	H
S	J-100	H
S	J-101	H
S	J-102	H
S	J-103	H
S	J-104	H
S	J-105	H
S	J-106	H
S	J-107	H
S	J-108	H
S	J-109	H
S	J-110	H
S	J-111	H
S	J-112	H
S	J-113	H
S	J-114	H
S	J-115	H
S	J-116	H
S	J-117	H
S	J-118	H
S	J-119	H

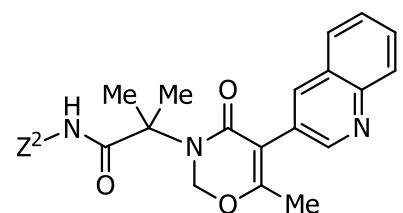
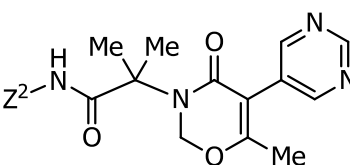
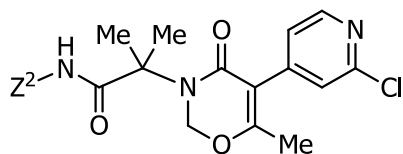
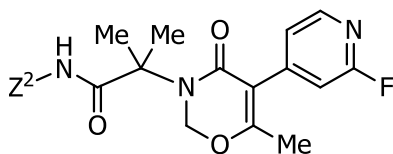
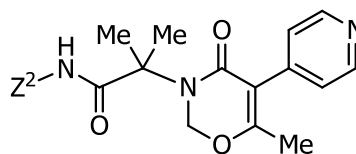
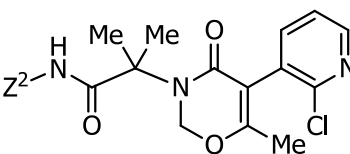
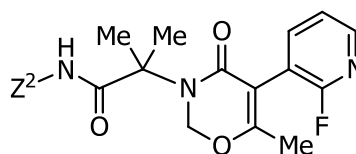
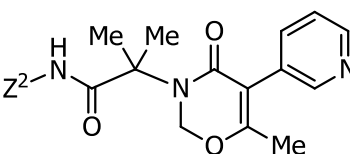
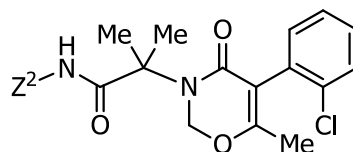
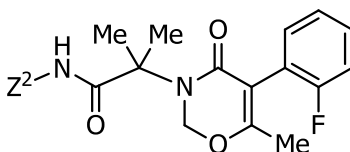
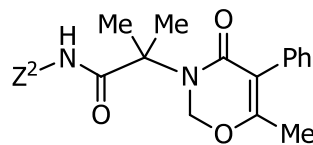
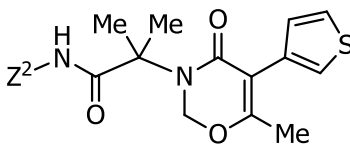
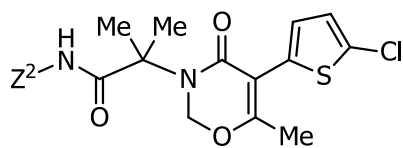
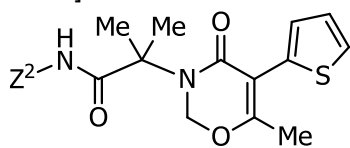
Таблица 6]

W^1	Z^2	R^3
S	J-1	Me
S	J-2	Me
S	J-3	Me
S	J-4	Me
S	J-5	Me
S	J-6	Me
S	J-7	Me
S	J-8	Me
S	J-9	Me
S	J-10	Me
S	J-11	Me
S	J-12	Me
S	J-13	Me
S	J-14	Me
S	J-15	Me
S	J-16	Me
S	J-17	Me
S	J-18	Me
S	J-19	Me
S	J-20	Me
S	J-21	Me
S	J-22	Me
S	J-23	Me
S	J-24	Me
S	J-25	Me
S	J-26	Me
S	J-27	Me
S	J-28	Me
S	J-29	Me
S	J-30	Me
S	J-31	Me
S	J-32	Me
S	J-33	Me
S	J-34	Me
S	J-35	Me
S	J-36	Me
S	J-37	Me
S	J-38	Me
S	J-39	Me
S	J-40	Me

W^1	Z^2	R^3
S	J-41	Me
S	J-42	Me
S	J-43	Me
S	J-44	Me
S	J-45	Me
S	J-46	Me
S	J-47	Me
S	J-48	Me
S	J-49	Me
S	J-50	Me
S	J-51	Me
S	J-52	Me
S	J-53	Me
S	J-54	Me
S	J-55	Me
S	J-56	Me
S	J-57	Me
S	J-58	Me
S	J-59	Me
S	J-60	Me
S	J-61	Me
S	J-62	Me
S	J-63	Me
S	J-64	Me
S	J-65	Me
S	J-66	Me
S	J-67	Me
S	J-68	Me
S	J-69	Me
S	J-70	Me
S	J-71	Me
S	J-72	Me
S	J-73	Me
S	J-74	Me
S	J-75	Me
S	J-76	Me
S	J-77	Me
S	J-78	Me
S	J-79	Me
S	J-80	Me

W^1	Z^2	R^3
S	J-81	Me
S	J-82	Me
S	J-83	Me
S	J-84	Me
S	J-85	Me
S	J-86	Me
S	J-87	Me
S	J-88	Me
S	J-89	Me
S	J-90	Me
S	J-91	Me
S	J-92	Me
S	J-93	Me
S	J-94	Me
S	J-95	Me
S	J-96	Me
S	J-97	Me
S	J-98	Me
S	J-99	Me
S	J-100	Me
S	J-101	Me
S	J-102	Me
S	J-103	Me
S	J-104	Me
S	J-105	Me
S	J-106	Me
S	J-107	Me
S	J-108	Me
S	J-109	Me
S	J-110	Me
S	J-111	Me
S	J-112	Me
S	J-113	Me
S	J-114	Me
S	J-115	Me
S	J-116	Me
S	J-117	Me
S	J-118	Me
S	J-119	Me

[0112] [Таблица № 2]
[Хим. 38]



[Таблиця 7]

<u>Z²</u>	<u>Z²</u>	<u>Z²</u>
Ja-1	Ja-41	Ja-81
Ja-2	Ja-42	Ja-82
Ja-3	Ja-43	Ja-83
Ja-4	Ja-44	<u>Ja-84</u>
Ja-5	Ja-45	
Ja-6	Ja-46	
Ja-7	Ja-47	
Ja-8	Ja-48	
Ja-9	Ja-49	
Ja-10	Ja-50	
Ja-11	Ja-51	
Ja-12	Ja-52	
Ja-13	Ja-53	
Ja-14	Ja-54	
Ja-15	Ja-55	
Ja-16	Ja-56	
Ja-17	Ja-57	
Ja-18	Ja-58	
Ja-19	Ja-59	
Ja-20	Ja-60	
Ja-21	Ja-61	
Ja-22	Ja-62	
Ja-23	Ja-63	
Ja-24	Ja-64	
Ja-25	Ja-65	
Ja-26	Ja-66	
Ja-27	Ja-67	
Ja-28	Ja-68	
Ja-29	Ja-69	
Ja-30	Ja-70	
Ja-31	Ja-71	
Ja-32	Ja-72	
Ja-33	Ja-73	
Ja-34	Ja-74	
Ja-35	Ja-75	
Ja-36	Ja-76	
Ja-37	Ja-77	
Ja-38	Ja-78	
Ja-39	Ja-79	
<u>Ja-40</u>	<u>Ja-80</u>	

- [0113] Сполуки за даним винаходом можуть застосовуватись як гербіциди на рисових полях як при обробці водонасиченого ґрунту, так і при позакореневій обробці. В якості бур'янів рисового поля слід зазначити, наприклад, бур'яни родини Potamogetonaceae, представлені *Potamogeton distinctus* тощо, бур'яни родини Alismataceae, представлені *Alisma canaliculatum*, *Sagittaria pygmaea*, а також *Sagittaria trifolia* тощо, бур'яни родини Gramineae, представлені *Leptochloa chinensis*, *Echinochloa crus-galli*, *Echinochloa oryzicola*, *Homalocenchrus japonicus*, а також *Paspalum distichum* тощо, бур'яни родини Cyperaceae, представлені *Eleocharis kuroguwai*, *Scirpus juncoides*, *Scirpus nipponicus*, *Cyperus serotinus*, *Cyperus difformis*, а також *Cyperus hakonensis* тощо, бур'яни родини Lemnaceae, представлені *Spirodela polyrhiza*, а також *Lemna paucicostata* тощо, бур'яни родини Commelinaceae, представлені *Murdannia keisak* тощо, бур'яни родини Pontederiaceae, представлені *Monochoria korsakowii*, а також *Monochoria vaginalis* тощо, бур'яни родини Elatinaceae, представлені *Elatine triandra* тощо, бур'яни родини Lythraceae, представлені *Ammannia multiflora*, а також *Rotala indica* тощо, бур'яни родини Oenotheraceae, представлені *Ludwigia epilobioides* тощо, бур'яни родини Scrophulariaceae, представлені

Dopatrium junceum, *Gratiola japonica*, *Limnophila sessilifolia*, *Lindernia pyxidaria*, а також *Lindernia dubia* тощо, бур'яни родини *Leguminosae*, представлені *Aeschynomene indica* тощо, і бур'яни родини *Compositae*, представлені *Bidens frondosa*, а також *Bidens tripartita* тощо.

[0114] Крім того, сполуки за даним винаходом, як гербіциди для сільськогосподарських угідь і фруктових садів, можуть застосовуватись для обробки ґрунту, обробки шляхом включення в ґрунт і позакореневої обробки. В якості прикладу бур'янів сільськогосподарських угідь слід зазначити, наприклад, широколисті бур'яни, такі як бур'яни родини *Solanaceae*, представлені *Solanum nigrum*, а також *Datura stramonium* тощо, бур'яни родини *Geraniaceae*, представлені *Granium carolinianum* тощо, бур'яни родини *Malvaceae*, представлені *Abutilon theophrasti*, а також *Sida spinosa* тощо, бур'яни родини *Convolvulaceae*, представлені видами *Ipomoea*, такими як *Ipomoea purpurea*, а також *Calystegia* тощо, бур'яни родини *Amaranthaceae*, представлені *Amaranthus lividus*, а також *Amaranthus retroflexus* тощо, бур'яни родини *Compositae*, представлені *Xanthium pennsylvanicum*, *Ambrosia artemisiaefolia*, *Helianthus annuus*, *Galinsoga ciliata*, *Cirsium arvense*, *Senecio vulgaris*, а також *Erigeron annuus* тощо, бур'яни родини *Cruciferae*, представлені *Rorippa indica*, *Sinapis arvensis*, а також *Capsella Bursapastoris* тощо, бур'яни родини *Polygonaceae*, представлені *Polygonum Blumei*, а також *Polygonum convolvulus* тощо, бур'яни родини *Portulacaceae*, представлені *Portulaca oleracea* тощо, бур'яни родини *Chenopodiaceae*, представлені *Chenopodium album*, *Chenopodium ficifolium*, а також *Kochia scoraria* тощо, бур'яни родини *Caryophyllaceae*, представлені *Stellaria media* тощо, бур'яни родини *Scrophulariaceae*, представлені *Veronica persica* тощо, бур'яни родини *Commelinaceae*, представлені *Commelina communis* тощо, бур'яни родини *Labiatae*, представлені *Lamium amplexicaule*, а також *Lamium purpureum* тощо, бур'яни родини *Euphorbiaceae*, представлені *Euphorbia supina*, а також *Euphorbia maculata* тощо, бур'яни родини *Rubiaceae*, представлені *Galium spurium*, а також *Rubia akane* тощо, бур'яни родини *Violaceae*, представлені *Viola mandshurica* тощо, і бур'яни родини *Leguminosae*, представлені *Sesbania exaltata*, а також *Cassia obtusifolia* тощо, а також родини *Oxalidaceae* тощо, представлені *Oxalis corniculata*. Слід зазначити бур'яни родини *Graminaceous* тощо, представлені *Sorghum bicolor*, *Panicum dichotomiflorum*, *Sorghum halepense*, *Echinochloa crus-galli* var. *crus-galli*, *Echinochloa crus-galli* var. *praticola*, *Echinochloa utilis*, *Digitaria ciliaris*, *Avena fatua*, *Alopecurus myosuroides*, *Eleusine indica*, *Setaria viridis*, *Setaria faberi* і *Alopecurus aequalis* тощо, а також бур'яни родини *Cyperaceous*, представлені *Cyperus rotundus*, *Cyperus esculentus* тощо.

[0115] Крім того, сполуки за даним винаходом крім сільськогосподарських і садівничих полів, таких як рисові поля, сільгоспугіддя й фруктові сади, також можуть застосовуватись в будь-якому зі способів обробки ґрунту, обробки шляхом включення в ґрунт і позакореневої обробки на землі, яка не належить до сільськогосподарської й садівничої землі, наприклад, такої як газони, спортивні майданчики, землі що пустують, узбіччя доріг і узбіччя рейкових шляхів. В якості таких бур'янів, на додаток до тих, які згадані як бур'яни сільськогосподарських угідь і фруктових садів, слід зазначити *Poa annua*, *Taraxacum officinale*, *Conyza sumatrensis*, *Cardamine flexuosa*, *Trifolium repens*, *Hydrocotyle sibthorpioides*, *Plantago asiatica*, *Cyperus brevifolius*, *Kyllinga brevifolia*, *Equisetum arvense* тощо.

[0116] Сполуки за даним винаходом за необхідності можуть застосовуватись у вигляді складів або сумішей під час розпилення з іншими типами гербіциду, різними інсектицидами, фунгіцидами, регуляторами росту рослин або синергістами.

Зокрема, за рахунок змішування і застосування з іншими гербіцидами можна очікувати зниження витрат за рахунок зменшення внесеної дози, розширення спектра гербіцидної дії за рахунок синергетичної дії змішаних засобів, а також вищої гербіцидної ефективності. При цьому також можлива одночасна комбінація з безліччю відомих гербіцидів.

[0117] В якості переважних гербіцидів, які можуть бути змішані і застосовані зі сполуками за даним винаходом, слід зазначити, наприклад, ацетохлор (загальна назва), ацифлуорфен (загальна назва), аклоніфен (загальна назва), алахлор (загальна назва), алоксидим (загальна назва), алоксидим-натрій (загальна назва), аметрин (загальна назва), амікарбазон (загальна назва), амідосульфурон (загальна назва), аміноциклопірахлор (загальна назва), солі й естери аміноциклопірахлору, амінопіралід (загальна назва), солі й естери амінопіраліду, аміпрофосметил (загальна назва), амітрол (загальна назва), анілофос (загальна назва), азулам (загальна назва), атразин (загальна назва), азафенідин (загальна назва), азимсульфурон (загальна назва), бефлбутамід (загальна назва), беназолін-етил (загальна назва), бенкарбазон (загальна назва), бенфлуралін, бенефін (загальна назва), бенфуресат (загальна назва), бенсульфуронметил (загальна назва), бенсулід (загальна назва), бентазон (загальна назва), бентазон-натрій (загальна назва), солі бентазону, бентіокарб (загальна назва), бензфендизон (загальна назва), бензобіциклон (загальна назва), бензофенап (загальна назва), біалафос (загальна назва),

білафос-натрій (загальна назва), біциклопірон (загальна назва), біфенокс (загальна назва), біспірибак (загальна назва), біспірибак-натрій (загальна назва), бромацил (загальна назва), бромобутид (загальна назва), бромофеноксим (загальна назва), бромоксиніл (загальна назва), солі й естери бромоксинілу, бутахлор (загальна назва), бутафенацил (загальна назва), 5 бутаміфос (загальна назва), бутенахлор (загальна назва), бутралін (загальна назва), бутроксидим (загальна назва), бутилат (загальна назва), кафенстрол (загальна назва), карбетамід (загальна назва), карфентразон-етил, хлометоксифен (загальна назва), хлометоксиніл (загальна назва), хлорамбен (загальна назва), солі й естери хлорамбену, хлорансулам-метил (загальна назва), хлорфлуренол-метил (загальна назва), хлоридазон 10 (загальна назва), хлоримурон-етил (загальна назва), хлорбромурон (загальна назва), хлоротолурон (загальна назва), хлороксурон (загальна назва), хлорфталім (загальна назва), хлорпрофам (загальна назва), хлор-IPC (хлорпрофам (загальна назва)), хлорсульфурон (загальна назва), хлортал-диметил (загальна назва), хлортіамід (загальна назва), цинідон-етил (загальна назва), цинметилін (загальна назва), циносульфурон (загальна назва), клетодим 15 (загальна назва), клодинафоп (загальна назва), клодинафоп-пропаргіл (загальна назва), кломазон (загальна назва), кломепроп (загальна назва), клопіралід (загальна назва), солі й естери клопіраліду, CNP (загальна назва), кумілурун (загальна назва), ціаназин (загальна назва), циклоат (загальна назва), циклопіриморат (загальна назва, наукова назва SW-065), циклосульфамурон (загальна назва), циклоксидим (загальна назва), цигалофоп-бутил (загальна 20 назва), DAN-500 (наукова назва), далапон (загальна назва), дазомет (загальна назва), десмедифам (загальна назва), десметрин (загальна назва), дикамба (загальна назва), солі й естери дикамби, дихлобеніл (загальна назва), диклофоп (загальна назва), диклофоп-метил (загальна назва), дихлорпроп (загальна назва), солі й естери дихлорпропу, дихлорпроп-Р (загальна назва), солі й естери дихлорпропу-Р, диклосулам (загальна назва), дифензокват 25 (загальна назва), дифлуфенікан (загальна назва), дифлуфензопір (загальна назва), дифлуфензопір-натрій (загальна назва), димепіперат (загальна назва), диметаметрин (загальна назва), диметахлор (загальна назва), диметенамід (загальна назва), диметенамід-Р (загальна назва), диметипін (загальна назва), динітрамін (загальна назва), диносеб (загальна назва), динотерб (загальна назва), DNOC (загальна назва) дифенамід (загальна назва), дикват 30 (загальна назва), дитіофіл (загальна назва), діурон (загальна назва), DSMA (загальна назва), даімурон (загальна назва), ендотал (загальна назва), EPTC (загальна назва), еспрокарб (загальна назва), еталфлуралін (загальна назва), етаметсульфурон-метил (загальна назва), етофумезат (загальна назва), етобензанід (загальна назва), етоксисульфурон (загальна назва), флазасульфурон (загальна назва), феноксапроп (загальна назва), феноксапроп-етил (загальна 35 назва), феноксасульфон (загальна назва), фенквінотрион (загальна назва), фентразамід (загальна назва), флампроп (загальна назва), флазасульфурон (загальна назва), флорасулам (загальна назва), флуазифоп (загальна назва), флуазифоп-бутил (загальна назва), флуазолат (загальна назва), флукарбазон-натрій (загальна назва), флуцетосульфурон (загальна назва), флухлоралін (загальна назва), флуфенацет (загальна назва), флуфенпіл-етил (загальна назва), 40 флуметсулам (загальна назва), флуміклорак-пентил (загальна назва), флуміоксазин (загальна назва), флуометурон (загальна назва), флуороглікофен-етил (загальна назва), флупірсульфурон (загальна назва), флупоксам (загальна назва), флуренол (загальна назва), флуридон (загальна назва), флурохлоридон (загальна назва), флуороксіпір (загальна назва), естери флуороксіпіру, флурпримідол (загальна назва), флуртамон (загальна назва), флутіацет-метил (загальна назва), фомесафен (загальна назва), форамсульфурон (загальна назва), 45 фосамін (загальна назва), глюфосинат (загальна назва), глюфосинат-амоній (загальна назва), гліфосат (загальна назва) гліфосат-амоній (загальна назва), гліфосат-ізопропіламін (гліфосат-ізопропіламоній (загальна назва)), гліфосат-калій (загальна назва), гліфосат-натрій (загальна назва), гліфосат-тримезіум (загальна назва), галоксифен (загальна назва), солі й естери 50 галоксифену, галосафен (загальна назва), галосульфурон (загальна назва), галосульфурон-метил (загальна назва), галоксифоп (загальна назва), галоксифоп-метил (загальна назва), гексазинон (загальна назва), імазаметабенз-метил (загальна назва), імазамокс (загальна назва), імазапик (загальна назва), імазапир (загальна назва), імазетапир (загальна назва), імазаквін (загальна назва), імазосульфурон (загальна назва), інданофан (загальна назва), 55 індазифлам (загальна назва), йодосульфурон-метил-натрій (загальна назва), іоксиніл октаноат (загальна назва), солі й естери іоксинілу, іпфенкарбазон (загальна назва), ізопротурон (загальна назва), ізоурон (загальна назва), ізоксабен (загальна назва), ізоксафлютол (загальна назва), карбутилат (загальна назва), лактофен (загальна назва), ленацил (загальна назва), лінурун (загальна назва), малеїновий гідрозид (загальна назва), MCPA (загальна назва), солі й 60 естери MCPA, MCPB (загальна назва), солі й естери MCPB, мекопроп, MCPP (загальна назва),

- солі й естери мекопропа, мекопроп-Р, МСРР-Р (загальна назва), солі й естери мекопропа-Р, мефенацет (загальна назва), мефлудид (загальна назва), мезосульфурон-метил (загальна назва), мезотріон (загальна назва), метам (загальна назва), метаміфоп (загальна назва), метамітрон (загальна назва), метазахлор (загальна назва), метабензтіазурон (загальна назва), метазосульфурон (загальна назва), метіозолін (загальна назва), метил-азид (загальна назва), метилбромід (загальна назва), метил-димрон (загальна назва), метилйодид (загальна назва), метобензулон (загальна назва), метолахлор (загальна назва), метолахлор-S (загальна назва), метосулам (загальна назва), метрибузин (загальна назва), метсульфурон-метил (загальна назва), метоксурон (загальна назва), молінат (загальна назва), монолінулон (загальна назва), моноссульфурон (загальна назва), моноссульфурон-метил (загальна назва), MSMA (загальна назва), напроанілід (загальна назва), напропамід (загальна назва), напталам (загальна назва), напталам-натрій (загальна назва), небурон (загальна назва), нікосульфурон (загальна назва), норфлуразон (загальна назва), ОК-701 (наукова назва), олеїнову кислоту (загальна назва), орбенкарб (загальна назва), ортосульфамурон (загальна назва), оризалін (загальна назва), оксادیаргіл (загальна назва), оксادیазон (загальна назва), оксасульфурон (загальна назва), оксацикломефон (загальна назва), оксифлуорфен (загальна назва), паракват (загальна назва), пеларгонова кислота (загальна назва), пендиметалін (загальна назва), пеноксулам (загальна назва), пентанохлор (загальна назва), пентоксазон (загальна назва), петоксамід (загальна назва), фенмедифам-етил (загальна назва), піклорам (загальна назва), солі й естери піклорами, піколінафен (загальна назва), піноксаден (загальна назва), піперофос (загальна назва), претилахлор (загальна назва), примісульфурон-метил (загальна назва), продіамін (загальна назва), профлуазол (загальна назва), профоксидим (загальна назва), прометон (загальна назва), прометрин (загальна назва), пропахлор (загальна назва), пропаніл (загальна назва), пропаквізафоп (загальна назва), пропазин (загальна назва), профам (загальна назва), пропізохлор (загальна назва), пропоксикарбазон-натрій (загальна назва), пропірисульфурон (загальна назва), пропізамід (загальна назва), просульфоккарб (загальна назва), просульфурон (загальна назва), піраклоніл (загальна назва), пірафлуфен-етил (загальна назва), пірасульфотол (загальна назва), піразолінат (загальна назва), піразосульфурон (загальна назва), піразосульфурон-етил (загальна назва), піразоксифен (загальна назва), пірибензоксим (загальна назва), пірибутикарб (загальна назва), піридафол (загальна назва), піридат (загальна назва), пірифталід (загальна назва), піримінобак-метил (загальна назва), піримісульфан (загальна назва), піритіобак-натрій (загальна назва), піроксасульфон (загальна назва), піроксулам (загальна назва), квінклорак (загальна назва), квінмерак (загальна назва), квінокламін (загальна назва), квізалофоп (загальна назва), квізалофоп-етил (загальна назва), квізалофоп-тефурил (загальна назва), квізалофоп-Р (загальна назва), квізалофоп-Р-етил (загальна назва), квізалофоп-Р-тефурил (загальна назва), римсульфурон (загальна назва), сафлуфенацил (загальна назва), сетоксидим (загальна назва), сидурон (загальна назва), симазин (загальна назва), симетрин (загальна назва), SL-261 (наукова назва), сулькотріон (загальна назва), сульфентразон (загальна назва), сульфометурон-метил (загальна назва), сульфосульфурон (загальна назва), ТСВА (2,3,6-ТВА (загальна назва)), солі й естери 2,3,6-ТВА, ТСТР (хлортал-диметил, тетрахлортіофен (загальна назва)), тебутам (загальна назва), тебутіурон (загальна назва), тефурилтріон (загальна назва), темботріон (загальна назва), тепралоксидим (загальна назва), тербацил (загальна назва), тербуметон (загальна назва), тербутилазин (загальна назва), тербутрин (загальна назва), тетрапіон/флупропанат (загальна назва), тенілхлор (загальна назва), тіазафлулон (загальна назва), тіазопір (загальна назва), тидіазимін (загальна назва), тидіазурон (загальна назва), тіенкарбазон-метил (загальна назва), тифенсульфурон-метил (загальна назва), толпіралат (загальна назва), топрамезон (загальна назва), тралоксидим (загальна назва), триафамон (загальна назва), триалат (загальна назва), триасульфурон (загальна назва), триазифлам (загальна назва), трибенурон-метил (загальна назва), триклопір (загальна назва), солі й естери триклопіру, тридифан (загальна назва), триетазин (загальна назва), трифлудимоксадин (загальна назва), трифлуксисульфурон (загальна назва), трифлуралін (загальна назва), трифлусульфурон-метил (загальна назва), тритосульфурон (загальна назва), 2,4-РА (загальна назва), солі й естери 2,4-РА, 2,4-ДВ (загальна назва), солі й естери 2,4-ДВ тощо. Ці компоненти можуть застосовуватись окремо або у вигляді сумішей 2 або більше типів, при цьому, якщо їх змішують, співвідношення можуть вибиратися вільно.
- [0118] В якості антидотів слід зазначити, наприклад, АД-67, беноксакор (загальна назва), клоквінтосет-мексил (загальна назва), ціометриніл (загальна назва), дихлормід (загальна назва), дициклонон (загальна назва), ципросульфамід (загальна назва), діеторат (загальна назва), ДКА-24, даїмулон (загальна назва), фенклоразол-етил (загальна назва), фенклорим

(загальна назва), HEXIM (загальна назва), флуразол (загальна назва), флуксофенім (загальна назва), фурилазол (загальна назва), ізоксадифен (загальна назва), ізоксадифен-етил (загальна назва), МСРА, мекопроп (загальна назва), мефенпір (загальна назва), мефенпір-етил (загальна назва), мефенпір-діетил (загальна назва), мефенат (загальна назва), MG-191, NA (нафталіновий ангідрид), OM (октаметилендіамін), оксабетриніл (загальна назва), PPG-1292, R-29148 тощо. Ці компоненти можуть застосовуватись окремо або у вигляді сумішей 2 або більше типів, при цьому, якщо їх змішують, співвідношення можуть вибиратися вільно.

[0119] Якщо сполуки за даним винаходом застосовуються як гербіциди, їх, як правило, змішують з відповідними твердими носіями або рідкими носіями, причому за необхідності з подальшим додаванням поверхнево-активних речовин, змочувальних засобів, засобів, що підсилюють розтікання, загусників, засобів, що перешкоджають замерзанню, зв'язувальних речовин, засобів проти спікання, розпушувачів, стабілізаторів тощо, при цьому вони можуть поставлятися для застосування в складах будь-якої лікарської форми, таких як порошки, що змочуються, емульсії, рідкотекучий, сипучий препарат, рідина, порошок, гранули або гелі. Крім того, для зниження витрат праці й підвищеної безпеки вищевказані складі будь-якої лікарської форми можуть застосовуватись після впаковування у водорозчинні упаковки.

В якості твердих носіїв згадуються, наприклад, природні мінеральні речовини, такі як кварц, каолінит, пірофіліт, серицит, тальк, бентоніт, кисла глина, атапульгіт, цеоліт і діатомова земля, неорганічні солі, такі як карбонат кальцію, сульфат амонію, сульфат натрію й хлорид калію, синтетична кремнієва кислота й синтетичні силікатні солі.

В якості рідких носіїв слід зазначити, наприклад, спирти, такі як етиленгліколь, пропіленгліколь і ізопропанол, ароматичні вуглеводні, такі як ксилол, алкілбензоли й алкілнафталіни, етери, такі як бутилцелозоль, кетони, такі як циклогексанон, естери, такі як γ -бутиролактон, аміді, такі як N-метилпіролідон і N-октилпіролідон, рослинні масла, такі як соєве масло, рапсове масло, бавовняне масло і соняшникова олія, а також воду.

Такі тверді й рідкі носії можуть застосовуватись окремо, або разом може застосовуватись 2 або більше типів.

[0120] В якості поверхнево-активних речовин слід зазначити, наприклад, неіонні поверхнево-активні речовини, такі як алкілові етери поліоксіетилену, алкіларілові етери поліоксіетилену, поліоксіетиленстирилфенілові етери, блок-співполімери поліоксіетилену-поліоксипропілену, естери поліоксіетилену й жирних кислот, естери сорбіту й жирних кислот і поліоксіетиленові естери сорбіту й жирних кислот, аніонні поверхнево-активні речовини, такі як алкілсульфатні солі, алкілбензолсульфонатні солі, лігнінсульфонатні солі, алкілсульфосукцинатні солі, нафталінсульфонатні солі, алкілнафталінсульфонатні солі, солі продукту конденсації нафталінсульфонової кислоти й формаліну, солі продукту конденсації алкілнафталінсульфонової кислоти й формаліну, сульфатні й фосфатні солі алкіларілового етеру поліоксіетилену, сульфатні й фосфатні солі фенілового етеру поліоксіетиленстирилу, солі полікарбонатових кислот і солі полістиролсульфонату, катіонні поверхнево-активні речовини, такі як алкіламініові солі й солі четвертинного алкіламонію, а також амфотерні поверхнево-активні речовини, наприклад, амінокислотного типу й бетаїнового типу.

Не існує жодних особливих обмежень щодо вмісту цих поверхнево-активних речовин, проте в нормі переважний діапазон від 0,05 до 20 частин за вагою на 100 частин за вагою складу за даним винаходом. Крім того, такі поверхнево-активні речовини можуть застосовуватись окремо, або разом може застосовуватись 2 або більше типів.

[0121] Сполуки за даним винаходом за необхідності можуть застосовуватись у вигляді складів або сумішей під час розпилення з іншими типами гербіциду, різними інсектицидами, фунгіцидами, регуляторами росту рослин або синергістами.

Зокрема, за рахунок змішування й застосування з іншими гербіцидами можна очікувати зниження витрат за рахунок зменшення внесеної дози, розширення спектра гербіцидної дії за рахунок синергетичної дії змішаних засобів, а також вищої гербіцидної ефективності. При цьому також можлива одночасна комбінація з безліччю відомих гербіцидів.

Дози застосування сполук за даним винаходом будуть змінюватись в залежності від місцезонашування застосування, часу застосування, способу застосування, оброблюваної культури тощо, але, як правило, придатна доза активного компоненту становить від 0,005 до 50 кг на гектар (га).

[0122] Далі показані приклади складання складів, в яких використовуються сполуки за даним винаходом. Проте даний винахід не обмежується лише цими прикладами складання. Крім того, в таких прикладах складання "частини" означають частини за вагою.

Змочуваний порошок

Сполука за даним винаходом 0,1-80 частин

- Твердий носій 5-98,9 частин
Поверхнево-активна речовина 1-10 частин
Решта 0-5 частин
Як решта вказані, наприклад, засоби проти спікання, стабілізатори тощо.
- 5 [0123]
Емульсія
Сполука за даним винаходом 0,1-30 частин
Рідкий носій 45-95 частин
Поверхнево-активна речовина 4,9-15 частин
- 10 Решта 0-10 частин
Як решта вказані, наприклад, засоби, що підсилюють розтікання, стабілізатори тощо.
[0124]
Рідкотекучий препарат
Сполука за даним винаходом 0,1-70 частин
- 15 Рідкий носій 15-98,89 частин
Поверхнево-активна речовина 1-12 частин
Решта 0,01-30 частин
Як решта вказані, наприклад, засоби, що перешкоджають замерзанню, загусники тощо.
[0125]
- 20 Сипучий препарат
Сполука за даним винаходом 0,1-90 частин
Твердий носій 0-98,9 частин
Поверхнево-активна речовина 1-20 частин
Решта 0-10 частин
- 25 Як решта вказані, наприклад, зв'язувальні засоби, стабілізатори тощо.
[0126]
Рідина
Сполука за даним винаходом 0,01-70 частин
Рідкий носій 20-99,99 частин
- 30 Решта 0-10 частин
Як решта вказані, наприклад, засоби, що перешкоджають замерзанню, засоби, що підсилюють розтікання тощо.
[0127]
Гранули
- 35 Сполука за даним винаходом 0,01-80 частин
Твердий носій 10-99,99 частин
Решта 0-10 частин
Як решта вказані, наприклад, зв'язувальні засоби, стабілізатори тощо.
[0128]
- 40 Порошок
Сполука за даним винаходом 0,01-30 частин
Твердий носій 65-99,99 частин
Решта 0-10 частин
Як решта вказані, наприклад, засоби, що перешкоджають розтіканню, стабілізатори тощо.
- 45 Під час застосування вищевказані склади можуть бути дисперговані як такі або після 1-10000-кратного розведення водою.
[0129]
Приклади складів
Далі показані пестицидні склади зі сполуками за даним винаходом в якості активного компонента, але вони не обмежуються лише ними. Крім того, в таких прикладах складання "частини" означають частини за вагою.
- 50 Приклад складання 1
Змочуваний порошок
Сполука за даним винаходом № А-1-01 20 частин
- 55 Пірофіліт 76 частин
Sorgol 5039 2 частини
(аніонна поверхнево-активна речовина: торгова марка Toho Chemical Industries (Corp.))
Capplex #80 2 частини
(синтетична водомістка кремнієва кислота: торгова марка Shionogi (Corp.))

З вищевказаного утворюють порошок, що змочується за допомогою однорідного змішування й подрібнення.

[0130] Приклад складання 2

Емульсія

5 Сполука за даним винаходом № А-1-01 5 частин

Ксилол 75 частин

N-метилпіролідон 15 частин

Sorgol 2680 5 частин

(аніонна поверхнево-активна речовина: торгова марка Toho Chemical Industries (Corp.))

10 З вищевказаного утворюють емульсію за допомогою однорідного змішування.

[0131] Приклад складання 3

Рідкотекучий препарат

Сполука за даним винаходом № А-1-01 25 частин

Agrisol S-710 10 частин

15 (неіонна поверхнево-активна речовина: торгова марка Kao (Corp.))

Lunox 1000C 0,5 частини

(аніонна поверхнево-активна речовина: торгова марка Toho Chemical Industries (Corp.))

Ксантанова камедь 0,02 частини

Вода 64,48 частини

20 З вищевказаного утворюють рідкотекучий препарат за допомогою однорідного змішування, а потім мокрого подрібнення.

[0132] Приклад складання 4 Сипучий препарат

Сполука за даним винаходом № А-1-01 75 частин

Hitenol NE-15 5 частин

25 (аніонна поверхнево-активна речовина: торгова марка Dai-Ichi Kogyo Seiyaku (Co.))

Vanillex N 10 частин

(аніонна поверхнево-активна речовина: торгова марка Nippon Paper (Corp.))

Carplex #80 10 частин

(синтетична водомістка кремнієва кислота: торгова марка Shionogi (Corp.))

30 З вищевказаного утворюють сипучий препарат за допомогою однорідного змішування й подрібнення, додавання невеликої кількості води, а потім перемішування, змішування й сполучення в загальну масу, грануляції за допомогою екструзійного гранулятора й висушування.

[0133] Приклад складання 5

35 Гранули

Сполука за даним винаходом № А-1-01 1 частина

Бентоніт 55 частин

Тальк 44 частини

40 З вищевказаного утворюють гранули за допомогою однорідного змішування й подрібнення, додавання невеликої кількості води, а потім перемішування, змішування й сполучення в загальну масу, грануляції за допомогою екструзійного гранулятора й висушування.

Практичні приклади

[0134]

45 Даний винахід більш докладно пояснюється нижче за допомогою конкретного вказання в якості практичних прикладів синтезу гетероциклічних амідних сполук, представлених формулою (1), що застосовуються в якості активних компонентів в гербіцидах за даним винаходом, а також тестових прикладів, проте даний винахід не обмежується ними.

Крім того, значення хімічного зсуву протонного ядерного магнітного резонансу в практичних прикладах вимірювали при 300 МГц із застосуванням в якості еталонної речовини Me₄Si (тетраметилсилану). Крім того, розчинники, що застосовуються у вимірюваннях, вказані в наступних прикладах синтезу. Крім того, символи в значеннях хімічного зсуву протонного ядерного магнітного резонансу в практичних прикладах мають наступні значення.

s: синглет; brs: широкий синглет; d: дуплет; t: триплет; m: мультиплет

[0135] Приклади синтезу

55 Приклад синтезу 1

N-(4,6-дихлорпіридин-2-іл)-2-метил-2-(4-оксо-5-феніл-1,3,5-оксадіазинан-3-іл)пропіонамід (сполука № А-2-17)

Стадія 1: Синтез 2-метил-2-(4-оксо-5-феніл-1,3,5-оксадіазинан-3-іл)пропіонілхлориду

60 Додавали 650 мг (5,12 ммоль) оксалілхлориду при охолодженні льодом до змішаного розчину 900 мг (3,41 ммоль) 2-метил-2-(4-оксо-5-феніл-1,3,5-оксадіазинан-3-іл)пропіонової

кислоти, 0,5 мл N,N-диметилформаміду і 20 мл метиленхлориду. Після завершення додавання зазначену рідину, що являє собою реакційну суміш, перемішували протягом 1 години при охолодженні льодом. Після завершення перемішування за допомогою відгону розчинника із вказаної реакційної рідини при зниженому тиску одержували 960 мг цільової сполуки у вигляді білої твердої речовини.

[0136] Стадія 2. Синтез N-(4,6-дихлорпіридин-2-іл)-2-метил-2-(4-оксо-5-феніл-1,3,5-оксадіазинан-3-іл)пропіонамід

Змішаний розчин 960 мг (3,40 ммоль) 2-метил-2-(4-оксо-5-феніл-1,3,5-оксадіазинан-3-іл)пропіонілхлориду, 660 мг (4,05 ммоль) 2-аміно-4,6-дихлорпіридину й 10 мл тетрагідрофурану додавали протягом 30 хвилин при охолодженні льодом до змішаного розчину 162 мг (4,25 ммоль) 63 ваг. % гідриду натрію (дисперсія в мінеральному маслі) і 30 мл тетрагідрофурану. Після завершення додавання зазначену рідину, що являє собою реакційну суміш, перемішували протягом 3 годин при охолодженні льодом. Після завершення перемішування реакцію зупиняли додаванням 40 мл води й екстрагували зазначену реакційну рідину етилацетатом (2 x 50 мл). Одержаний органічний шар сушили над безводним сульфатом натрію й розчинник відганяли при зниженому тиску. Одержаний залишок очищали за допомогою хроматографії на силікагелі [н-гексан:етилацетат = 9:1-1:9 (об'ємне співвідношення таке ж, як і нижче)] і одержували 560 мг цільової сполуки у вигляді білої твердої речовини.

Температура плавлення: 183-186°C

[0137] Приклад синтезу 2

N-(4,6-дихлорпіридин-2-іл)-2-метил-2-(5-феніл-4-тіоксо-1,3,5-оксадіазинан-3-іл)пропіонамід (сполука № A-2-18)

Додавали 260 мг (0,643 ммоль) 2,4-біс(4-метоксифеніл)-1,3-дитіа-2,4-дифосфетан-2,4-дисульфід при кімнатній температурі до змішаного розчину 130 мг (0,318 ммоль) N-(4,6-дихлорпіридин-2-іл)-2-метил-2-(4-оксо-5-феніл-1,3,5-оксадіазинан-3-іл)пропіонамід і 5 мл толуолу. Після завершення додавання зазначену рідину, що являє собою реакційну суміш, перемішували протягом 1 години при нагріванні зі зворотним холодильником. Після завершення перемішування зазначену реакційну рідину очищали за допомогою хроматографії на силікагелі (н-гексан:етилацетат = 9:1-3:7) і одержували 45 мг цільової сполуки у вигляді білої твердої речовини.

Температура плавлення: 187-189°C

[0138] Приклад синтезу 3

2-Метил-2-(4-оксо-5-феніл-1,3,5-оксадіазинан-3-іл)-N-пропіл-N-[4-(трифторметил)-піридин-2-іл]пропіонамід (сполука № A-5-05)

Додавали 180 мг (1,51 ммоль) тіонілхлориду при охолодженні льодом до змішаного розчину 200 мг (0,757 ммоль) 2-метил-2-(4-оксо-5-феніл-1,3,5-оксадіазинан-3-іл)пропіонової кислоти, 310 мг (1,52 ммоль) N-пропіл-4-(трифторметил)піридин-2-аміну, 10 мг (0,0819 ммоль) 4-(диметиламіно)піридину і 5 мл піридину. Після завершення додавання зазначену рідину, що являє собою реакційну суміш, перемішували протягом 3 годин при охолодженні льодом. Після завершення перемішування розчинник відганяли із вказаної реакційної рідини при зниженому тиску. Одержаний залишок очищали за допомогою хроматографії на силікагелі (н-гексан:етилацетат = 9:1-3:7) і одержували 115 мг цільової сполуки у вигляді білої твердої речовини.

Температура плавлення: 163-164°C

[0139] Приклад синтезу 4

N-(3-етил-1,2,4-тіадіазол-2-іл)-2-метил-2-[6-метил-4-оксо-5-(тіофен-3-іл)-2H-1,3-оксазин-3(4H)-іл]пропіонамід (сполука № B-1-02)

Додавали 270 мг (1,42 ммоль) 1-(3-диметиламінопропіл)-3-етилкарбодііміду гідрохлориду при кімнатній температурі до змішаного розчину 200 мг (0,711 ммоль) 2-метил-2-[6-метил-4-оксо-5-(тіофен-3-іл)-2H-1,3-оксазин-3(4H)-іл]пропіонової кислоти, 180 мг (1,39 ммоль) 3-етил-1,2,4-тіадіазол-5-аміну, 140 мг (1,38 ммоль) триетиламіну, 10 мг (0,0819 ммоль) 4-(диметиламіно)піридину й 3 мл метиленхлориду. Після завершення додавання зазначену рідину, що являє собою реакційну суміш, перемішували протягом ночі при кімнатній температурі. Після завершення перемішування реакцію зупиняли додаванням 20 мл води й екстрагували зазначену реакційну рідину хлороформом (2 x 20 мл). Одержаний органічний шар сушили над безводним сульфатом натрію й розчинник відганяли при зниженому тиску. Одержаний залишок очищали за допомогою хроматографії на силікагелі (н-гексан:етилацетат = 9:1-3:7) і одержували 81 мг цільової сполуки у вигляді жовтої твердої речовини.

Температура плавлення: 171-172°C

[0140] Приклад синтезу 5

2-[5-(2-Фторпіридин-3-іл)-6-метил-4-оксо-2Н-1,3-оксазин-3(4Н)-іл]-2-метил-N-[4-(трифторметил)піридин-2-іл]пропіонамід (сполука № В-2-17)

Додавали 100 мг (0,522 ммоль) 1-(3-диметиламінопропіл)-3-етилкарбодііміду гідрохлориду при кімнатній температурі до змішаного розчину 100 мг (0,340 ммоль) 2-[5-(2-фторпіридин-3-іл)-6-метил-4-оксо-2Н-1,3-оксазин-3(4Н)-іл]-2-метилпропіонової кислоти, 80 мг (0,494 ммоль) 4-(трифторметил)піридин-2-аміну, 70 мг (0,514 ммоль) 3Н-[1,2,3]триазол[4,5-*b*]піридин-3-олу й 5 мл N,N-диметилформаміду. Після завершення додавання зазначену рідину, що являє собою реакційну суміш, перемішували протягом ночі при кімнатній температурі. Після завершення перемішування реакцію зупиняли додаванням 20 мл води й екстрагували зазначену реакційну рідину хлороформом (2 x 20 мл). Одержаний органічний шар сушили над безводним сульфатом натрію й розчинник відганяли при зниженому тиску. Одержаний залишок очищали за допомогою хроматографії на силікагелі (н-гексан:етилацетат = 9:1-1:9) і одержували 20 мг цільової сполуки у вигляді білої твердої речовини.

Температура плавлення: 130-131°C

[0141] Приклад синтезу 6

N-(6-хлорпіридин-2-іл)-2-метил-2-[6-метил-4-оксо-5-(піримідин-5-іл)-2Н-1,3-оксазин-3(4Н)-іл]пропіонамід (сполука № В-2-22)

Стадія 1: Синтез 2-метил-2-[6-метил-4-оксо-5-(піримідин-5-іл)-2Н-1,3-оксазин-(4Н)-іл]пропіонілхлориду

Додавали 210 мг (1,65 ммоль) оксалілхлориду при охолодженні льодом до змішаного розчину 360 мг (1,30 ммоль) 2-метил-2-[6-метил-4-оксо-5-(піримідин-5-іл)-2Н-1,3-оксазин-3(4Н)-іл]пропіонової кислоти, 0,1 мл N,N-диметилформаміду і 15 мл метиленхлориду. Після завершення додавання зазначену рідину, що являє собою реакційну суміш, перемішували протягом 1 години при кімнатній температурі. Після завершення перемішування за допомогою відгону розчинника із вказаної реакційної рідини при зниженому тиску одержували 360 мг цільової сполуки у вигляді білої твердої речовини.

[0142] Стадія 2: Синтез N-(6-хлорпіридин-2-іл)-2-метил-2-[6-метил-4-оксо-5-(піримідин-5-іл)-2Н-1,3-оксазин-3(4Н)-іл]пропіонамід

Додавали 400 мг (3,95 ммоль) триетиламіну при охолодженні льодом до змішаного розчину 360 мг (1,22 ммоль) 2-метил-2-[6-метил-4-оксо-5-(піримідин-5-іл)-2Н-1,3-оксазин-3(4Н)-іл]пропіонілхлориду, 170 мг (1,32 ммоль) 6-хлорпіридин-2-аміну і 10 мл метиленхлориду. Після завершення додавання зазначену рідину, що являє собою реакційну суміш, перемішували протягом 1 години при кімнатній температурі. Після завершення перемішування реакцію зупиняли додаванням 20 мл води й екстрагували зазначену реакційну рідину хлороформом (2 x 20 мл). Одержаний органічний шар сушили над безводним сульфатом натрію й розчинник відганяли при зниженому тиску. Одержаний залишок очищали за допомогою хроматографії на силікагелі (н-гексан:етилацетат = 9:1-1:9) і одержували 114 мг цільової сполуки у вигляді смолистої речовини.

¹H-ЯМР (CDCl₃, Me₄Si, 300 МГц): δ 9,11 (s, 1H), 8,66 (s, 2H), 8,23 (br s, 1H), 8,19 (d, 1H, J = 8,4 Гц), 7,65 (dd, 1H, J = 8,4 Гц, 4,5 Гц), 7,05 (d, 1H, J = 4,5 Гц), 5,36 (s, 2H), 2,04 (s, 3H), 1,64 (s, 6H).

[0143] Порівняльний приклад 1

2-Метил-2-(4-оксо-5-феніл-1,3,5-оксадіазинан-3-іл)пропіонова кислота

Стадія 1: Синтез метил-2-метил-2-(3-фенілуреїдо)пропіонату

Додавали 1,68 г (13,0 ммоль) N,N-діізопропілетиламіну при охолодженні льодом до змішаного розчину 1,55 г (13,0 ммоль) ізоціанатобензолу, 2,00 г (13,0 ммоль) метил-2-аміно-2-метилпропіонату гідрохлориду і 50 мл метиленхлориду. Після завершення додавання зазначену рідину, що являє собою реакційну суміш, перемішували протягом ночі при кімнатній температурі. Після завершення перемішування реакцію зупиняли додаванням 50 мл води й екстрагували зазначену реакційну рідину метиленхлоридом (2 x 50 мл). Одержаний органічний шар сушили над безводним сульфатом натрію, відганяли розчинник при зниженому тиску і одержували 2,80 г цільової сполуки у вигляді білої твердої речовини.

Температура плавлення: 72-74°C

[0144] Стадія 2: Синтез метил-2-метил-2-(4-оксо-1,3,5-оксадіазинан-3-іл)пропіонату

Додавали 3 мл трифтороцтової кислоти при кімнатній температурі до змішаного розчину 2,30 г (9,74 ммоль) метил-2-метил-2-(3-фенілуреїдо)пропіонату, 950 мг (29,1 ммоль) параформальдегіду і 30 мл 1,2-дихлоретану. Після завершення додавання зазначену рідину, що являє собою реакційну суміш, перемішували протягом ночі при кімнатній температурі. Після завершення перемішування реакцію зупиняли додаванням 50 мл води й екстрагували зазначену реакційну рідину хлороформом (2 x 50 мл). Одержаний органічний шар сушили над безводним сульфатом натрію й розчинник відганяли при зниженому тиску. Одержаний залишок

очищали за допомогою хроматографії на силікагелі (н-гексан:етилацетат = 9:1-3:7) і одержували 1,24 мг цільової сполуки у вигляді білої твердої речовини.

Температура плавлення: 67-69°C

[0145] Стадія 3: Синтез 2-метил-2-(4-оксо-5-феніл-1,3,5-оксадіазинан-3-іл)пропіонової кислоти

Додавали 15 мл водного розчину 1 моль/л гідроксиду натрію при кімнатній температурі до змішаного розчину 1,24 г (4,46 ммоль) метил-2-метил-2-(4-оксо-5-феніл-1,3,5-оксадіазинан-3-іл)пропіонату і 15 мл метанолу. Після завершення додавання зазначену рідину, що являє собою реакційну суміш, перемішували при нагріванні зі зворотним холодильником протягом 5 годин. Після завершення перемішування розчинник відганяли із зазначеної реакційної суміші при зниженому тиску. Додавали 20 мл водного розчину 1 моль/л соляної кислоти до одержаного залишку і відфільтровували осаджений твердий продукт, одержували 470 мг цільової сполуки у вигляді білої твердої речовини.

Температура плавлення: 174-177°C

[0146] Порівняльний приклад 2

N-Пропіл-4-(трифторметил)піридин-2-амін

Додавали 1,95 г (33,0 ммоль) пропан-1-аміну при кімнатній температурі до змішаного розчину 2,00 г (11,0 ммоль) 2-хлор-4-(трифторметил)піридину і 15 мл N-метил-пірролідін-2-ону. Після завершення додавання зазначену рідину, що являє собою реакційну суміш, перемішували протягом 3 годин при 140°C. Після завершення перемішування реакцію зупиняли додаванням 30 мл води й екстрагували зазначену реакційну рідину етилацетатом (2 x 50 мл). Одержаний органічний шар сушили над безводним сульфатом натрію й розчинник відганяли при зниженому тиску. Одержаний залишок очищали за допомогою хроматографії на силікагелі (н-гексан:етилацетат = 99:1-80:20) і одержували 1,80 г цільової сполуки у вигляді білої твердої речовини.

Температура плавлення: 46-47°C

[0147] Порівняльний приклад 3

Етил-2-[3-(2-хлорпіридин-3-іл)уреїдо]-2-метилпропіонат

Порціями додавали 1,57 г (7,79 ммоль) (4-нітрофеніл)хлорформіату протягом 30 хвилин при охолодженні льодом до змішаного розчину 1,00 г (7,78 ммоль) 3-аміно-2-хлорпіридину, 620 мг (7,84 ммоль) піридину й 20 мл метиленхлориду. Після завершення додавання зазначену реакційну суміш перемішували протягом 2 годин при охолодженні льодом. Після цього до зазначеної реакційної суміші при охолодженні льодом додавали 1,30 г (7,76 ммоль) етил-2-аміно-2-метил-пропіонату гідрохлориду і 2,00 г (15,84 ммоль) N,N-діізопропілетиламіну. Після завершення додавання зазначену рідину, що являє собою реакційну суміш, перемішували протягом ночі при охолодженні льодом. Після завершення додавання реакцію зупиняли додаванням 30 мл води й екстрагували зазначену реакційну рідину метиленхлоридом (2 x 300 мл). Одержаний органічний шар сушили над безводним сульфатом натрію й розчинник відганяли при зниженому тиску. Одержаний залишок очищали за допомогою хроматографії на силікагелі (н-гексан:етилацетат = 9:1-3:7) і одержували 1,60 г цільової сполуки у вигляді білої твердої речовини.

¹H-ЯМР (CDCl₃, Me₄Si, 300 МГц): δ 8,56-8,51 (m, 1H), 8,02-7,99 (m, 1H), 7,27-7,16 (m, 1H), 6,84 (br s, 1H), 5,58 (br s, 1H), 4,19 (q, 2H, J = 7,2 Гц), 1,63 (s, 6H), 1,28 (t, 3H, J = 7,2 Гц).

[0148] Порівняльний приклад 4

6-Хлор-4-фторпіридин-2-амін

Додавали 7,46 г (49,11 ммоль) фториду цезію при кімнатній температурі до змішаного розчину 2,00 г (12,27 ммоль) 4,6-хлорпіридин-2-аміну і 30 мл диметилсульфоксиду. Після завершення додавання зазначену рідину, що являє собою реакційну суміш, перемішували протягом 12 годин при 170°C. Після завершення перемішування реакцію зупиняли додаванням 100 мл води й екстрагували зазначену реакційну рідину етилацетатом (2 x 300 мл). Одержаний органічний шар сушили над безводним сульфатом натрію і розчинник відганяли при зниженому тиску. Одержаний залишок очищали за допомогою хроматографії на силікагелі (н-гексан:етилацетат = 9:1-5:5) і одержували 95 мг цільової сполуки у вигляді білої твердої речовини.

[0149] Порівняльний приклад 5

4-Хлор-6-фторпіридин-2-амін

Додавали 7,46 г (49,11 ммоль) фториду цезію при кімнатній температурі до змішаного розчину 2,00 г (12,27 ммоль) 4,6-дихлорпіридин-2-аміну і 30 мл диметилсульфоксиду. Після завершення додавання зазначену рідину, що являє собою реакційну суміш, перемішували протягом 12 годин при 170°C. Після завершення перемішування реакцію зупиняли додаванням

100 мл води й екстрагували зазначену реакційну рідину етилацетатом (2 x 300 мл). Одержаний органічний шар сушили над безводним сульфатом натрію й розчинник відганяли при зниженому тиску. Одержаний залишок очищали за допомогою хроматографії на силікагелі (н-гексан:етилацетат = 9:1-5:5) і одержували 55 мг цільової сполуки у вигляді білої твердої речовини.

[0150] Порівняльний приклад 6

4-Хлор-6-метоксипіридин-2-амін

Додавали 1,19 г (6,17 ммоль) 28 ваг. % метанольного розчину метоксиду натрію при кімнатній температурі до змішаного розчину 1,00 г (6,13 ммоль) 4,6-дихлорпіридин-2-аміну і 8 мл диметилсульфоксиду. Після завершення додавання зазначену рідину, що являє собою реакційну суміш, перемішували протягом 10 годин при 50°C. Після завершення перемішування реакцію зупиняли додаванням 20 мл води й екстрагували зазначену реакційну рідину діетиловим етером (2 x 30 мл). Одержаний органічний шар сушили над безводним сульфатом натрію й розчинник відганяли при зниженому тиску. Одержаний залишок очищали за допомогою хроматографії на силікагелі (н-гексан:етилацетат = 9:1-1:9) і одержували 280 мг цільової сполуки у вигляді безбарвної рідини.

¹H-ЯМР (CDCl₃, Me₄Si, 300 МГц): δ 6,39 (s, 1H), 6,07 (s, 1H), 4,37 (br s, 2H), 3,83 (s, 3H).

[0151] Порівняльний приклад 7

4-Хлор-6-феноксипіридин-2-амін

Додавали 630 мг (6,69 ммоль) фенолу й 1,00 г (6,13 ммоль) 4,6-дихлорпіридин-2-аміну при кімнатній температурі до змішаного розчину, що містить 250 мг (6,56 ммоль) 63 ваг. % гідриду натрію (дисперсія в мінеральному маслі) і 15 мл диметилсульфоксиду. Після завершення додавання зазначену рідину, що являє собою реакційну суміш, перемішували протягом 14 годин при 100°C. Після завершення перемішування реакцію зупиняли додаванням 30 мл води й екстрагували зазначену реакційну рідину діетиловим етером (2 x 30 мл). Одержаний органічний шар сушили над безводним сульфатом натрію й розчинник відганяли при зниженому тиску. Одержаний залишок очищали за допомогою хроматографії на силікагелі (н-гексан:етилацетат = 9:1-1:9) і одержували 70 мг цільової сполуки у вигляді коричневої твердої речовини.

¹H-ЯМР (CDCl₃, Me₄Si, 300 МГц): δ 7,44-7,35 (m, 2H), 7,21-7,18 (m, 1H), 7,13-7,09 (m, 2H), 6,19 (s, 1H), 6,08 (s, 1H), 4,52 (br s, 2H).

[0152] Порівняльний приклад 8

6-Хлор-4-феноксипіридин-2-амін

Додавали 630 мг (6,69 ммоль) фенолу і 1,00 г (6,13 ммоль) 4,6-дихлорпіридин-2-аміну при кімнатній температурі до змішаного розчину, що містить 250 мг (6,56 ммоль) 63 ваг. % гідриду натрію (дисперсія в мінеральному маслі) і 15 мл диметилсульфоксиду. Після завершення додавання зазначену рідину, що являє собою реакційну суміш, перемішували протягом 14 годин при 100°C. Після завершення перемішування реакцію зупиняли додаванням 30 мл води й екстрагували зазначену реакційну рідину діетиловим етером (2 x 30 мл). Одержаний органічний шар сушили над безводним сульфатом натрію й розчинник відганяли при зниженому тиску. Одержаний залишок очищали за допомогою хроматографії на силікагелі (н-гексан:етилацетат = 9:1-1:9) і одержували 210 мг цільової сполуки у вигляді коричневої твердої речовини.

¹H-ЯМР (CDCl₃, Me₄Si, 300 МГц): δ 7,45-7,36 (m, 2H), 7,24-7,21 (m, 1H), 7,11-7,05 (m, 2H), 6,27 (s, 1H), 5,84 (s, 1H), 4,48 (br s, 2H).

[0153] Порівняльний приклад 9

4-Хлор-6-циклопропілпіридин-2-амін

Додавали 500 мг (3,07 ммоль) 4,6-дихлорпіридин-2-аміну, 270 мг (3,14 ммоль) циклопропілборонової кислоти й 1,08 г (10,19 ммоль) карбонату натрію при кімнатній температурі до змішаного розчину 360 мг (0,312 ммоль) тетракіс(трифенілфосфін)паладію(0), 10 мл толуолу й 5 мл води. Після завершення додавання повітря в реакційній посудині замінювали газоподібним азотом. Після завершення заміни зазначену рідину, що являє собою реакційну суміш, перемішували протягом 6 годин при нагріванні зі зворотним холодильником в атмосфері газоподібного азоту. Після завершення перемішування реакцію зупиняли додаванням 20 мл води й екстрагували зазначену реакційну рідину етилацетатом (2 x 30 мл). Одержаний органічний шар сушили над безводним сульфатом натрію й розчинник відганяли при зниженому тиску. Одержаний залишок очищали за допомогою хроматографії на силікагелі (н-гексан:етилацетат = 9:1-6:4) і одержували 10 мг цільової сполуки у вигляді білої твердої речовини.

¹H-ЯМР (CDCl₃, Me₄Si, 300 МГц): δ 6,50 (s, 1H), 6,28 (s, 1H), 4,40 (br s, 2H), 1,88-1,79 (m, 1H), 1,06-1,00 (m, 2H), 0,99-0,95 (m, 2H).

[0154] Порівняльний приклад 10

6-Хлор-4-(дифторметокси)піридин-2-амін

Стадія 1: Синтез 2,6-дихлор-4-(дифторметокси)піридину

Додавали 720 мг (5,21 ммоль) карбонату калію при кімнатній температурі до змішаного розчину 600 мг (3,66 ммоль) 2,6-дихлорпіридин-4-олу, 1,08 г (5,32 ммоль) 2-бром-2,2-дифторетилацетату й 15 мл N,N-диметилформаміду. Після завершення додавання зазначену рідину, що являє собою реакційну суміш, перемішували протягом 4 годин при 50°C. Після завершення перемішування реакцію зупиняли додаванням 30 мл води й екстрагували зазначену реакційну рідину етилацетатом (2 x 30 мл). Одержаний органічний шар сушили над безводним сульфатом натрію й розчинник відганяли при зниженому тиску. Одержаний залишок очищали за допомогою хроматографії на силікагелі (н-гексан:етилацетат = 99:1-90:10) і одержували 740 мг цільової сполуки у вигляді безбарвної рідини.

[0155] Стадія 2: Синтез 2-бром-6-хлор-4-(дифторметокси)піридину

Додавали 4,40 г (28,7 ммоль) бромтриметилсилану при кімнатній температурі до змішаного розчину 410 мг (1,92 ммоль) 2,6-дихлор-4-(дифторметокси)піридину й 10 мл ацетонітрилу. Після завершення додавання зазначену рідину, що являє собою реакційну суміш, перемішували протягом 2 днів при нагріванні зі зворотним холодильником. Після завершення перемішування розчинник відганяли із вказаної реакційної рідини при зниженому тиску. Одержаний залишок очищали за допомогою хроматографії на силікагелі (н-гексан:етилацетат = 99:1-90:10) і одержували 410 мг цільової сполуки у вигляді безбарвної рідини.

[0156] Стадія 3: Синтез 6-хлор-4-(дифторметокси)піридин-2-аміну

Додавали 2,90 г (47,7 ммоль) водного розчину аміаку (28 ваг. %) і 110 мг (0,796 ммоль) карбонату калію при кімнатній температурі до змішаного розчину 410 мг (1,59 ммоль) 2-бром-6-хлор-4-(дифторметокси)піридину, 25 мг (0,175 ммоль) міді(1) оксиду, 30 мг (0,340 ммоль) N,N'-диметилетилендіаміну й 10 мл етиленгліколю. Після завершення додавання зазначену рідину, що являє собою реакційну суміш, перемішували протягом 3 годин при нагріванні зі зворотним холодильником. Після завершення перемішування реакцію зупиняли додаванням 30 мл води й екстрагували зазначену реакційну рідину етилацетатом (2 x 30 мл). Одержаний органічний шар сушили над безводним сульфатом натрію й розчинник відганяли при зниженому тиску. Одержаний залишок очищали за допомогою хроматографії на силікагелі (н-гексан:етилацетат = 9:1-5:5) і одержували 65 мг цільової сполуки у вигляді білої твердої речовини.

¹H-ЯМР (CDCl₃, Me₄Si, 300 МГц): δ 6,56 (t, 1H, J = 72 Гц), 6,45-6,42 (m, 1H), 6,09-6,06 (m, 1H), 4,68 (br s, 2H).

[0157] Порівняльний приклад 11

6-Метокси-4-(трифторметил)піридин-2-амін

Додавали 640 мг (3,32 ммоль) 28 ваг. % метанольного розчину метоксиду натрію до змішаного розчину 200 мг (1,11 ммоль) 6-фтор-4-(трифторметил)піридин-2-аміну й 5 мл метанолу. Після завершення додавання зазначену рідину, що являє собою реакційну суміш, перемішували протягом 3 годин при нагріванні зі зворотним холодильником. Після завершення перемішування реакцію зупиняли додаванням 10 мл води й екстрагували зазначену реакційну рідину етилацетатом (2x20 мл). Одержаний органічний шар промивали водою, а потім сушили над безводним сульфатом натрію й відганяли розчинник при зниженому тиску. Одержаний залишок очищали за допомогою хроматографії на силікагелі (н-гексан:етилацетат = 9:1-7:3) і одержували 190 мг цільової сполуки у вигляді жовтої твердої речовини.

[0158] Порівняльний приклад 12

6-Фтор-4-метилпіридин-2-амін

Додавали 8 мл водного розчину аміаку (28 ваг. %) і 150 мг (1,09 ммоль) карбонату калію при кімнатній температурі до змішаного розчину 1,00 г (5,26 ммоль) 2-бром-6-фтор-4-метилпіридину, 38 мг (0,266 ммоль) міді(1) оксиду, 46 мг (0,522 ммоль) N,N'-диметилетилендіаміну й 10 мл етиленгліколю. Після завершення додавання зазначену рідину, що являє собою реакційну суміш, перемішували протягом 10 годин при нагріванні зі зворотним холодильником. Після завершення перемішування реакцію зупиняли додаванням 30 мл води й екстрагували зазначену реакційну рідину етилацетатом (2x20 мл). Одержаний органічний шар промивали водою, а потім сушили над безводним сульфатом натрію й відганяли розчинник при зниженому тиску. Одержаний залишок очищали за допомогою хроматографії на силікагелі (н-гексан:етилацетат = 9:1-6:4) і одержували 400 мг цільової сполуки у вигляді білої твердої речовини.

¹H-ЯМР (CDCl₃, Me₄Si, 300 МГц): δ 6,13 (s, 1H), 6,06 (s, 1H), 4,37 (br s, 2H), 2,24 (s, 3H).

[0159] Порівняльний приклад 13

4-Етил-6-фторпіридин-2-амін

Додавали 100 мг (0,524 ммоль) 4-бром-6-фторпіридин-2-аміну, 58 мг (0,785 ммоль) етилборонової кислоти і 250 мг (1,81 ммоль) карбонату калію при кімнатній температурі до змішаного розчину 16 мг (0,0138 ммоль) тетракіс(трифенілфосфін)паладію(0), 2 мл 1,4-діоксану й 2 мл води. Після завершення додавання повітря в реакційній посудині замінювали газоподібним азотом. Після завершення заміни зазначену рідину, що являє собою реакційну суміш, перемішували протягом 10 годин в атмосфері азоту при нагріванні зі зворотним холодильником. Після завершення перемішування реакцію зупиняли додаванням 10 мл води й екстрагували зазначену реакційну рідину етилацетатом (3x15 мл). Одержаний органічний шар промивали водою, а потім сушили над безводним сульфатом натрію й відганяли розчинник при зниженому тиску. Одержаний залишок очищали за допомогою хроматографії на силікагелі (н-гексан:етилацетат = 10:0-9:1) і одержували 50 мг цільової сполуки у вигляді безбарвної рідини.

[0160] Порівняльний приклад 14

6-(Фторметил)піридин-2-амін

Стадія 1: Синтез 2-бром-6-(фторметил)піридину

Додавали 2,10 г (13,0 ммоль) (діетиламіно)сірки трифториду при охолодженні льодом до змішаного розчину 2,24 г (11,9 ммоль) (6-бромпіридин-2-іл)метанолу й 40 мл метиленхлориду. Після завершення додавання зазначену рідину, що являє собою реакційну суміш, перемішували протягом 1 години при охолодженні льодом. Після завершення перемішування реакцію зупиняли за допомогою додавання 30 мл насиченого водного розчину гідрокарбонату натрію й екстрагували зазначену реакційну рідину метиленхлоридом (2x30 мл). Одержаний органічний шар промивали водою, а потім сушили над безводним сульфатом натрію й відганяли розчинник при зниженому тиску. Одержаний залишок очищали за допомогою хроматографії на силікагелі (н-гексан:етилацетат = 10:0-9:1) і одержували 860 мг цільової сполуки у вигляді білої твердої речовини.

[0161] Стадія 2: Синтез (6-фторметил)піридин-2-аміну

Додавали 7 мл водного розчину аміаку (28 ваг. %) і 120 мг (0,868 ммоль) карбонату калію при кімнатній температурі до змішаного розчину 850 мг (4,47 ммоль) 2-бром-6-(фторметил)піридину, 31 мг (0,217 ммоль) міді(І) оксиду, 40 мг (0,454 ммоль) N,N'-диметилетилендіаміну й 10 мл етиленгліколю. Після завершення додавання зазначену рідину, що являє собою реакційну суміш, перемішували протягом 8 годин при нагріванні зі зворотним холодильником. Після завершення перемішування реакцію зупиняли додаванням 30 мл води й екстрагували зазначену реакційну рідину етилацетатом (2x20 мл). Одержаний органічний шар промивали водою, а потім сушили над безводним сульфатом натрію й відганяли розчинник при зниженому тиску. Одержаний залишок очищали за допомогою хроматографії на силікагелі (н-гексан:етилацетат = 9:1-6:4) і одержували 150 мг цільової сполуки у вигляді білої твердої речовини.

¹H-ЯМР (CDCl₃, Me₄Si, 300 МГц): δ 7,47 (dd, 1H, J = 7,2 Гц, 8,4 Гц), 6,78 (d, 1H, J = 7,2 Гц), 6,45 (d, 1H, J = 8,4 Гц), 5,28 (d, 2H, J = 47 Гц), 4,47 (br s, 2H).

[0162] Порівняльний приклад 15

6-(Дифторметил)піридин-2-амін

Стадія 1: Синтез 2-бром-6-(дифторметил)піридину

Додавали 3,81 г (23,6 ммоль) (діетиламіно)сірки трифториду при охолодженні льодом до змішаного розчину 2,00 г (10,8 ммоль) 6-бромпіколінальдегіду й 40 мл метиленхлориду. Після завершення додавання зазначену рідину, що являє собою реакційну суміш, перемішували протягом 2 годин при охолодженні льодом. Після завершення перемішування реакцію зупиняли за допомогою додавання 30 мл насиченого водного розчину гідрокарбонату натрію й екстрагували зазначену реакційну рідину метиленхлоридом (2x30 мл). Одержаний органічний шар промивали водою, а потім сушили над безводним сульфатом натрію й відганяли розчинник при зниженому тиску. Одержаний залишок очищали за допомогою хроматографії на силікагелі (н-гексан:етилацетат = 10:0-8:2) і одержували 1,87 г цільової сполуки у вигляді білої твердої речовини.

¹H-ЯМР (CDCl₃, Me₄Si, 300 МГц): δ 7,73-7,58 (m, 3H), 6,58 (t, 1H, J = 56 Гц).

[0163] Стадія 2: Синтез (6-дифторметил)піридин-2-аміну

Додавали 13 мл водного розчину аміаку (28 ваг. %) і 250 мг (1,81 ммоль) карбонату калію при кімнатній температурі до змішаного розчину 1,86 г (8,94 ммоль) 2-бром-6-(фторметил)піридину, 64 мг (0,447 ммоль) міді(І) оксиду, 80 мг (0,908 ммоль) N,N'-диметилетилендіаміну й 18 мл етиленгліколю. Після завершення додавання зазначену рідину, що являє собою реакційну суміш, перемішували протягом 22 годин при нагріванні зі зворотним холодильником. Після завершення перемішування реакцію зупиняли додаванням 30 мл води й екстрагували зазначену реакційну рідину етилацетатом (2x20 мл). Одержаний органічний шар

промивали водою, а потім сушили над безводним сульфатом натрію й відганяли розчинник при зниженому тиску. Одержаний залишок очищали за допомогою хроматографії на силікагелі (н-гексан:етилацетат = 9:1-6:4) і одержували 770 мг цільової сполуки у вигляді безбарвної рідини.

¹H-ЯМР (CDCl₃, Me₄Si, 300 МГц): δ 7,53 (dd, 1H, J = 7,2 Гц, 8,1 Гц), 6,94 (d, 1H, J = 7,2 Гц), 6,57 (d, 1H, J = 8,1 Гц), 6,42 (t, 1H, J = 56 Гц), 4,58 (br s, 2H).

[0164] Порівняльний приклад 16

4-(Дифторметокси)піридин-2-амін

Стадія 1: Синтез 2-бром-4-(дифторметокси)піридину

Додавали 1,40 г (6,90 ммоль) етилового етеру 2-бром-2,2-дифторацетату при кімнатній температурі до змішаного розчину 1,00 г (5,75 ммоль) 2-бромпіридин-4-олу, 1,59 г (11,5 ммоль) калію карбонату й 20 мл N,N-диметилформаміду. Після завершення додавання зазначену рідину, що являє собою реакційну суміш, перемішували протягом 30 хвилин при 50°C. Після завершення перемішування реакцію зупиняли додаванням 30 мл води й екстрагували зазначену реакційну рідину етилацетатом (2x20 мл). Одержаний органічний шар промивали водою, а потім сушили над безводним сульфатом натрію й відганяли розчинник при зниженому тиску. Одержаний залишок очищали за допомогою хроматографії на силікагелі (н-гексан:етилацетат = 10:0-8:2) і одержували 1,12 г цільової сполуки у вигляді безбарвної рідини.

¹H-ЯМР (CDCl₃, Me₄Si, 300 МГц): δ 8,33 (d, 1H, J = 5,4 Гц), 7,25 (s, 1H), 7,03-6,99 (m, 1H), 6,62 (t, 1H, J = 72 Гц).

[0165] Стадія 2: Синтез (4-дифторметокси)піридин-2-аміну

Додавали 8 мл водного розчину аміаку (28 ваг. %) і 140 мг (1,01 ммоль) карбонату калію при кімнатній температурі до змішаного розчину 1,12 г (5,00 ммоль) 2-бром-4-(дифторметокси)піридину, 35 мг (0,245 ммоль) міді(І) оксиду, 40 мг (0,454 ммоль) N,N'-диметилетилендіаміну й 10 мл етиленгліколю. Після завершення додавання зазначену рідину, що являє собою реакційну суміш, перемішували протягом 8 годин при нагріванні зі зворотним холодильником. Після завершення перемішування реакцію зупиняли додаванням 20 мл води й екстрагували зазначену реакційну рідину етилацетатом (2x20 мл). Одержаний органічний шар промивали водою, а потім сушили над безводним сульфатом натрію й відганяли розчинник при зниженому тиску. Одержаний залишок очищали за допомогою хроматографії на силікагелі (н-гексан:етилацетат = 9:1-1:1) і одержували 120 мг цільової сполуки у вигляді блідо-жовтої рідини.

¹H-ЯМР (CDCl₃, Me₄Si, 300 МГц): δ 8,02 (d, 1H, J = 5,7 Гц), 6,56 (t, 1H, J = 73 Гц), 6,39 (dd, 1H, J = 5,7 Гц, 2,1 Гц), 6,17 (d, 1H, J = 2,1 Гц), 4,51 (br s, 2H).

[0166] Порівняльний приклад 17

6-Фтор-4-метоксипіридин-2-амін

Додавали 89 мг (0,461 ммоль) 28 ваг. % метанольного розчину метоксиду натрію при кімнатній температурі до змішаного розчину 50 мг (0,384 ммоль) 4,6-дифторпіридин-2-аміну й 2 мл метанолу. Після завершення додавання зазначену рідину, що являє собою реакційну суміш, перемішували протягом 24 годин при 60°C. Після завершення перемішування реакцію зупиняли додаванням 10 мл води й екстрагували зазначену реакційну рідину етилацетатом (2 x 10 мл). Одержаний органічний шар сушили над безводним сульфатом натрію й розчинник відганяли при зниженому тиску. Одержаний залишок очищали за допомогою хроматографії на силікагелі (н-гексан:етилацетат = 9:1-7:3) і одержували 29 мг цільової сполуки у вигляді білої твердої речовини.

[0167] Порівняльний приклад 18

6-Фтор-[3,4'-біпіридин]-2'-амін

Додавали 490 мг (3,48 ммоль) (6-фторпіридин-3-іл)боронової кислоти і 1,70 г (16,1 ммоль) карбонату натрію при кімнатній температурі до змішаного розчину 400 мг (2,31 ммоль) 4-бромпіридин-2-аміну, 90 мг (0,123 ммоль) [1,1'-біс(дифенілфосфіно)фероцен]паладію(2) дихлориду, 4 мл толуолу й 6 мл води. Після завершення додавання повітря в реакційній посудині замінювали газоподібним азотом. Після завершення заміни зазначену рідину, що являє собою реакційну суміш, перемішували протягом 2 годин в атмосфері газоподібного азоту при нагріванні зі зворотним холодильником. Після завершення перемішування реакцію зупиняли додаванням 15 мл води й екстрагували зазначену реакційну рідину етилацетатом (3x30 мл). Одержаний органічний шар сушили над безводним сульфатом натрію й розчинник відганяли при зниженому тиску. Одержаний залишок очищали за допомогою хроматографії на силікагелі (метанол:етилацетат = 1:9) і одержували 430 мг цільової сполуки у вигляді білої твердої речовини.

¹H-ЯМР (CDCl₃, Me₄Si, 300 МГц): δ 8,43 (d, 1H, J = 2,4 Гц), 8,15 (d, 1H, J = 5,4 Гц), 7,99-7,93 (m, 1H), 7,06-7,00 (m, 1H), 6,86-6,78 (m, 1H), 6,64 (s, 1H), 4,61 (br s, 2H).

[0168] Порівняльний приклад 19

4-(1-Метил-1Н-піразол-5-іл)піридин-2-амін

Додавали 440 мг (3,49 ммоль) (1-метил-1Н-піразол-5-іл)боронової кислоти і 1,70 г (16,1 ммоль) карбонату натрію при кімнатній температурі до змішаного розчину 400 мг (2,31 ммоль) 4-бромпіридин-2-аміну, 90 мг (0,123 ммоль) [1,1'-біс(дифенілфосфіно)фероцен]паладію(2) дихлориду, 20 мл толуолу й 5 мл води. Після завершення додавання повітря в реакційній посудині замінювали газоподібним азотом. Після завершення заміни зазначену рідину, що являє собою реакційну суміш, перемішували протягом 2 годин в атмосфері газоподібного азоту при нагріванні зі зворотним холодильником. Після завершення перемішування реакцію зупиняли додаванням 30 мл води й екстрагували зазначену реакційну рідину етилацетатом (3х30 мл). Одержаний органічний шар сушили над безводним сульфатом натрію й розчинник відганяли при зниженому тиску. Одержаний залишок очищали за допомогою хроматографії на силікагелі (метанол:етилацетат = 1:9) і одержували 100 мг цільової сполуки у вигляді коричневої твердої речовини.

[0169] Порівняльний приклад 20

4-(Тіофен-3-іл)піридин-2-амін

Додавали 720 мг (5,63 ммоль) тіофен-3-ілборонової кислоти і 1,70 г (16,1 ммоль) карбонату натрію при кімнатній температурі до змішаного розчину 400 мг (2,31 ммоль) 4-бромпіридин-2-аміну, 90 мг (0,123 ммоль) [1,1'-біс(дифенілфосфіно)фероцен]паладію(2) дихлориду, 20 мл толуолу й 5 мл води. Після завершення додавання повітря в реакційній посудині замінювали газоподібним азотом. Після завершення заміни зазначену рідину, що являє собою реакційну суміш, перемішували протягом 2 годин в атмосфері азоту при нагріванні зі зворотним холодильником. Після завершення перемішування реакцію зупиняли додаванням 30 мл води й екстрагували зазначену реакційну рідину етилацетатом (3х30 мл). Одержаний органічний шар сушили над безводним сульфатом натрію й розчинник відганяли при зниженому тиску. Одержаний залишок очищали за допомогою хроматографії на силікагелі (метанол:етилацетат = 1:9) і одержували 100 мг цільової сполуки у вигляді білої твердої речовини.

[0170] Порівняльний приклад 21

2-[5-(2-фторпіридин-3-іл)-6-метил-4-оксо-2Н-1,3-оксазин-3 (4Н)-іл]-2-метилпропіонова кислота

Стадія 1: Синтез 5-(2-фторпіридин-3-іл)-2,2,6-триметил-4Н-1,3-діоксин-4-ону

Додавали 1,81 г (2,66 ммоль) [1,3-біс(2,6-діізопропілфеніл)імідазол-2-іліден](3-хлорпіридил)паладію(2) дихлориду при кімнатній температурі до змішаного розчину 14,3 г (53,4 ммоль) 5-йод-2,2,6-триметил-4Н-1,3-діоксин-4-ону, 11,3 г (80,1 ммоль) (2-фторпіридин-3-іл)боронової кислоти, 33,93 г (320 ммоль) карбонату натрію, 150 мл тетрагідрофурану і 150 мл води. Після завершення додавання повітря в реакційній посудині замінювали газоподібним азотом. Після завершення заміни зазначену рідину, що являє собою реакційну суміш, перемішували протягом 4 годин при нагріванні зі зворотним холодильником в атмосфері газоподібного азоту. Після завершення перемішування реакцію зупиняли додаванням 200 мл води й екстрагували зазначену реакційну рідину етилацетатом (2 х 300 мл). Одержаний органічний шар промивали водою, а потім сушили над безводним сульфатом натрію й відганяли розчинник при зниженому тиску. Одержаний залишок очищали за допомогою хроматографії на силікагелі (н-гексан:етилацетат = 9:1-6:4) і одержували 8,86 г цільової сполуки у вигляді коричневої твердої речовини.

[0171] Стадія 2: Синтез бензил-2-[5-(2-фторпіридин-3-іл)-6-метил-4-оксо-2Н-1,3-оксазин-3(4Н)-іл]-2-метилпропіонату

Додавали 8,85 г (37,3 ммоль) 5-(2-фторпіридин-3-іл)-2,2,6-триметил-4Н-1,3-діоксин-4-ону при кімнатній температурі до змішаного розчину 7,66 г (37,3 ммоль) бензил-2-метил-2-(метиленаміно)пропіонату й 100 мл ксилолу. Після завершення додавання зазначену рідину, що являє собою реакційну суміш, перемішували при нагріванні зі зворотним холодильником протягом 5 годин. Після завершення перемішування розчинник відганяли із зазначеної реакційної суміші при зниженому тиску. Одержаний залишок очищали за допомогою хроматографії на силікагелі (н-гексан:етилацетат = 9:1-3:7) і одержували 13,0 г цільової сполуки у вигляді безбарвної рідини.

[0172] Стадія 3: Синтез 2-[5-(2-фторпіридин-3-іл)-6-метил-4-оксо-2Н-1,3-оксазин-3(4Н)-іл]-2-метилпропіонової кислоти

Додавали 1,30 г 5 ваг. % Pd/C (N. E. Chemcat Corp. тип STD) до змішаного розчину 12,9 г (33,6 ммоль) бензил-2-[5-(2-фторпіридин-3-іл)-6-метил-4-оксо-2Н-1,3-оксазин-3(4Н)-іл]-2-метилпропіонату й 150 мл тетрагідрофурану. Після завершення додавання повітря в реакційній посудині заміняли газоподібним воднем. Після завершення заміни зазначену рідину, що являє собою реакційну суміш, перемішували протягом ночі при кімнатній температурі в атмосфері

водню. Після завершення перемішування газ всередині реакційної посудини заміняли газоподібним азотом і зазначену реакційну рідину фільтрували через целіт. Розчинник відганяли з фільтрату, одержаного при зниженому тиску, і одержували 7,46 г цільової сполуки у вигляді білої твердої речовини.

5 Температура плавлення: 179-182°C

[0173] Порівняльний приклад 22

Синтез 2-метил-2-[6-метил-4-оксо-5-(піримідин-5-іл)-2Н-1,3-оксазин-3(4Н)-іл]пропіонової кислоти

Стадія 1: Синтез 2,2,6-триметил-5-(піримідин-5-іл)-4Н-1,3-діоксин-4-ону

10 Додавали 1,30 г (1,91 ммоль) [1,3-біс (2,6-діізопропілфеніл)імідазол-2-іліден](3-хлор-піридил)паладію(2) дихлориду при кімнатній температурі до змішаного розчину 6,00 г (32,7 ммоль) (2,2,6-триметил-4-оксо-4Н-1,3-діоксин-5-іл)боронової кислоти, 7,70 г (48,7 ммоль) 5-бромпіримідину, 16,6 г (157 ммоль) карбонату натрію, 100 мл тетрагідрофурану й 100 мл води. Після завершення додавання повітря в реакційній посудині замінювали газоподібним азотом.

15 Після завершення заміни зазначену рідину, що являє собою реакційну суміш, перемішували протягом ночі при нагріванні зі зворотним холодильником в атмосфері газоподібного азоту. Після завершення перемішування реакцію зупиняли додаванням 200 мл води й екстрагували зазначену реакційну рідину етилацетатом (2 x 300 мл). Одержаний органічний шар промивали водою, а потім сушили над безводним сульфатом натрію й відганяли розчинник при зниженому тиску. Одержаний залишок очищали за допомогою хроматографії на силікагелі (н-гексан:етилацетат = 9:1-1:9) і одержували 2,00 г цільової сполуки у вигляді жовтої твердої речовини.

[0174] Стадія 2: Синтез 4-нітробензил-2-метил-2-[6-метил-4-оксо-5-(піримідин-5-іл)-2Н-1,3-оксазин-3(4Н)-іл]пропіонату

25 Додавали 2,50 г (11,4 ммоль) 2,2,6-триметил-5-(піримідин-5-іл)-4Н-1,3-діоксин-4-ону при кімнатній температурі до змішаного розчину 2,85 г (11,4 ммоль) 4-нітробензил-2-метил-2-(метиленаміно)пропіонату й 100 мл ксилолу. Після завершення додавання зазначену рідину, що являє собою реакційну суміш, перемішували при нагріванні зі зворотним холодильником протягом 5 годин. Після завершення перемішування розчинник відганяли із вказаної реакційної рідини при зниженому тиску. Одержаний залишок очищали за допомогою хроматографії на силікагелі (н-гексан:етилацетат = 9:1-3:7) і одержували 1,80 г цільової сполуки у вигляді безбарвної рідини.

[0175] Стадія 3: Синтез 2-метил-2-[6-метил-4-оксо-5-(піримідин-5-іл)-2Н-1,3-оксазин-3(4Н)-іл]пропіонової кислоти

35 Додавали 500 мг 5 ваг. % Pd/C (N.E. Chemcat Corp. тип STD) до змішаного розчину 1,80 г (4,36 ммоль) 4-нітробензил-2-метил-2-[6-метил-4-оксо-5-(піримідин-5-іл)-2Н-1,3-оксазин-3(4Н)-іл]пропіонату, 40 мл метанолу й 80 мл етилацетату. Після завершення додавання повітря в реакційній посудині заміняли газоподібним воднем. Після завершення заміни зазначену рідину, що являє собою реакційну суміш, перемішували протягом 4 годин при 50°C в атмосфері водню.

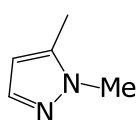
40 Після завершення перемішування газ в реакційній посудині заміняли газоподібним азотом і зазначену реакційну рідину фільтрували через целіт. Розчинник відганяли з фільтрату, одержаного при зниженому тиску. Одержаний залишок очищали за допомогою хроматографії на силікагелі (н-гексан:етилацетат = 9:1-1:9) і одержували 800 мг цільової сполуки у вигляді безбарвної рідини.

45 [0176] Сполуки за даним винаходом можуть бути синтезовані згідно з вищезазначеними прикладами синтезу. Приклади сполук за даним винаходом, одержаних аналогічно прикладам синтезу 1-6, наведені в таблицях 3-14, проте даний винахід не обмежується лише ними. При цьому в таблицях вираз Me означає метильну групу, і аналогічно нижче Et являє собою етильну групу, Pr являє собою пропильну групу, OMe являє собою метоксигрупу, OEt являє собою етоксигрупу, OPh являє собою феноксигрупу, SMe являє собою метилтіогрупу, pH являє собою фенільну групу, CO₂Me являє собою метоксикарбонільну групу, n- означає нормальний, i- означає ізо, а c- означає цикло.

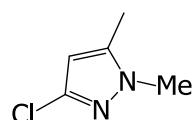
Крім того, в таблицях вираз "т. п." являє собою "точку плавлення", а вираз "*1" являє собою смолистий стан, відповідно.

55 [0177] Відповідні структури ароматичних гетероциклів, показаних в таблицях, наведені нижче.

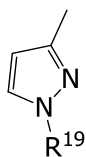
[Xim. 39]



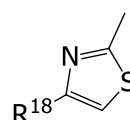
T-1a



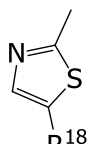
T-1b



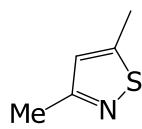
T-3a



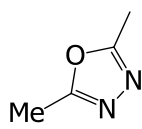
T-4a



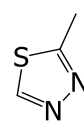
T-4b



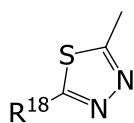
T-7a



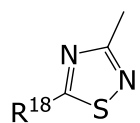
T-10a



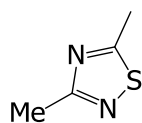
T-13a



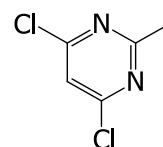
T-13b



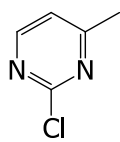
T-14a



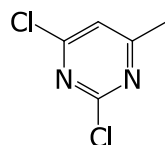
T-15a



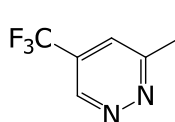
T-19a



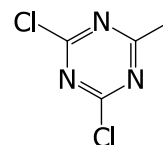
T-20a



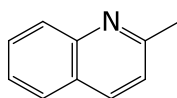
T-20b



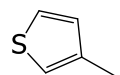
T-22a



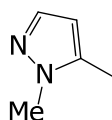
T-24a



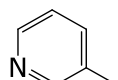
T-25



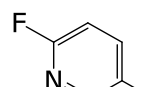
V-2a



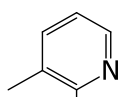
V-5a



V-6a

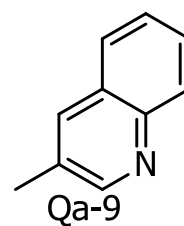
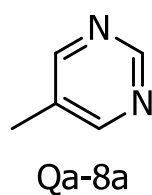
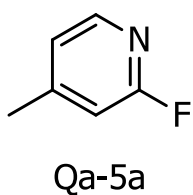
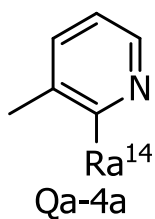
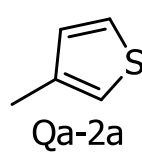
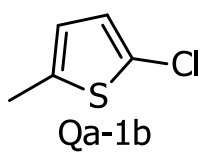
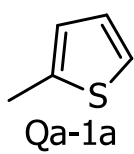
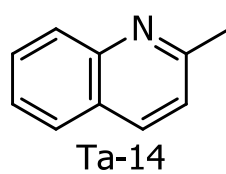
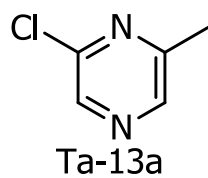
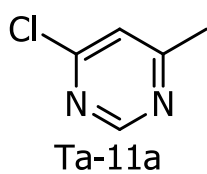
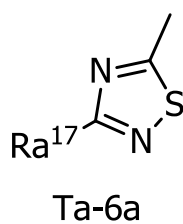
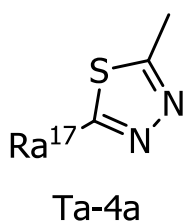
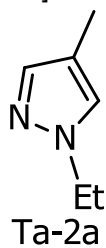


V-6b



Q-2a

[Xim. 40]

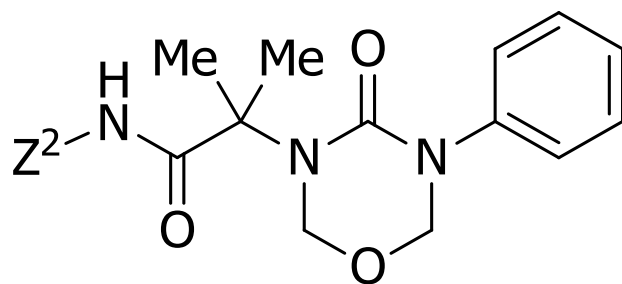


[0178]

[Таблица № 3]

[Xim. 41]

5



[Таблиця 8]

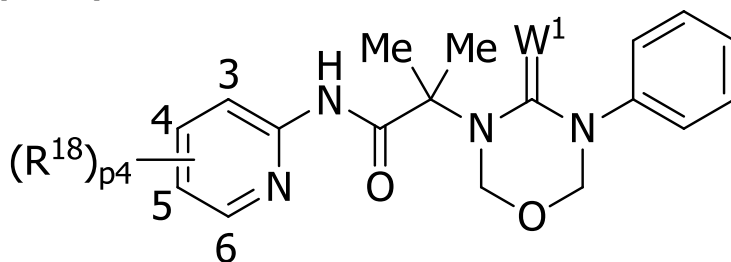
№	Z ²	R ¹⁸	R ¹⁹	т. п. (°C)
A-1-01	T-1a			211-212
A-1-02	T-1b			214-215
A-1-03	T-3a		Me	180-181
A-1-04	T-3a		CF ₂ H	200-201
A-1-05	T-4a	Me		147-158
A-1-06	T-4a	CF ₃		192-201
A-1-07	T-4b	Cl		185-206
A-1-08	T-4b	Me		215-222
A-1-09	T-4b	NO ₂		174-179
A-1-10	T-7a			198-211
A-1-11	T-10a			116-120
A-1-12	T-13a			92-95
A-1-13	T-13b	Me		215-220
A-1-14	T-13b	CF ₃		47-52
A-1-15	T-13b	SMe		237-240
A-1-16	T-14a	OMe		162-168
A-1-17	T-14a	SMe		210-213
A-1-18	T-15a			247-249
A-1-19	T-19a			222-225
A-1-20	T-20a			224-225
A-1-21	T-20b			263-265
A-1-22	T-22a			165-168
A-1-23	T-24a			219-221
A-1-24	T-25			175-180

[0179]

[Таблиця № 4]

[Хім. 42]

5



[Таблиця 9]

№	(R ¹⁸) _{p4}	W ¹	т. п. (°C)
A-2-01	H	0	185-187
A-2-02	3-F	0	180-184
A-2-03	4-F	0	168-171
A-2-04	5-F	0	156-158
A-2-05	6-F	0	164-168
A-2-06	4-Cl	0	182-184
A-2-07	6-Cl	0	157-158
A-2-08	4-Br	0	188-190
A-2-09	6-Br	0	140-141
A-2-10	4-I	0	189-194
A-2-11	6-I	0	147-149
A-2-12	3,5-diF	0	165-166
A-2-13	4,6-diF	0	164-166
A-2-14	4-F-6-Cl	0	186-187
A-2-15	4-Cl-6-F	0	127-128
A-2-16	3,6-diCl	0	* 1
A-2-17	4,6-diCl	0	183-186
A-2-18	4,6-diCl	S	187-189
A-2-19	4-Br-6-F	0	213-214
A-2-20	4-Me-6-F	0	145-146
A-2-21	4-Et-6-F	0	145-155
A-2-22	4-CF ₃ -6-F	0	214-216
A-2-23	4-OMe-6-F	0	150-155
A-2-24	4-Cl-6-Br	0	165-170
A-2-25	4-Cl-6-Me	0	206-207
A-2-26	4-Me-6-Cl	0	133-134
A-2-27	4-CF ₂ H-6-Cl	0	* 1
A-2-28	4-CF ₃ -6-Cl	0	195-199
A-2-29	4-Cl-6-c-Pr	0	* 1
A-2-30	4-c-Pr-6-Cl	0	137-138
A-2-31	4-Cl-6-Ph	0	136-137
A-2-32	4-Cl-6-OMe	0	110-111
A-2-33	4-OMe-6-Cl	0	116-117
A-2-34	4-OCF ₂ H-6-Cl	0	132-133
A-2-35	4-Cl-6-OPh	0	142-144
A-2-36	4-OPh-6-Cl	0	160-161
A-2-37	4-Me	0	103-105
A-2-38	6-Me	0	152-153
A-2-39	6-CH ₂ F	0	133-135
A-2-40	4-CF ₂ H	0	213-216
A-2-41	6-CF ₂ H	0	118-120
A-2-42	4-CF ₃	0	174-177
A-2-43	5-CF ₃	0	167-170
A-2-44	6-CF ₃	0	143-147
A-2-45	4-c-Pr	0	153-154
A-2-46	6-c-Pr	0	145-146

[Таблиця 10]

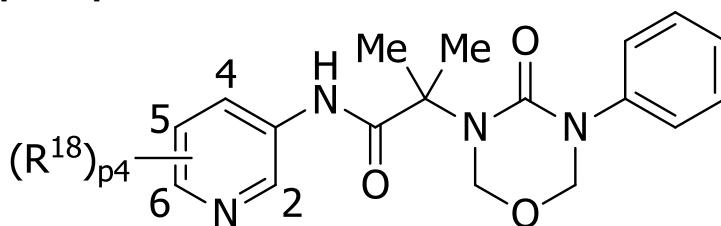
№	(R ¹⁸) _{p4}	W ¹	т. п. (°C)
A-2-47	4-CO ₂ Me	0	164-166
A-2-48	4-CN	0	* 1
A-2-49	4-Ph	0	187-188
A-2-50	6-Ph	0	120-122
A-2-51	4-OMe	0	178-184
A-2-52	6-OMe	0	134-135
A-2-53	4-OCF ₂ H	0	177-178
A-2-54	6-OCF ₂ H	0	61-63
A-2-55	4-OPh	0	178-179
A-2-56	4,6-diMe	0	178-182
A-2-57	4-Me-6-CF ₃	0	109-110
A-2-58	4-CF ₃ -6-Me	0	220-221
A-2-59	4-CF ₃ -6-OMe	0	118-120
A-2-60	4-CF ₃ -6-OEt	0	132-137

[0180]

[Таблиця № 5]

[Хім. 43]

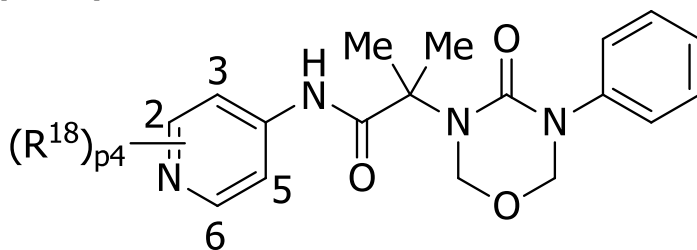
5



[Таблиця 11]

№	(R ¹⁸) _{p4}	т. п. (°C)
A-3-01	5-F	168-169
A-3-02	5-Cl	167-168
A-3-03	5-Br	174-175
A-3-04	2-F-5-Br	148-150
A-3-05	5,6-diCl	* 1
A-3-06	2,5-diCl	* 1
A-3-07	2-Cl-5-Br	* 1
A-3-08	2-Br-5-Cl	* 1
A-3-09	2-Cl-5-Me	50-56
A-3-10	5-CF ₃	179-180

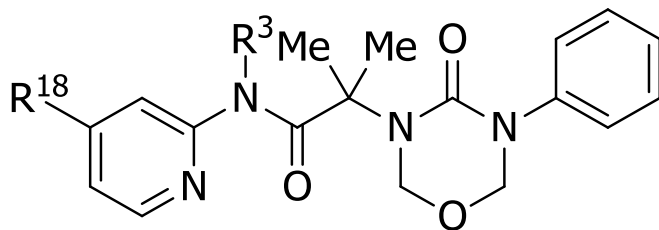
[0181]
[Таблиця № 6]
[Хім. 44]



5 [Таблиця 12]

№	(R ¹⁸) _{p4}	т. п. (°C)
A-4-01	2-F	241-243
A-4-02	2-Cl	247-248
A-4-03	2-Br	219-220
A-4-04	2, 6-diF	259-261
A-4-05	2, 6-diCl	262-264
A-4-06	2-CF ₃	218-222

[0182]
[Таблиця № 7]
[Хім. 45]

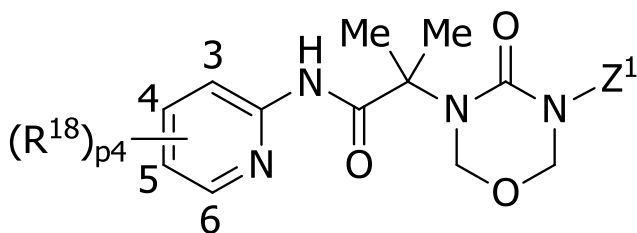


10

[Таблиця 13]

№	R ¹⁸	R ³	т. п. (°C)
A-5-01	V-2a	H	175-182
A-5-02	V-5a	H	* 1
A-5-03	V-6a	H	* 1
A-5-04	V-6b	H	* 1
A-5-05	CF ₃	n-Pr	163-164

[0183] [Таблиця № 8]
[Хім. 46]



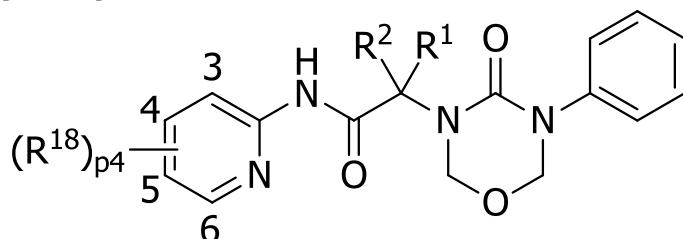
15

[Таблиця 14]

№	Z ¹	R ¹⁴	(R ¹⁸) _{p4}	т. п. (°C)
A-6-01	2,6-diF-Ph		4,6-diCl	202-204
A-6-02	2,6-diF-Ph		4-Cl-6-Br	205-208
A-6-03	3,4-diCl-Ph		4-CF ₃	185-186
A-6-04	3-Cl-4-Me-Ph		4-CF ₃	152-153
A-6-05	3-Cl-4-OMe-Ph		4-CF ₃	168-169
A-6-06	2-Cl-Ph		4,6-diCl	* 1
A-6-07	3-Me-Ph		4-CF ₃	146-147
A-6-08	3-Me-Ph		4,6-diCl	160-161
A-6-09	4-Me-Ph		4-CF ₃	201-203
A-6-10	4-Me-Ph		4,6-diF	139-140
A-6-11	4-Me-Ph		4-Cl-6-F	134-135
A-6-12	4-Me-Ph		4,6-diCl	175-178
A-6-13	Q-2a	Cl	4-CF ₃	156-157

[0184] [Таблиця № 9]

[Хім. 47]



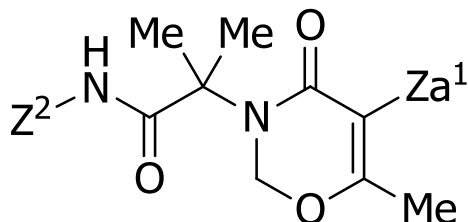
5

[Таблиця 15]

№	(R ¹⁸) _{p4}	R ¹	R ²	т. п. (°C)
A-7-01	4,6-diCl	Me	H	* 1
A-7-02	4-CF ₃	Me	H	* 1
A-7-03	4-CF ₃	i-Pr	H	79-84
A-7-04	4,6-diCl	-(CH ₂)-(CH ₂)-		114-115
A-7-05	4-CF ₃	-(CH ₂)-(CH ₂)-		* 1

[0185] [Таблиця № 10]

[Хім. 48]



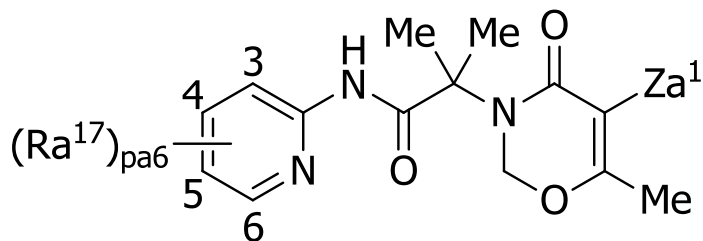
10

[Таблиця 16]

№	Za ¹	Z ²	Ra ¹⁴	Ra ¹⁷	т. п. (°C)
B-1-01	Qa-2a	Ta-6a		Me	203-205
B-1-02	Qa-2a	Ta-6a		Et	171-172
B-1-03	Qa-2a	Ta-6a		i-Pr	143-146
B-1-04	Qa-2a	Ta-6a		OMe	196-198
B-1-05	Qa-2a	Ta-6a		SMe	198-201
B-1-06	Qa-4a	Ta-6a	F	Cl	225-228
B-1-07	Qa-4a	Ta-11a	F		121-127
B-1-08	Qa-4a	Ta-13a	F		162-166
B-1-09	Ph	Ta-2a			138-141
B-1-10	Ph	Ta-4a		CF ₃	183-186
B-1-11	Ph	Ta-4a		Ph	206-207
B-1-12	Ph	Ta-6a		Cl	210-215
B-1-13	Ph	Ta-6a		Me	193-195
B-1-14	Ph	Ta-6a		Et	189-192
B-1-15	Ph	Ta-6a		OMe	209-211
B-1-16	Ph	Ta-6a		SMe	205-208
B-1-17	Ph	Ta-6a		Ph	195-198
B-1-18	Ph	Ta-14			134-139

[0186] [Таблиця № 11]

[Хім. 49]



[Таблиця 17]

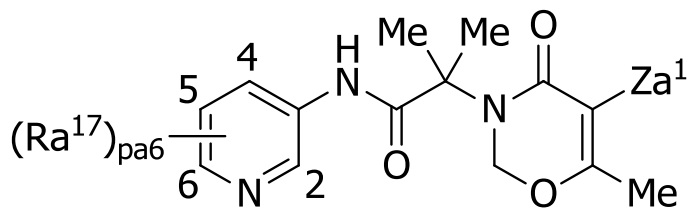
№	Za ¹	Ra ¹⁴	(Ra ¹⁷) _{раз}	т. п. (°C)
B-2-01	Qa-1a		6-Cl	84-86
B-2-02	Qa-1b		6-Cl	124-125
B-2-03	Qa-1b		6-Br	118-120
B-2-04	Qa-2a		6-F	169-171
B-2-05	Qa-2a		6-Cl	143-144
B-2-06	Qa-2a		6-Br	*1
B-2-07	Qa-4a	F	4-Cl	*1
B-2-08	Qa-4a	F	6-Cl	110-112
B-2-09	Qa-4a	F	4-Br	*1
B-2-10	Qa-4a	F	6-Br	100-105
B-2-11	Qa-4a	F	4, 6-diCl	186-187
B-2-12	Qa-4a	F	4-Cl-6-Br	155-156
B-2-13	Qa-4a	F	4-CF ₃ -6-F	168-171
B-2-14	Qa-4a	F	4-CF ₃ -6-OMe	*1
B-2-15	Qa-4a	F	4-Me-6-Cl	149-152
B-2-16	Qa-4a	F	4-CF ₃ -6-Cl	154-155
B-2-17	Qa-4a	F	4-CF ₃	130-131
B-2-19	Qa-4a	Cl	6-F	*1
B-2-20	Qa-4a	Cl	6-Cl	*1
B-2-21	Qa-5a		6-Cl	*1
B-2-22	Qa-8a		6-Cl	*1
B-2-23	Qa-9		6-Cl	*1
B-2-24	Ph		3-F	130-135
B-2-25	Ph		4-F	146-152
B-2-26	Ph		5-F	135-140
B-2-27	Ph		6-F	190-192
B-2-28	Ph		4-Cl	138-145
B-2-29	Ph		6-Cl	120-122
B-2-30	Ph		4-Br	140-150
B-2-31	Ph		6-Br	88-91
B-2-32	Ph		6-I	*1
B-2-33	Ph		4, 6-diF	200-201
B-2-34	Ph		4, 6-diCl	185-187
B-2-35	Ph		4-Br-6-F	184-186
B-2-36	Ph		4-Cl-6-Br	108-120
B-2-37	Ph		4-CF ₃ -6-Cl	159-162
B-2-38	Ph		4-Me-6-F	40-46
B-2-39	Ph		4-Et-6-F	120-130
B-2-40	Ph		4-CF ₃ -6-F	128-130
B-2-41	Ph		4-OMe-6-F	152-157
B-2-42	Ph		4-Cl-6-Me	186-188
B-2-43	Ph		4-Me-6-Cl	*1
B-2-44	Ph		4-CF ₂ H-6-Cl	100-102
B-2-45	Ph		4-Cl-6-Ph	*1

[Таблиця 18]

№	Za ¹	Ra ¹⁴	(Ra ¹⁷) _{раб}	т. п. (°C)
B-2-46	Ph		4-Cl-6-OMe	95-103
B-2-47	Ph		4-OMe-6-Cl	146-150
B-2-48	Ph		4-OPh-6-Cl	176-179
B-2-49	Ph		4-CF ₃ -6-OMe	155-158
B-2-50	Ph		4-CF ₃ -6-OEt	156-159
B-2-51	Ph		4-CF ₃ -6-Me	125-130
B-2-52	Ph		4-Me	100-130
B-2-53	Ph		6-Me	154-156
B-2-54	Ph		4-CF ₂ H	157-161
B-2-55	Ph		6-CF ₂ H	126-129
B-2-56	Ph		6-CH ₂ F	*1
B-2-57	Ph		4-CF ₃	170-172
B-2-58	Ph		6-CF ₃	*1
B-2-59	Ph		4-Ph	222-223
B-2-60	Ph		6-Ph	*1
B-2-61	Ph		4-CO ₂ Me	180-183
B-2-62	Ph		4-CN	176-180
B-2-63	Ph		4-OMe	120-129
B-2-64	Ph		4-OCF ₂ H	130-137

[0187] [Таблиця № 12]

[Хім. 50]



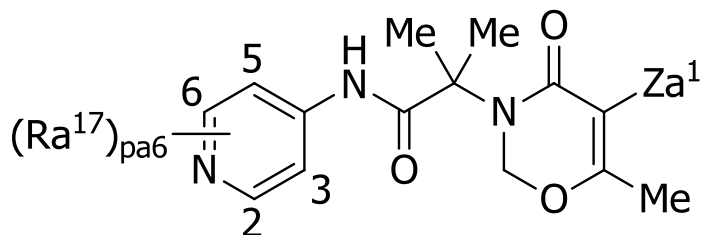
5

[Таблиця 19]

№	Za ¹	Ra ¹⁴	(Ra ¹⁷) _{раб}	т. п. (°C)
B-3-01	Ph		5-F	175-178
B-3-02	Ph		5-Cl	175-178
B-3-03	Ph		5-CF ₃	*1
B-3-04	Ph		2-Cl-5-Me	122-126
B-3-05	Qa-4a	F	5-CF ₃	*1

[0188] [Таблиця № 13]

[Хім. 51]



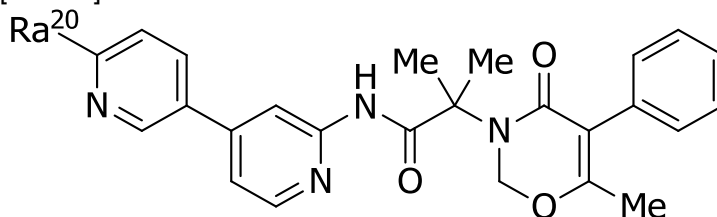
10

[Таблиця 20]

№	Za ¹	Ra ¹⁴	(Ra ¹⁷) _{раз}	т. п. (°C)
B-4-01	Qa-4a	F	2-CF ₃	*1
B-4-02	Ph		2-F	*1
B-4-03	Ph		2-Cl	*1
B-4-04	Ph		2,6-diF	190-196
B-4-05	Ph		2,6-diCl	204-206
B-4-06	Ph		2-CF ₃	*1

[0189] [Таблиця № 16]

[Хім. 52]



5

[Таблиця 21]

№	Ra ²⁰	т. п. (°C)
B-5-01	F	155-160

[0190] Дані ¹H-ЯМР сполук за даним винаходом, для яких не вказано будь-яке значення точки плавлення, наведені в таблиці № 15.

10

При цьому значення хімічного зсуву протонного ядерного магнітного резонансу вимірювали при 300 МГц в розчиннику на основі дейтерохлороформу із застосуванням в якості еталонної речовини Me₄Si (тетраметилсилан). Крім того, нижче наведені значення символів в таблиці № 15. s: синглет, brs: широкий синглет, d: дублет, t: триплет, m: мультиплет.

[0191] [Таблиця № 15]

15

Таблиця 22

№	¹ H-ЯМР (CDCl ₃ , Me ₄ Si, 300 МГц)
A-2-16	δ 8,88 (brs, 1H), 7,61 (d, 1H, J=9,0 Гц), 7,37-7,18 (m, 5H), 7,04 (d, 1H, J=9,0 Гц), 5,16 (s, 2H), 5,11 (s, 2H), 1,68 (s, 6H).
A-2-27	δ 8,49 (s, 1H), 8,35 (s, 1H), 7,37-7,15 (m, 6H), 6,52 (t, 1H, J=54 Гц), 5,18 (s, 2H), 5,10 (s, 2H), 1,59 (s, 6H).
A-2-29	δ 8,25 (brs, 1H), 8,06 (s, 1H), 7,35-7,16 (m, 5H), 6,82 (s, 1H), 5,17 (s, 2H), 5,11 (s, 2H), 1,94-1,85 (m, 1H), 1,63 (s, 6H), 1,13 (d, J=6,3 Гц, 2H), 0,94 (d, J=6,3 Гц, 2H).
A-2-48	δ 8,62 (brs, 1H), 8,56 (t, 1H, J=1,0 Гц), 8,36 (dd, 1H, J=5,1 Гц, 1,0 Гц), 7,35-7,16 (m, 6H), 5,16 (s, 2H), 5,11 (s, 2H), 1,63 (s, 6H).
A-3-05	δ 8,73 (brs, 1H), 8,37 (s, 1H), 8,24 (s, 1H), 7,39-7,20 (m, 5H), 5,17 (s, 2H), 5,08 (s, 2H), 1,65 (s, 6H).
A-3-06	δ 8,45 (d, 1H, J=2,7 Гц), 8,49 (br s, 1H), 8,02 (d, 1H, J=2,7 Гц), 7,37-7,20 (m, 5H), 5,19 (s, 2H), 5,14 (s, 2H), 1,66 (s, 6H).
A-3-07	δ 8,97 (d, 1H, J=1,8 Гц), 8,47 (br s, 1H), 8,11 (d, 1H, J=1,8 Гц), 7,37-7,20 (m, 5H), 5,18 (s, 2H), 5,13 (s, 2H), 1,65 (s, 6H).
A-3-08	δ 8,79 (s, 1H), 8,49 (brs, 1H), 8,0 (s, 1H), 7,37-7,19 (m, 5H), 5,19 (s, 2H), 5,13 (s, 2H), 1,65 (s, 6H).
A-5-02	δ 8,80 (brs, 1H), 8,45 (s, 1H), 8,29 (d, 1H, J=1,8 Гц), 7,57 (d, 1H, J=1,8 Гц), 7,34-7,15 (m, 5H), 7,07 (dd, 1H, J=5,4 Гц, 1,5 Гц), 6,44 (d, 1H, J=1,8 Гц), 5,19 (s, 2H), 5,14 (s, 2H), 4,00 (s, 3H), 1,65 (s, 6H).

Таблица 22 (продовження)

№	¹ H-ЯМР (CDCl ₃ , Me ₄ Si, 300 МГц)
A-5-03	δ 9,26 (brs, 1H), 8,89 (d, 1H, J=1,5 Гц), 8,66 (d, 1H, J=1,8 Гц), 8,64 (d, 1H, J=1,8 Гц), 8,26 (d, 1H, J=5,1 Гц), 7,97 (dt, 1H, J=8,1 Гц, 1,8 Гц), 7,39-7,13 (m, 7H), 5,18 (s, 2H), 5,16 (s, 2H), 1,63 (s, 6H).
A-5-04	δ 9,62 (brs, 1H), 8,64 (s, 1H), 8,45 (d, 1H, J=2,7 Гц), 8,25 (d, 1H, J=5,4 Гц), 8,07 (dt, 1H, J=7,5 Гц, 2,7 Гц), 7,35-7,10 (m, 6H), 7,01 (dd, 1H, J=8,5 Гц, 3,1 Гц), 5,19 (s, 2H), 5,17 (s, 2H), 1,63 (s, 6H).
A-6-06	δ 8,45 (brs, 1H), 8,27 (s, 1H), 7,46-7,40 (m, 1H), 7,34-7,21 (m, 3H), 7,02 (s, 1H), 5,11 (s, 2H), 5,04 (brs, 2H), 1,60 (s, 6H).
A-7-01	δ 9,07 (brs, 1H), 8,19 (s, 1H), 7,45-7,26 (m, 5H), 7,08 (s, 1H), 5,16 (s, 2H), 5,13-4,99 (m, 3H), 1,50 (d, 3H, J=7,5 Гц).
A-7-02	δ 9,33 (brs, 1H), 8,49-8,40 (m, 2H), 7,40-7,32 (m, 2H), 7,31-7,21 (m, 4H), 5,20-5,11 (m, 3H), 5,05 (s, 2H), 1,52 (d, 3H, J=7,2 Гц).
A-7-05	δ 9,41 (brs, 1H), 8,49-8,40 (m, 2H), 7,43-7,36 (m, 2H), 7,32-7,22 (m, 4H), 5,17 (s, 2H), 5,03 (s, 2H), 1,81-1,69 (m, 2H), 1,43-1,28 (m, 2H).
B-2-06	δ 8,27 (brs, 1H), 8,24 (d, 1H, J=8,1 Гц), 7,51 (t, 1H, J=8,1 Гц), 7,28-7,23 (m, 2H), 7,16 (d, 1H, J=6,6 Гц), 7,05 (dd, 1H, J=4,8 Гц, 1,5 Гц), 5,26 (s, 2H), 2,05 (s, 3H), 1,60 (s, 6H).
B-2-07	δ 8,39-8,34 (m, 2H), 8,19-8,12 (m, 2H), 7,88-7,82 (m, 1H), 7,20-7,15 (m, 1H), 7,07-7,00 (m, 1H), 5,35 (s, 2H), 1,96 (s, 3H), 1,64 (s, 6H).
B-2-09	δ 8,52 (s, 1H), 8,36 (brs, 1H), 8,17-8,12 (m, 1H), 8,08-8,06 (m, 1H), 7,90-7,86 (m, 1H), 7,20-7,12 (m, 2H), 5,34 (s, 2H), 1,96 (s, 3H), 1,64 (s, 6H).
B-2-14	δ 8,23 (brs, 1H), 8,16-8,13 (m, 1H), 8,04 (s, 1H), 7,87-7,81 (m, 1H), 7,20-7,15 (m, 1H), 6,66 (s, 1H), 5,38 (s, 2H), 3,88 (s, 3H), 1,97 (s, 3H), 1,68 (s, 6H).

Таблица 23

№	¹ H-ЯМР (CDCl ₃ , Me ₄ Si, 300 МГц)
B-2-19	δ 8,32 (d, 1H, J =3,6 Гц), 8,28 (brs, 1H), 8,08 (d, 1H, J=8,1 Гц), 7,75-7,71 (m, 1H), 7,64 (d, 1H, J=8,1 Гц), 7,24-7,20 (m, 1H), 6,60 (dd, 1H, J=8,4 Гц, 2,4 Гц), 5,40-5,30 (m, 2H), 1,92 (s, 3H), 1,61 (s, 6H).
B-2-20	δ 8,32 (dd, 1H, J=4,8 Гц, 2,1 Гц), 8,27 (brs, 1H), 8,17 (d, 1H, J=8,1 Гц), 7,66-7,59 (m, 2H), 7,24-7,20 (m, 1H), 7,02 (d, 1H, J =7,5 Гц), 5,38-5,31 (m, 2H), 1,93 (s, 3H), 1,61 (s, 6H).
B-2-21	δ 8,20-8,15 (m, 3H), 7,64 (t, 1H, J=8,1 Гц), 7,12-6,99 (m, 2H), 6,90 (s, 1H), 5,32 (s, 2H), 2,29 (s, 3H), 1,63 (s, 6H).
B-2-22	δ 9,11 (s, 1H), 8,66 (s, 2H), 8,23 (brs, 1H), 8,19 (d, 1H, J=8,4 Гц), 7,65 (dd, 1H, J =8,4 Гц, 4,5 Гц), 7,05 (d, 1H, J=4,5 Гц), 5,36 (s, 2H), 2,04 (s, 3H), 1,64 (s, 6H).
B-2-23	δ 8,71 (s, 1H), 8,29-8,20 (m, 3H), 8,05 (d, 1H, J=8,4 Гц), 7,80 (d, 1H, J=8,1 Гц), 7,72-7,63 (m, 2H), 7,51 (t, 1H, J=7,7 Гц), 7,04 (d, 1H, J=7,7 Гц), 5,38 (s, 2H), 2,04 (s, 3H), 1,65 (s, 6H).
B-2-32	δ 8,27 (brs, 1H), 8,22 (d, 1H, J=10,7 Гц), 7,44-7,28 (m, 7H), 5,29 (s, 2H), 1,96 (s, 3H), 1,61 (s, 6H).
B-2-43	δ 8,22 (brs, 1H), 8,06 (s, 1H), 7,47-7,25 (m, 5H), 6,86 (s, 1H), 5,28 (s, 2H), 2,31 (s, 3H), 1,96 (s, 3H), 1,60 (s, 6H).
B-2-45	δ 8,42 (brs, 1H), 8,29 (s, 1H), 7,91-7,87 (m, 2H), 7,49-7,40 (m, 4H), 7,27-7,36 (m, 5H), 5,34 (s, 2H), 1,97 (s, 3H), 1,62 (s, 6H).
B-2-56	δ 8,28 (brs, 1H), 8,19 (d, 1H, J=8,4 Гц), 7,71 (t, 1H, J=7,8 Гц), 7,50-7,43 (m, 1H), 7,33-7,21 (m, 2H), 7,12 (d, 1H, J =7,5 Гц), 6,90-6,76 (m, 2H), 5,40-5,20 (m, 4H), 1,96 (s, 3H), 1,65 (s, 6H).
B-2-58	δ 8,46 (d, 1H, J=8,2 Гц), 8,38 (brs, 1H), 7,81 (m, 1H), 7,40-7,20 (m, 6H), 5,32 (s, 2H), 1,96 (s, 3H), 1,64 (s, 6H).
B-2-60	δ 8,38 (brs, 1H), 8,17 (d, 1H, J=7,7 Гц), 7,90 (d, 2H, J=7,7 Гц), 7,72 (t, 1H, J=7,7 Гц), 7,50-7,40 (m, 7H), 7,30-7,26 (m, 2H), 5,35 (s, 2H), 1,97 (s, 3H), 1,68 (s, 6H).
B-3-03	δ 8,91 (brs, 1H), 8,69 (s, 1H), 8,56 (s, 1H), 8,48 (s, 1H), 7,38-7,26 (m, 5H), 5,32 (s, 2H), 1,97 (s, 3H), 1,72 (s, 6H).

Таблиця 23 (продовження)

№	¹ H-ЯМР (CDCl ₃ , Me ₄ Si, 300 МГц)
B-3-05	δ 8,71 (s, 2H), 8,59 (s, 1H), 8,49 (s, 1H), 8,21-8,18 (m, 1H), 7,88-7,81 (m, 1H), 7,23-7,19 (m, 1H), 5,37 (s, 2H), 1,97 (s, 3H), 1,71 (s, 6H).
B-4-01	δ 8,92 (brs, 1H), 8,54-8,51 (m, 1H), 8,20-8,17 (m, 1H), 7,89 (s, 1H), 7,87-7,79 (m, 1H), 7,65-7,60 (m, 1H), 7,24-7,20 (m, 1H), 5,36 (s, 2H), 1,97 (s, 3H), 1,69 (s, 6H).
B-4-02	δ 9,06 (brs, 1H), 8,03 (d, 1H, J=6,0 Гц), 7,39-7,15 (m, 7H), 5,30 (s, 2H), 1,97 (s, 3H), 1,67 (s, 6H).
B-4-03	δ 8,97 (brs, 1H), 8,17 (d, 1H, J=5,7 Гц), 7,57 (d, 1H, J=1,8 Гц), 7,38-7,21 (m, 6H), 5,29 (s, 2H), 1,95 (s, 3H), 1,67 (s, 6H).
B-4-06	δ 9,18 (brs, 1H), 8,54 (d, 1H, J=5,3 Гц), 7,88 (s, 1H), 7,64-7,60 (m, 1H), 7,40-7,20 (m, 5H), 5,31 (s, 2H), 1,97 (s, 3H), 1,71 (s, 6H).

[0192] Тестові приклади

- Далі нижче в наступних тестових прикладах конкретно ілюструється застосовність сполук за даним винаходом в якості гербіцидів, однак даний винахід не обмежується лише ними.

Тестовий приклад 1

Тест ефективності боротьби з бур'янами щодо досходової обробки бур'янів в затопленому стані

- Алювіальний ґрунт вводили в горщики Вагнера 1/10000 ар і створювали умови з глибиною занурення 4 см за допомогою додавання води й змішування. Насіння курячого проса, очерету і рдеста овальнолистого змішували й висівали у вищезазначені чашки, а потім розсаду на стадії 2,5 листка пересаджували. У день посіву емульсії сполук за даним винаходом, одержані відповідно до прикладу складання 2, розводили водою для одержання зазначених доз і наносили на водну поверхню. Рослини вирощували після розміщення чашок в теплиці при 25-30°C. Через 3 тижні після обробки пестицидом досліджували ефект щодо кожного виду рослин на підставі наступних оціночних критеріїв. Результати показані в таблиці № 16.

Оціночні критерії

- 5 ... частка знищених бур'янів 90% або більше, (практично повне в'янення)
 4 ... частка знищених бур'янів 70% або більше, менше ніж 90%
 3 ... частка знищених бур'янів 40% або більше, менше ніж 70%
 2 ... частка знищених бур'янів 20% або більше, менше ніж 40%
 1 ... частка знищених бур'янів 5% або більше, менше ніж 20%
 0 ... частка знищених бур'янів 5% або більше, (практично жодного ефекту)

[0193] Тестовий приклад 2

- Тест ефективності боротьби з бур'янами щодо досходової обробки бур'янів в затопленому стані

- Алювіальний ґрунт вводили в горщики Вагнера 1/10000 ар і створювали умови з глибиною занурення 4 см за допомогою додавання води й змішування. Насіння курячого проса, очерету й рдеста овальнолистого змішували й висівали у вищезазначені чашки й рослини вирощували за допомогою розміщення в теплиці при 25-30°C. Коли куряче просо, очерет і рдест овальнолистий досягали стадії 1-2 листків, емульсії сполук за даним винаходом, одержані згідно з прикладом складання 2, розводили водою для одержання зазначених доз і наносили на водну поверхню. Через 3 тижні після обробки пестицидом досліджували ефект щодо кожного виду рослин на підставі оціночних критеріїв тестового прикладу 1. Результати показані в таблиці № 17.

[0194] Тестовий приклад 3

Тест ефективності боротьби з бур'янами шляхом обробки ґрунту

- Стерилізований ділювіальний ґрунт вводили в пластикові коробки довжиною 21 см, шириною 13 см, глибиною 7 см і кожен насінину росички, щетинника зеленого, курячого проса, вівсюга, лисохвоста польового, райграсу багатоквіткового, мітлиці звичайної, канатника Теофраста, щириці звичайної, лободи фіголистої, зірочника середнього, підмаренника, вероніки, кукурудзи, сої, рису, пшениці, буряка й ріпака висівали площадками й покривали приблизно 1,5 см ґрунту. Далі емульсії сполук за даним винаходом, одержані згідно з прикладом складання 2, розводили водою для одержання зазначених доз і наносили рівномірно на поверхню ґрунту за допомогою невеликого обприскувача. Рослини вирощували за допомогою розміщення пластикових коробок в теплиці при 25-30°C і через 3 тижні після обробки

пестицидом досліджували ефект щодо кожного виду рослин на підставі оціночних критеріїв тестового прикладу 1. Результати показані в таблиці № 18.

[0195] Тестовий приклад 4

Тестування ефективності знищення бур'янів за допомогою позакореневої обробки

- 5 Стерилізований ділювіальний ґрунт вводили в пластикові коробки довжиною 21 см, шириною 13 см, глибиною 7 см і кожну насінину росички, щетинника зеленого, курячого проса, вівсюга, лисохвоста польового, райграсу багатоквіткового, мітлиці звичайної, канатника Теофраста, щириці звичайної, лободи фіголистої, зірочника середнього, підмаренника, вероники, кукурудзи, сої, рису, пшениці, буряка й ріпака висівали площадками й покривали
- 10 приблизно 1,5 см ґрунту, потім рослини вирощували в теплиці при 25-30°C. Після того, як вони росли протягом 14 днів, емульсії сполук за даним винаходом, одержані згідно з прикладом складання 2, розводили водою для одержання зазначених доз і рівномірно наносили на стеблові і листкові частини за допомогою невеликого обприскувача. Через 3 тижні після обробки пестицидом досліджували ефект щодо кожного виду рослин на підставі оціночних критеріїв
- 15 тестового прикладу 1. Результати показані в таблиці № 19.

[0196] При цьому значення символів наведені нижче в таблицях №№ 16-19.

- 20 А:просо куряче, В:очерет, С:рдест овальнолистий, D:росичка, Е:щетинник зелений, F:просо куряче, G:вівсюг, Н:лисохвіст польовий, I:райграс багатоквітковий, J:мітлиця звичайна, К:канатник Теофраста, L:щириця звичайна, М:лобода фіголиста, N:зірочник середній, О:підмаренник, р:вероніка, а:розсадний рис, b:безпосередньо висіяний рис, с:кукурудза, d:соє, е:пшениця, f:буряк, g:ріпак

Крім того, доза пестициду (г/га) вказує на концентрацію, регульовану таким чином, щоб обробка була лише зі вказаною кількістю грамів (г) при розрахунку на один гектар (га).

[0197] [Таблиця № 16]
[Таблиця 24]

№	Дозування обробки, (г/га)	А	В	С	а
А- 1-03	320	0	5	2	0
А- 1-04	320	5	5	4	0
А- 1-05	252	5	5	5	0
А- 1-07	252	5	5	5	0
А- 1-08	252	5	5	5	0
А- 1-09	320	5	5	4	0
А- 1-10	252	3	5	3	0
А- 1-12	320	5	5	4	0
А- 1-13	320	5	5	5	3
А- 1-14	320	4	5	3	1
А- 1-15	320	4	5	5	0
А- 1-17	320	2	5	3	0
А- 1-18	320	5	5	5	2
А- 1-19	252	2	3	2	0
А- 1-24	320	5	5	5	0
А- 2-01	252	5	5	4	0
А- 2-03	252	5	5	5	1
А- 2-04	320	4	5	4	0
А- 2-05	252	5	5	5	3
А- 2-06	252	5	5	5	4
А- 2-07	252	5	5	5	4
А- 2-09	252	5	5	5	0
А- 2-10	320	5	5	5	1
А- 2-11	252	5	5	5	0
А- 2-13	252	5	5	5	3
А- 2-14	320	5	5	5	3
А- 2-15	280	5	5	5	4
А- 2-16	252	0	5	2	0
А- 2-17	252	5	5	5	3
А- 2-18	320	5	5	5	0
А- 2-19	320	5	5	5	3
А- 2-20	320	5	5	5	3
А- 2-21	320	5	5	5	5
А- 2-22	320	5	5	5	5
А- 2-23	320	5	5	5	3
А- 2-24	252	5	5	5	0
А- 2-25	320	5	5	5	3
А- 2-26	320	5	5	5	4
А- 2-28	252	5	5	5	2
А- 2-30	320	5	5	5	1
А- 2-31	320	5	5	5	0
А- 2-32	320	5	5	5	4
А- 2-33	315	5	5	5	4
А- 2-34	320	5	5	5	3
А- 2-35	320	5	5	5	1
А- 2-36	320	5	5	5	2
А- 2-37	252	5	5	5	0
А- 2-38	252	5	5	4	0
А- 2-39	315	5	5	5	1
А- 2-40	320	5	5	5	1

[Таблиця 25]

A- 2-41	315	5	5	5	0
A- 2-42	252	5	5	5	4
A- 2-43	320	3	5	5	0
A- 2-44	252	5	5	4	0
A- 2-45	252	5	5	5	0
A- 2-46	252	5	4	3	1
A- 2-47	320	2	4	0	0
A- 2-48	252	5	5	5	0
A- 2-49	252	5	5	5	1
A- 2-50	252	5	5	5	0
A- 2-51	252	4	5	2	0
A- 2-52	252	5	5	5	1
A- 2-53	320	5	5	5	1
A- 2-54	320	5	5	4	1
A- 2-55	234	5	5	5	0
A- 2-56	252	5	5	5	0
A- 2-57	320	5	5	5	0
A- 2-58	320	5	5	5	1
A- 2-59	320	5	5	5	1
A- 2-60	320	5	5	5	2
A- 3-01	252	5	5	4	1
A- 3-02	252	5	5	5	2
A- 3-03	252	5	5	5	0
A- 3-04	252	5	5	5	3
A- 3-05	320	3	5	5	0
A- 3-06	252	5	5	4	1
A- 3-07	252	5	5	4	0
A- 3-08	252	5	5	4	0
A- 3-09	252	2	4	0	1
A- 3-10	252	5	5	5	1
A- 4-02	252	5	5	5	1
A- 4-03	252	5	5	5	1
A- 4-04	320	5	5	5	0
A- 4-06	252	5	5	5	0
A- 5-01	320	4	5	5	0
A- 5-04	320	3	5	0	0
A- 6-01	252	5	5	5	3
A- 6-02	252	5	5	5	0
A- 6-03	320	3	5	0	0
A- 6-04	320	4	4	2	0
A- 6-05	320	2	2	2	0
A- 6-06	252	5	5	5	2
A- 6-07	320	5	5	5	1
A- 6-08	320	5	5	5	0
A- 6-09	320	4	5	4	0
A- 6-10	320	5	5	5	1
A- 6-11	320	5	5	5	0
A- 6-12	320	5	5	5	2
A- 6-13	320	5	5	5	0
A- 7-01	1000	5	5	4	0
A- 7-04	1000	0	5	0	0

[Таблиця 26]

№	Дозування обробки, (г/га)	A	B	C	a
B- 1-01	252	5	5	5	4
B- 1-02	252	5	5	5	0
B- 1-03	252	5	5	5	3
B- 1-04	252	5	5	5	0
B- 1-05	252	5	5	5	4
B- 1-06	252	5	5	5	0
B- 1-07	252	4	5	4	1
B- 1-08	252	5	5	5	0
B- 1-09	252	2	5	4	0
B- 1-10	252	5	5	5	3
B- 1-11	252	4	5	5	0
B- 1-12	252	5	5	5	0
B- 1-13	252	5	5	5	0
B- 1-14	252	5	5	5	1
B- 1-15	252	5	5	5	0
B- 1-16	252	5	5	5	2
B- 1-17	252	5	5	5	0
B- 1-18	320	5	5	5	0
B- 2-01	252	5	5	5	2
B- 2-02	252	5	5	5	0
B- 2-03	252	5	5	5	0
B- 2-04	252	5	5	5	3
B- 2-05	252	5	5	5	0
B- 2-06	252	5	5	5	4
B- 2-07	252	5	5	5	0
B- 2-08	252	5	5	5	0
B- 2-09	252	5	5	5	1
B- 2-10	320	5	5	5	1
B- 2-12	320	5	5	5	5
B- 2-13	320	5	5	5	1
B- 2-14	320	5	5	4	3
B- 2-15	320	5	5	5	3
B- 2-16	320	5	5	5	4
B- 2-17	252	5	5	5	3
B- 2-19	1000	5	5	4	0
B- 2-20	1000	5	5	4	0
B- 2-21	252	0	5	3	0
B- 2-22	1000	3	3	1	0
B- 2-24	320	2	5	3	0
B- 2-25	252	5	5	5	2
B- 2-26	320	5	5	5	0
B- 2-27	252	5	5	5	0
B- 2-29	252	5	5	5	0
B- 2-30	252	5	5	5	1
B- 2-31	252	5	5	5	0
B- 2-32	252	5	5	5	0
B- 2-33	252	5	5	5	3
B- 2-34	252	5	5	5	0
B- 2-35	320	5	5	5	0
B- 2-36	252	5	5	5	0

[Таблиця 27]

В- 2-37	252	5	5	5	2
В- 2-38	320	5	5	5	3
В- 2-39	320	5	5	5	1
В- 2-40	320	5	5	5	3
В- 2-41	320	5	5	5	3
В- 2-42	320	5	5	5	4
В- 2-43	320	5	5	5	3
В- 2-44	320	5	5	5	5
В- 2-45	320	5	5	4	2
В- 2-46	320	5	5	5	0
В- 2-47	320	5	5	5	1
В- 2-48	266	5	5	4	0
В- 2-49	320	5	5	5	3
В- 2-50	320	5	5	5	0
В- 2-51	320	5	5	5	0
В- 2-53	108.36	5	5	5	0
В- 2-54	320	5	5	5	5
В- 2-55	315	5	5	5	3
В- 2-56	320	5	5	5	1
В- 2-57	252	5	5	5	4
В- 2-58	252	5	5	5	0
В- 2-59	252	2	4	2	0
В- 2-60	252	5	5	5	0
В- 2-61	320	0	0	4	0
В- 2-62	320	5	5	5	1
В- 2-63	252	5	5	4	0
В- 2-64	320	5	5	5	4
В- 3-01	252	5	5	5	0
В- 3-02	252	5	5	5	3
В- 3-03	252	5	5	5	0
В- 3-04	252	5	5	4	0
В- 3-05	252	5	5	4	0
В- 4-01	252	5	5	5	0
В- 4-02	252	5	5	5	3
В- 4-03	252	5	5	5	4
В- 4-04	320	5	5	5	0
В- 4-05	252	5	5	5	0
В- 4-06	252	5	5	5	0
В- 5-01	320	4	5	4	0

[0198] [Таблиця № 17]
[Таблиця 28]

№	Дозування обробки, (г/га)	А	В	С
А- 1-03	320	0	2	0
А- 1-04	320	3	4	4
А- 1-05	252	3	5	3
А- 1-07	252	5	5	5
А- 1-08	252	4	5	3
А- 1-09	320	4	5	5
А- 1-10	252	0	5	0
А- 1-12	320	1	5	3
А- 1-13	320	3	5	3
А- 1-14	320	2	5	2
А- 1-15	320	3	5	5
А- 1-17	320	0	4	2
А- 1-18	320	3	5	5
А- 1-19	252	3	2	2
А- 1-24	320	4	5	5
А- 2-01	252	3	5	2
А- 2-03	252	5	5	3
А- 2-04	320	5	5	4
А- 2-05	252	4	5	4
А- 2-06	252	5	5	5
А- 2-07	252	4	5	5
А- 2-09	252	5	5	5
А- 2-10	320	5	5	5
А- 2-11	252	4	5	3
А- 2-13	252	5	5	5
А- 2-14	320	5	5	5
А- 2-15	280	5	5	5
А- 2-17	252	5	5	5
А- 2-18	320	5	5	5
А- 2-19	320	5	5	5
А- 2-20	320	5	5	5
А- 2-21	320	5	5	5
А- 2-22	320	5	5	5
А- 2-23	320	5	5	5
А- 2-24	252	5	5	5
А- 2-25	320	5	5	5
А- 2-26	320	5	5	5
А- 2-28	252	5	5	5
А- 2-30	320	5	5	5
А- 2-31	320	5	5	4
А- 2-32	320	5	5	5
А- 2-33	315	5	5	5
А- 2-34	320	5	5	5
А- 2-35	320	4	4	4
А- 2-36	320	5	3	5
А- 2-37	252	5	5	3
А- 2-38	252	3	5	3
А- 2-39	315	4	5	4
А- 2-40	320	5	5	5
А- 2-41	315	5	5	5

[Таблиця 29]

A- 2-42	252	5	5	5
A- 2-43	320	2	4	2
A- 2-44	252	3	5	1
A- 2-45	252	4	4	3
A- 2-46	252	4	2	0
A- 2-48	252	4	5	5
A- 2-49	252	4	4	4
A- 2-50	252	4	4	3
A- 2-52	252	4	5	2
A- 2-53	320	5	5	5
A- 2-54	320	3	4	3
A- 2-55	234	0	2	5
A- 2-56	252	4	5	3
A- 2-57	320	5	5	5
A- 2-58	320	5	5	5
A- 2-60	320	5	5	5
A- 3-01	252	1	5	2
A- 3-02	252	2	5	3
A- 3-03	252	3	5	4
A- 3-04	252	5	5	3
A- 3-05	320	4	5	5
A- 3-06	252	3	4	2
A- 3-07	252	4	5	1
A- 3-08	252	2	3	2
A- 3-10	252	3	5	4
A- 4-02	252	2	5	4
A- 4-03	252	2	5	4
A- 4-04	320	3	5	4
A- 4-06	252	4	5	4
A- 5-01	320	4	4	4
A- 5-04	320	0	2	0
A- 6-01	252	5	5	5
A- 6-02	252	5	5	5
A- 6-03	320	0	2	0
A- 6-04	320	1	2	0
A- 6-06	252	5	5	5
A- 6-07	320	4	5	3
A- 6-08	320	5	5	4
A- 6-09	320	3	3	
A- 6-10	320	4	5	5
A- 6-11	320	4	5	5
A- 6-12	320	4	5	5
A- 6-13	320	2	4	4
A- 7-01	1000	3	5	1
A- 7-04	1000	0	1	0

[Таблиця 30]

№	Дозування обробки, (г/га)	A	B	C
B- 1-01	252	5	5	5
B- 1-02	252	4	5	5
B- 1-03	252	5	5	5
B- 1-04	252	5	5	5
B- 1-05	252	5	5	5
B- 1-06	252	4	5	2
B- 1-07	252	0	3	0
B- 1-08	252	4	5	4
B- 1-09	252	1	4	2
B- 1-10	252	4	5	5
B- 1-11	252	1	4	3
B- 1-12	252	5	5	5
B- 1-13	252	5	5	5
B- 1-14	252	5	5	5
B- 1-15	252	4	5	5
B- 1-16	252	5	5	5
B- 1-17	252	5	5	4
B- 1-18	320	4		5
B- 2-01	252	5	5	5
B- 2-02	252	5	5	5
B- 2-03	252	5	5	4
B- 2-04	252	5	5	5
B- 2-05	252	5	5	5
B- 2-06	252	5	5	5
B- 2-07	252	3	5	2
B- 2-08	252	5	5	5
B- 2-09	252	4	5	3
B- 2-10	320	5	5	5
B- 2-12	320	5	5	5
B- 2-13	320	5	5	5
B- 2-14	320	4	4	4
B- 2-15	320	4	5	5
B- 2-16	320	5	5	5
B- 2-17	252	4	5	3
B- 2-19	1000	2	5	3
B- 2-20	1000	1	5	3
B- 2-24	320	1	4	3
B- 2-25	252	5	5	5
B- 2-26	320	5	5	5
B- 2-27	252	4	5	5
B- 2-29	252	5	5	5
B- 2-30	252	5	5	3
B- 2-31	252	5	5	0
B- 2-32	252	4	5	4
B- 2-33	252	5	5	5
B- 2-34	252	5	5	5
B- 2-35	320	5	5	5
B- 2-36	252	5	5	5
B- 2-37	252	5	5	5
B- 2-38	320	5	5	5

[Таблиця 31]

В- 2-39	320	5	5	5
В- 2-40	320	5	5	5
В- 2-41	320	5	5	5
В- 2-42	320	5	5	5
В- 2-43	320	5	5	5
В- 2-44	320	5	5	5
В- 2-45	320	4	2	4
В- 2-46	320	5	5	5
В- 2-47	320	5	5	5
В- 2-48	266	0	2	0
В- 2-49	320	5	5	5
В- 2-50	320	5	4	4
В- 2-51	320	5	5	5
В- 2-53	108.36	3	5	4
В- 2-54	320	5	5	5
В- 2-55	315	5	5	5
В- 2-56	320	5	5	5
В- 2-57	252	5	5	5
В- 2-58	252	3	5	4
В- 2-59	252	0	1	0
В- 2-60	252	4	3	3
В- 2-61	320	0	2	2
В- 2-62	320	4	3	5
В- 2-63	252	3	4	3
В- 2-64	320	5	5	5
В- 3-01	252	3	5	4
В- 3-02	252	4	5	5
В- 3-03	252	5	5	5
В- 3-04	252	4	4	3
В- 3-05	252	3	5	2
В- 4-01	252	2	3	2
В- 4-02	252	3	5	4
В- 4-03	252	4	5	4
В- 4-04	320	5	5	5
В- 4-05	252	4	5	
В- 4-06	252	4	5	5
В- 5-01	320	3	3	4

[0199] [Таблиця № 18]
[Таблиця 32]

№	Дозування обробки, (г/га)	D	E	F	G	H	I	J	K	L	M	N	O	P	b	c	d	e	f	g
A-1-04	320	3	3	2	2	4	5	5	0	0	3	4	2	3	0	0	2	0	3	4
A-1-05	315	5	5		4	5	5		4	5	3	4		5	5	1	0	0	3	
A-1-06	80					5	5	5										1		4
A-1-07	315	5	5		5	5	5		4	5	1	4		5	5	3	1	2	5	
A-1-08	315	5	5		3	5	4		1	4	2	2			4	1	0	0	0	
A-1-10	315	4	4		0	2	4		3	4	4	0			0	0	0	0	4	
A-1-12	320		5	3	3	5	5	5	0	0	4	3	0	3	5	0	4	0	2	0
A-1-13	320	3	3	3	3	5	5	5	0	0	3	3	0	4	3	0	0	1	1	1
A-1-15	320	0	0	0	0	1	4	5	0	0	0	0	0	3	0	0	0	0	0	1
A-1-18	320	5	5	4	4	5	5	5	0	4	4	2	0	4	5	0	4	0	1	4
A-1-20	80					5	5	5										1		1
A-1-21	80					4	4	5										0		0
A-1-24	320	3	3	2	0	1	3	4	0	0		0		4	0	0	0	0	0	0
A-2-01	315	4	4		2	5	5		0	3	4	3		5	3	0	2	0	0	
A-2-03	315	5	5		5	5	5		0	4	4	4	5	5	5	3	0	2	0	
A-2-04	320	3	3	3	0	2	3	4	0	0	0	2	0	0	0	0	0	0	0	0
A-2-05	315	5	5		5	5	5		3	5	4	4		5	5	4	4	4	5	
A-2-06	315	5	5		5	5	5		4	5	4	4		5	5	3	3	1	4	
A-2-07	315	5	5		5	5	5		0	5	4	4				4	4	3	5	
A-2-08	80					5	5	5										0		0
A-2-09	315	5	5		5	5	5		3	5	4	4		5	5	3	3	1	4	
A-2-10	320	5	5	5	3	5	5	5	0	1	4	3		4	4	0	0	0	3	3
A-2-11	315	5	5		2	5	5		0	0	3	4	2	4	3	0	0	1	2	
A-2-13	315	5	5	5	5	5	5	5	5	5		5	5	5	5	4	3	5	4	5
A-2-14	320	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	4	4	4	4	4
A-2-15	320	5	5	5	5	5	5	5	4	4	4	5	5	5	5	4	3	1	3	1
A-2-17	315	5	5		5	5	5		5	5	5	5		5	5	4	5	4	5	
A-2-18	320	5	5	5	3	5	5	5	2	3	3	3		5	5	1	0	0	3	3
A-2-19	320	5	5	5	5	5	5	5	0	0	4	5	4	4	0	2		2	4	5
A-2-20	320	5	5	5	5	5	5	5	4	4	4	4	5	5	5	1	3	3	4	4
A-2-21	320	5	5	5	5	5	5	5	2	4	5	4	4	5	5	0	3	1	0	4
A-2-22	320	5	5	5	5	5	5	5	4	4	4	4		5	5	0	4	0	1	4
A-2-23	320	5	5	5	4	5	5	5	0	0	4	4	4	5	5	0	0	0	3	4
A-2-24	315	5	5		5	5	5		4	4	4	4			4	0	1	4		
A-2-25	320	5	5	5	4	5	5	5	5	4	4	4		5	5	0	0	0	4	3
A-2-26	320	5	5	5	5	5	5	5	0	2	4	3		5	5	0	2	3	3	1
A-2-27	80					5	5	5										1		2
A-2-28	315	5	5		5	5	5		4	4	5	5			5	1	3	1	5	
A-2-29	230	5	5	5	3	5	5	5	3	2	3	4	3	5	1	1	0	0	3	4
A-2-30	320	5	5	5	4	5	5	5	0	0	3	3	0	4	3	0	0	1	3	4
A-2-31	320	2	2	2	2	3	1	4	0	0	2	3	3	3	0	0	0	0	0	0
A-2-32	320	5	5	5	5	5	5	5	0	3	5	4	5	5	2	1	0	0	4	4
A-2-33	315	5	5	4	4	5	5	5	0	2		4	5	5	3	0	0	0	1	3
A-2-34	320	5	5	5	5	5	5	5	0	0	4	4		4	4	0	0	0	4	1
A-2-35	320	4	3	3	0	3	3	4	0	0	0	0	0		0	0	0	0	0	1
A-2-36	320	5	5	4	0	5	5	5	0	3	3	3	0	4	0	0	0	0	2	1
A-2-37	315	5	4		3	3	5		0	1	3	1	0	5	2	1	0	0	0	
A-2-38	315	5	5		5	5	5		2	5	4	4			5	2	2	0	4	
A-2-39	315	5	5	5	4	5	5	5	0	0		2	5	5	4	0	0	1	3	2
A-2-40	320	5	5	5	5	5	5	5	4	4	4	4	5	5	5	2	3	1	1	1

[Таблица 33]

A- 2-41	315	5	5	5	3	5	5	5	0	2		4		5	3	0	0	2	1	2
A- 2-42	315	5	5		5	5	5		5	5	4	4	4	5	5	4	3	4	5	
A- 2-44	315	5	5		1	5	5		0	0	3	4		4	2	0	0	0	0	
A- 2-45	315	5	4		0	2	3		0	0	4	4	3	4	2	0	0	0	0	
A- 2-48	315	5	5	5	5	5	5	5	0	0		4	5	5	5	0	0	0	2	4
A- 2-49	315	4	4	4	0	4	5	5	0	0		3	0	4	0	0	0	0	1	0
A- 2-50	315	3	4		0	2	2		0	0	0	0	0	3	0	0	0	0	0	
A- 2-51	315	3	3		0	3	2		1	2	2	0		4	0	0	0	0	0	
A- 2-52	315	5	5		3	5	5		0	0	4	4		4	2	1	0	0	0	
A- 2-53	320	4	4	4	4	5	5	5	0	0	3	4	5	5	3	0	0	0	4	4
A- 2-54	320	3	3	1	3	4	5	5	0	0	0	3	0	4	1	0	0	0	3	1
A- 2-55	234	4	3	1	0	4	0	4	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0
A- 2-56	315	5	5		5	5	5		3	3	4	3			5	0	0	0	2	
A- 2-57	320	5	5	4	4	5	5	5	4	4	3	3	0	4	5	0	0	1	0	4
A- 2-58	320	5	5	5	5	5	5	5	4	4	4	3	4	5	5	3	3	1	4	4
A- 2-59	320	5	5	5	4	5	5	5	3	4	5	4	4	5	5	0	0	0		5
A- 2-60	320	5	5	5	5	5	5	5	0	4		4	3	4	4	1	0	0	0	0
A- 3-01	315	5	5		4	5	5		0	3	5	2		5		3	0	2	5	
A- 3-02	315	5	5		5	5	5		0	3	4	0				2	0	4	4	
A- 3-03	315	5	5		4	5	5		0	4	4	0			5	2	0	0	4	
A- 3-04	315	5	5		5	5	5		0	4	4	4	4	4	5	4	0	1	4	
A- 3-05	320	0	0	0	0	4	4	4	0	0			0		0	0	0	0	0	0
A- 3-06	315	5	5		2	3	5		1	3	4	4	0	4	4	2	0	0	3	
A- 3-07	315	4	4		3	4	5		0	0	4	3	0		0	0	0	0	2	
A- 3-08	315	5	5		2	3	4		0	3	4	3	0	4	2	0	2	0	3	
A- 3-10	315	5	5		5	5	5		0	3	4	3		4	2	1	0	0	3	
A- 4-02	315	5	5		4	5	5		0	4	2	2		5	5	1	3	0	4	
A- 4-03	315	5	3		5	5	5		4	1	4	3				0	0	3	1	
A- 4-04	320	5	5	4	4	5	5	5	0	0			3		0	0	0	0		3
A- 4-05	80					5	5											3		3
A- 4-06	315	4	5		3	3	5		2	3	4	1	3	0		0	0	0	4	
A- 5-01	320	0	0	0	0	1	3	3	0	0	3	2	0	3	0	0	0	0	0	2
A- 6-01	315	5	5		5	5	5		5	3	4	4		5	5	1	3	0	4	
A- 6-02	315	5	5		4	5	5		3	4	4	4			5	0	0	0		
A- 6-04	320	0	0	0	0	3	2	3	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0
A- 6-06	315	5	5		2	5	5		0	0		3	5	5	1	0	0	0	0	
A- 6-07	320	4	5	3	0	4	5	5	0	2	0	0	0	0	3	2	0	0	0	0
A- 6-08	320	5	5	3	0	5	5	5	0	3	0	0	0	0	3	2	0	0	0	0
A- 6-09	320	3	3	2	0	5	5	5	0	0	3		0	4	2	0	0	0	2	0
A- 6-10	320	4	4	3	2	5	5	5	0	3	5	4	0	5	1	0	1	0	0	4
A- 6-11	320	5	4	3	0	4	4	5	1	2	3		0	4	2	0	0	0	1	2
A- 6-12	320	3	3	2	0	4	5	5	0	0	3	2	0	4	1	0	0	0	0	4
A- 6-13	320	1	3	1	0	1	2	4	0	2	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0

[Таблиця 34]

№	Дозування обробки, (г/га)	E	F	G	H	I	J	K	L	M	N	O	P	b	c	d	e	f	g
B-1-01	315	5	5		5	5	5		3	4	5	3		5	5	0	2	4	3
B-1-02	315	5	5			5	5		0	4	5	5	5		0	0	0	0	1
B-1-03	315	5	5		5	5	5		4	4	5	3		5	5	0	0	3	3
B-1-04	315	5	5		4	5	5		3	4	5	4		5	4	0	0	0	4
B-1-05	315	5	5		5	5	0		4	4	5	4		5	5	1	0	0	5
B-1-06	315	4	5		0	4	2		0	3	3	4		5	2	3	1	0	1
B-1-07	315	4	4		0	0	3		0	0	0	0	0	4	3	1	0	0	0
B-1-08	315	5	5		5	5	5		0	4	3	3		4	5	1	0	0	2
B-1-10	315	5	5		4	5	3		3	3	3	2	0	4	5	3	0	0	3
B-1-12	315	5	5		3	4	2		4	4	4	4		4	5	5	0	0	5
B-1-13	315	5	5			5	5		2	4	4	4	5	5	5	3	4	5	5
B-1-14	315	5	5			5	5		3	5	5	4	5	5	5	0	3	5	5
B-1-15	315	5	5			5	5		4	5		5		5	5	0	0	4	1
B-1-16	315	5	5			5	4		0	4	4	3	5	1	3	0	0	5	0
B-1-17	315	5	5			5	5		0	4	5	3	5	5	0	0	0	3	0
B-1-18	320	3	4	1	0	2	2	5	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0
B-2-01	315	5	5			5	5		3	4	4	3		5	5	0	0		
B-2-02	315	5	3			5	5		3	3	0	3		2	2	0	0	3	0
B-2-03	315	3	3			5	3		0	3	0	4	0	4	1	0	0	1	0
B-2-04	315	5	5		5	5	5		4	4	5	5		5	5	1	0	5	5
B-2-05	315	5	5			5	5		1	4	5	5		5	3	0	0	0	5
B-2-06	315	5	5		5	5	5		4	5	5	4		5	5	0	2	5	5
B-2-07	315	5	5		3	5	5		2	3	3	3	3	5	4	3	1	0	1
B-2-08	315	5	5			5	5		4	4	4	3		4	5	0	0	3	1
B-2-09	315	5	5		3	4	5		0	0	3	2	3	4	3	0	0	0	1
B-2-11	320	5	5	5	3	5	5	5	0	0	4	4	3	5	2	1	0	0	1
B-2-12	320	5	5	5	1	5	5	5	0	0	3	4	2	4	3	0	0	0	0
B-2-13	320	5	5	5	5	5	5	5	0	4	3	3		5	1	0	0	4	4
B-2-14	320	5	5	5	5	5	5	5	0	3	3	3	4	4	4	0	0	0	3
B-2-15	320	5	5	5	3	5	5	5	0	0	3	2		4	5	0	0	0	2
B-2-16	320	5	5	5	5	5	5	5	2	0	4	4		5	1	1	1		3
B-2-17	315	5	5		5	5	5		2	2	3	3	1	5	4	2	2	1	0
B-2-19	1250	5	5		5	5	5		0	4	5	4	0	4	4	0	0	0	4
B-2-20	1250	3	5		0	5	5		2	4	4	3	0	4	4	0	0	0	1
B-2-24	320	3	3	3	0	0	0	3	0	0	0	3	0	0	0	0	0	0	0
B-2-25	315	5	5		5	5	5		4	3	4	4	5	5	5	3	0	1	2
B-2-26	320	5	5	5	1	5	5	5	0	4	4	3	2	0	2	0	0	0	0
B-2-27	315	5	5		5	5	5		5	5	5	5		5	5	4	5	5	1
B-2-28	80					5	5	5									0		0
B-2-29	315	5	5			5	5		4	4	5	5		5	5	0	3	5	5
B-2-30	315	5	5		5	5	5		3	3	5	4	5		4	1	1	0	4
B-2-31	315	5	5			5	5		0	5	4	5		5	5	0	0	5	5
B-2-32	315	5	5		3	4	5		2	4	3	4			3	0	1	0	3
B-2-33	315	5	5	5	5	5	5	5	5	4		4	5	5	5	3	4	5	1
B-2-34	315	5	5		5	5	5		5	5	4	5			5	2	1	1	5
B-2-35	320	5	5	4	4	5	5	5	4	3			0	4	2	1	0	1	4
B-2-36	315	5	5		1	5	4		4	4	3	4	5	4	4	1	1	0	3
B-2-37	315	5	5		5	5	5		4	5	4	4	4		3	1	0	0	4
B-2-38	320	5	5	5	5	5	5	5	1	3	4	4	5	5	5	1	4	0	4
B-2-39	320	5	5	5	5	5	5	5	2	3	4	4	4	5	4	0	0	0	3

[Таблица 35]

В- 2-40	320	5	5	5	5	5	5	5	5	4	5	4		5	5	0	2	0	3	4
В- 2-41	320	5	5	5	3	5	5	5	2	3	4	4		5	4	0	0	0	3	4
В- 2-42	320	5	5	5	5	5	5	5	4	3	4	4		5	4	1	0	0	4	4
В- 2-43	320	5	4	5	5	5	5	5	0	3	3	4	4	5	3	0	2	1	4	4
В- 2-44	320	5	5	5	2	5	5	5	0	0	3	3	0	4	3	0	0	1	3	4
В- 2-46	320	5	5	5	3	5	5	5	3	4	4	4	4	5	4	1	0	0	4	4
В- 2-47	320	4	5	4	2	5	5	5	0	0	2	3	4	5	3	0	0	0	2	3
В- 2-49	320	5	5	5	3	5	5	5	1	4	3	4		5	3	0	0	0	3	3
В- 2-50	320	5	5	4	0	2	3	5	0	2		0	0	0	1	1	0	0	0	0
В- 2-51	320	5	5	5	5	5	5	5	2	4	4	4	3		3	1	0	0	4	2
В- 2-52	80					4	5	5										0		1
В- 2-53	135.45	5	5			5	5		0	3	4	0		5	3	0	0	2		
В- 2-54	320	5	5	5	5	5	5	5	3	4	3	4	4	5	5	2	0	0	4	4
В- 2-55	315	5	5	5	4	5	5	5	1	4		4		5	4	0	3	0	3	2
В- 2-56	320	5	5	5	3	5	5	5	0	2	4	4	5	5	2	1	0	1	2	1
В- 2-57	315	5	5		5	5	5		5	5	4	4	5	5	5	4	4	0	3	
В- 2-58	315	5	5		3	4	5		1	3	4	4	0	5	3	1	0	0		
В- 2-61	320				0	4	2	5	0	0	0	0	0			0	0	0	0	
В- 2-62	320	4	4	3	3	3	4	5	0	2	3	3	0	4	0	0	0	0	0	0
В- 2-63	315	4	4		2	1	3		0	1	3	3	3	4	0	0	0	0	0	
В- 2-64	320	5	5	5	3	5	5	5	3	4		4	0	5	4	1	0	0	4	3
В- 3-01	315	5	5		5	5	5		2	4	5	4				3	0	5	4	
В- 3-02	315	5	5		5	5	5		3	5	4	4				3	0	5	4	
В- 3-03	315	5	5		4	5	5		0	0	1	0	0	3	4	4	0	0	2	
В- 3-04	315	5	5	5	3	4	5	5	0	0		3	2	4	1	0	0	0	1	0
В- 3-05	315	5	5		5	4	5		0	0	5	3	0	4	1	2	0	1	1	
В- 4-01	315	4	4		3	0	5		0	0	3	0	0	4	2	2	3	0	3	
В- 4-02	315	5	5		5	5	5		4	5	5	4		5		4	1	1	3	
В- 4-03	315	5	5		4	5	5		3	5	5	3				2	3	1	4	
В- 4-04	320	5	5	5	0	5	5	5	0	3	3	4			3	0	0	0	2	4
В- 4-05	315	5	5		5	5	5		3	4	4	3		5	5	0	0	0		
В- 4-06	315	5	5		5	5	5		1	3	4		4			2	0	3	4	
В- 5-01	320	0	2	0	0	0	0	4	0	0	0	0	0		0	0	0	0	0	0

[0200] [Таблиця № 19]
[Таблиця 36]

№	Дозування обробки, (г/га)	Д	Е	Ф	Г	Н	І	Ј	К	Л	М	Х	О	Р	б	с	д	е	г	г
A-1-04	320	1	1	1	2	4	4	4	3	2	4	4	2	4	0	0	4	0	4	4
A-1-05	315	4	4		4	5	4		3	2	4	3	2		4	3	3	0	4	
A-1-06	80					5	5	5										2		3
A-1-07	315	5	5		5	5	5		4	4	4	4	4		5	4	4	3	1	
A-1-08	315	4	4		3	5	4		3	4	3	1	0		3	1	0	2	0	
A-1-10	315	1	0		0	1	2		0	0	3	0	0	0	0	0	0	0	2	
A-1-12	320	4	1	4		5	5	5	0	1	4	3	3	4	4	2	3	4	1	4
A-1-13	320	4	4	1	4	4	4	3	1	2	4	2	3	3	4	3	3	4	0	3
A-1-15	320	1	2	0	0	1	1	3	0	0	3	0	0	3	0	0	0	1	0	1
A-1-18	320	4	4	4	4	4	4	4	3	2	4	4	4	4	4	0	4	1	4	4
A-1-20	80					4	5	4										0		2
A-1-21	80					4	4	4										0		0
A-1-24	320	3	3	1	0	1	1	4	2	0	4	0	3	4	0	0	1	0	3	3
A-2-01	315	4	3		1	1	4		0	1	3	3	1	4	2	0	3	0	0	
A-2-03	315	5	5		5	5	5		2	2	4	3	5	5	5	4	2	2	0	
A-2-04	320	3	3	2	1	1	1	3	1	2	4	3	0		0	0	4	0	0	0
A-2-05	315	5	5		5	5	5		4	4	4	4	4	5	5	5	5	3	4	
A-2-06	315	5	5		5	5	5		4	4	4	4	4		5	4	3	1	3	
A-2-07	315	5	5		5	5	5		3	3	4	5	5		5	5	4	4		
A-2-08	80					5	5	5										3		5
A-2-09	315	5	5		5	5	5		4	4	3	4	5	5	5	5	5	2	3	
A-2-10	320	5	4	4	3	5	5	5	4	3	3	3	4	4	3	0	3	0	3	4
A-2-11	315	5	5		3	3	5		1	1	3	3	1	4	5	3	3	0	0	
A-2-13	315	5	5	5	5	5	5	5	5	4		4	5	5	5	5	4	4	1	4
A-2-14	320	5	5	5	5	5	5	5	5	5	4	4	5	5	5	4	4	3	3	4
A-2-15	320	5	5	5	5	5	5	5	4	4	3	4	5	5	5	5	5	4	3	4
A-2-17	315	5	5		5	5	5		4	4	5	4	4		5	5	5	4	4	
A-2-18	320	4	4	5	3	4	5	5	3	3	1	3	4	4	4	1	0	0	2	4
A-2-19	320	5	5	4	4	5	5	5	4	4	4	5	4	1	2	3		0	4	5
A-2-20	320	5	5	5	5	5	5	5	4	5		4	4	5	5	4	4	3	4	4
A-2-21	320	5	5	5	4	5	5	5	3	3	4	4	4	5	5	3	4	4	3	4
A-2-22	320	5	5	5	4	5	5	5	5	4	4	4	5	5	5	4	4	2	4	4
A-2-23	320	5	5	5	5	5	5	5	4	4	4	4	4		5	5	4	4	1	4
A-2-24	315	5	5		3	5	5		5	4	4	4	5		5	3	4	0	1	
A-2-25	320	5	5	5	4	5	5	5	5	4	4	4	4	5	5	4	4	1	4	4
A-2-26	320	5	5	5	5	5	5	5	4	4	5	4	4	5	5	3	4	3	4	4
A-2-27	80					3	4	5										0		2
A-2-28	315	5	5		4	5	5		5	4	4	4	5		5	5	4	3	4	
A-2-29	230	5	5	5	4	5	5	5	4	4	4	4	4	4	4	1	4	0	4	4
A-2-30	320	5	5	5	5	3	5	5	4	3	4	4	4	4	0	3	4	0	3	4
A-2-31	320	2	3	2	3	1	0	3	3	3		3	4	5	0	0	3	0	1	2
A-2-32	320	5	5	5	4	5	5	5	5	4		4	5	5	5	4	4	0	3	4
A-2-33	315	5	5	5	5	4	5	5	2	4		4	4	5	4	3	4	1	4	4
A-2-34	320	5	5	4	4	4	5	5	2	2	3	4	4		4	2	4	0	3	4
A-2-35	320	2	1	1	0	0	0	1	4	3	3	2	0	4	0	0	0	0	0	3
A-2-36	320	3	2	1	2	1	0	2	5	4	3	3	4	3	0	0	5	0	1	4
A-2-37	315	4	5		0	1	4		1	2	3	3	0	4	4	2	2	0	0	
A-2-38	315	5	5		5	5	5		4	3	4	2	3	4	5	3	4	1	4	
A-2-39	315	4	4	3	4	5	5	5	2	1		3	4	4	4	2	4	1	3	3
A-2-40	320	5	5	5	4	5	5	5	4	3		3	4	4	4	3	2	3	3	3

[Таблица 37]

A- 2-41	315	4	4	3	3	5	5	5	3	2		4	1	4	4	0	4	0	3	3
A- 2-42	315	5	5		5	5	5		4	4	5	4	5	5	5	5	3	3	4	
A- 2-44	315	4	4		2	5	5		2	0	2	0	1	4	3	1	0	0	0	
A- 2-45	315	5	4		0	1	1		3	3	4	4	2	4	4	0	3	0	1	
A- 2-48	315	5	5	4	4	4	4	5	4	3		3	3	5	4	1	4	0	3	4
A- 2-49	315	3	3	2	0	0	0	3	0	0		3	1	3	0	0	0	0	1	0
A- 2-50	315	2	3		0	0	0		0	0	0	0	0	3	0	0	0	0	2	
A- 2-51	315	1	1		0	0	0		0	0	3	0	3		0	0	0	0	0	
A- 2-52	315	5	5		3	4	5		3	2	3	2	3	4	5	3	4	0	0	
A- 2-53	320	4	3	4	3	4	4	5	2	0		3	3	4	3	2	1	0	3	3
A- 2-54	320	2	2	1	3	4	4	5	0	0	3	1	0	5	0	0	0	0	1	0
A- 2-55	234	3	2	0	0	0	0	0	5	5	4	1	4	4	0	1	4	0	2	4
A- 2-56	315	5	5		4	5	5		3	3	4	3	3	4	5	3	4	2	0	
A- 2-57	320	4	5	5	3	5	5	5	1	3	4	1	2		5	3	1	0	3	4
A- 2-58	320	5	5	5	4	5	5	5	3	3		3	3	4	3	3	1	0	4	3
A- 2-59	320	5	5	5	4	5	5	5	5	4	4	4	4	4	5	3	5	0	4	4
A- 2-60	320	3	3	3	3	5	5	5	4	2	4	3	2	4	0	0	3	0	0	0
A- 3-01	315	4	5		3	5	5		0	2		0	1		3	0	0	2	4	
A- 3-02	315	5	5		4	5	5		2	3		3	5		5		2	0		
A- 3-03	315	5	5		4	5	5		4	3	4	0	3	1	5	4	4	0	0	
A- 3-04	315	5	5		5	5	5		4	3	4	3	4	4	5	3	2	3	3	
A- 3-05	320	3	1	0	0	1	1	3	3	0	4	1	0		0	0	3	0	0	4
A- 3-06	315	5	5		3	2	4		3	3	3	3	0	4	4	3	4	0	4	
A- 3-07	315	5	5		0	1	4		2	1	2	3	0		1	0	1	0	0	
A- 3-08	315	3	3		1	0	4		2	2	3	2	0	4	0	0	3	0	2	
A- 3-10	315	5	5		4	5	4		2	3	4	3	3		4	2	3	0	2	
A- 4-02	315	5	4		3	5	4		3	4	3	3	4	4	4	2	5	0	3	
A- 4-03	315	5	5		4	5	4		2	3	4	2	3	4	5	0	3	1	0	
A- 4-04	320	4	3	1	3	3	3	3	4	3	4	3	4		0	0	0	0	3	3
A- 4-05	80					4	4	3									0		2	
A- 4-06	315	4	4		3	5	4		2	2	3	0	3	4	4	3	1	1	0	
A- 5-01	320	0	0	0	0	0	0	3	0	0	4	3	1		0	0	0	0	3	3
A- 6-01	315	5	5		4	5	5		5	4	4	4	4		5	3	4	0	2	
A- 6-02	315	5	5		3	5	4		5	4	4	4	4		5	4	3	0	0	
A- 6-06	315	5	5		3	4	3		5	4	3	4	4	5	4	4	4	0	2	
A- 6-07	320	3	4	3	1	3	4	4	0	2	0	0	0	0	3	0	0	0	0	0
A- 6-08	320	4	4	3	0	2	4	0	2	4	1	0	0	3	2	1	0	0	0	1
A- 6-09	320	2	2	1	0	2	4	4	0	0	3	0	2	4	0	0	0	0	3	2
A- 6-10	320	4	4	2	3	5	5	5	1	2	4	1	0	3	1	1	3	0	1	4
A- 6-11	320	3	4	2	1	4	4	5	2	2	2	2	0	3	1	0	2	0	1	4
A- 6-12	320	2	3	1	0	1	5	5	0	0	4	3	2	4	0	0	0	0	4	4
A- 6-13	320	0	1	0	0	0	0	0	1	1	2	0	0	2	0	0	0	0	0	0

[Таблиця 38]

№	Дозування обробки, (г/га)	D	E	F	G	H	I	J	K	L	M	N	O	P	b	c	d	e	f	g
B- 1-01	315	5	5			5	5		4	5	5	4	4	4	5	4	4	1	4	
B- 1-02	315	5	5			5	5		0	3	4	3	4	4	0	0	0	0	5	
B- 1-03	315	4	4			5	5		4	4	5	3	3	4	4	2	1	0	3	
B- 1-04	315	4	4			5	5		4	4	5	3	4	3	4	3	0	0	5	
B- 1-05	315	5	5			5	4		5	5	5	4	4	5	4	2	0	0	4	
B- 1-06	315	4	4		0	1	1		1	2	4	3	3	4	1	0	1	0	2	
B- 1-07	315	3	2		0	0	0		0	3	0	0	0	3	0	0	0	0	0	
B- 1-08	315	5	4		3	5	4		0	0	3	4	3	4	4	0	0	0	3	
B- 1-10	315	5	5		3	4	0		4	2	3	2	2	4	5	4	2	0	2	
B- 1-12	315	5	5		3	4	1		3	0	4	4	3	3	3	5	0	0	4	
B- 1-13	315	5	5			5	5		5	5	4	4	5	4	5	2	5	4	3	
B- 1-14	315	5	5			5	5		5	5	4	4	4	4	4	3	4	4	5	
B- 1-15	315	5	5			5	4		5	5	3	4	4	4	4	4	4	3	4	
B- 1-16	315	5	5			5	3		5	4	3	0	4	0	4	2	3	1	1	
B- 1-17	315	5	5			5	1		5	5	4	3	4	3	4	5	0	0	0	
B- 1-18	320	2	3	2	0	1	1	3	3	2	3	3	4	4	0	1	0	0	0	3
B- 2-01	315	5	5			5	5		3	5	4	4	4	0	5	0	5	1	1	
B- 2-02	315	4	3			4	3		0	4	3	0	0	1	4	0	0	0	3	
B- 2-03	315	3	1			3	3		0	1	3	0	0	2	1	0	1	0	1	
B- 2-04	315	5	5			5	5		5	5	5	4	4	5	5	3	4	5	5	
B- 2-05	315	5	5			5	5		3	3	4	4	4	5	4	4	3	3	4	
B- 2-06	315	5	5			5	5		3	5	4	4	4	5	5	1	4	4	4	
B- 2-07	315	5	4		3	4	5		1	2	3	2	2	3	4	1	3	0	3	
B- 2-08	315	5	5			5	5		1	4	4	4	3	4	4	0	4	2	5	
B- 2-09	315	5	5		0	4	4		0	0	4	3	1	4	5	0	0	0	1	
B- 2-11	320	5	5	5	4	5	5	5	5	4	5	4	4		3	5	4	0	1	1
B- 2-12	320	5	5	5	4	5	5	5	5	4	4	4	4		3	4	4	0	4	4
B- 2-13	320	5	5	5	3	5	5	5	5	4	4	4	5	5	5	4	4	0	4	4
B- 2-14	320	4	5	4	4	5	5	5	5	4	4	4	4	4	3	3	3	0	3	1
B- 2-15	320	4	5	4	3	4	5	5	1	2	4	4	3		3	4	1	2	3	4
B- 2-16	320	5	5	5	5	5	5	5	5	4	5	4	4		5	4	4	3	4	4
B- 2-17	315	5	5		4	4	5		1	3	2	2	0	2	5	3	0	0	2	
B- 2-19	1250	5	5		3	5	4		0	3	3	3	3	5	4	1	1	0	3	
B- 2-20	1250	5	5		0	4	4		0	3	3	3	0	4	0	1	3	0	4	
B- 2-24	320	0	1	0	0	0	0	1	0	0	4	2	3		0	0	0	0	0	0
B- 2-25	315	5	5		5	5	5		4	2	4	4	5	5	5	3	3	0	3	
B- 2-26	320	3	4	3	3	4	3	5	3	4	4	3	3		1	3	4	0	4	1
B- 2-27	315	5	5		5	5	5		4	4	3	4	4		5	4	4	4	4	
B- 2-28	80					5	5	5										0		3
B- 2-29	315	5	5			5	5		5	5	4	5	4	4	5	4	5	5	4	
B- 2-30	315	5	5		3	3	4		4	4	4	3	4	4	5	1	4	0	4	
B- 2-31	315	5	5			5	5		5	5	4	5	3	4	5	4	5	5	4	
B- 2-32	315	5	5		4	3	5		4	3	3	3			3	1	4	0	1	
B- 2-33	315	5	5	5	5	5	5	5	4	4		4	5	5	5	3	4	4	4	4
B- 2-34	315	5	5		5	5	5		5	4	3	3	0	3	5	3	5	1	4	
B- 2-35	320	5	5	5	2	4	4	4	3	3	4	3	5		4	1	4	0	3	4
B- 2-36	315	5	5		1	3	0		4	3	4	4	4		4	3	3	0	3	
B- 2-37	315	5	5		3	4	4		4	4	3	4	3	4	4	4	3	1	4	
B- 2-38	320	5	5	5	5	5	5	5	4	4	4	4	4	4	5	5	4	1	4	4
B- 2-39	320	5	5	5	4	5	5	5	4	3	5	4	4	5	4	4	4	0	4	4

[Таблиця 39]

B- 2-40	320	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	4	5	4	5	5	5	1	4	4
B- 2-41	320	5	5	5	3	5	5	5	5	4	3	4	5	5	4	4	4	0	4	5
B- 2-42	320	5	5	5	3	5	5	5	5	4	4	4	5	4	4	3	4	0	4	4
B- 2-43	320	5	5	5	3	5	5	5	3	3	4	3	1		5	3	4	0	3	4
B- 2-44	320	4	5	4	3	5	5	5	4	3	3	4	5	5	3	1	4	4	3	5
B- 2-46	320	4	5	4	3	4	4	5	3	0		2	4	4	3	1	0	0	4	4
B- 2-47	320	3	4	1	2	2	2	4	0	0		2	3	4	0	0	0	0	3	3
B- 2-49	320	5	5	4	3	3	1	4	4	3	3	3	3	4	0	3	3	0	3	3
B- 2-50	320	2	2	0	0	1	1	1	1	0	3	0	0	0	0	0	0	0	0	0
B- 2-51	320	5	5	5	5	5	5	5	4	4	4	4	4	4	4	0	3	1	4	3
B- 2-52	80					2	3	5									0			0
B- 2-53	135.45	5	5			5	5		4	4	3	1	3	4	4	1	4	1	0	
B- 2-54	320	5	5	5	5	5	5	5	4	4	4	4	4	4	5	3	4	0	4	4
B- 2-55	315	5	5	5	3	5	4	5	4	4		4	5	5	5	4	4	2	4	4
B- 2-56	320	5	5	4	5	4	5	5	0	3		4	4	4	4	5	4	3	3	3
B- 2-57	315	5	5		5	5	5		5	5	3	3	5		5	5	4	1	3	
B- 2-58	315	5	5		3	5	5		3	3	3	3	1		4	3	3	1	4	
B- 2-61	320				0	0	0	1	0	0	0	0	0	2		0	0	0	2	
B- 2-62	320	3	3	3	1	3	2	4	4	4	3	2	1	4	0	0	0	0	0	4
B- 2-63	315	3	3		0	0	1		0	0	3	2	2	1	0	0	2	0	0	
B- 2-64	320	5	5	5	4	5	5	5	4	4	4	4	4	4	4	0	4	0	4	4
B- 3-01	315	5	5		5	5	5		3	3		2	4	3	5	4	4	1		
B- 3-02	315	5	5		5	5	5		4	3	2	0	4	3	5	4	4	3	3	
B- 3-03	315	5	5		4	5	5		2	2	2	2	0	1	5	4	3	0	0	
B- 3-04	315	3	4	3	3	3	3	4	2	0		3	2	3	0	0	0	0	2	1
B- 3-05	315	4	4		4	3	4		3	3	3	3	1	5	4	0	2	1	2	
B- 4-01	315	2	1		0	0	2		0	0	1	2	0	4	0	0	0	0	1	
B- 4-02	315	5	5		5	5	5		3	4	4	3	5	5	5	4	4	0		
B- 4-03	315	5	5		5	5	5		4	3	3	1	5	4	5	4	4	0	4	
B- 4-04	320	4	4	4	2	4	4	4	5	3	4	3	4	4	4	1	1	4	4	3
B- 4-05	315	5	5		4	4	5		3	3	2	2	1	4	5	3	3	0	0	
B- 4-06	315	5	5		5	5	5		3	4	4	3	4		5	5	4	1	3	
B- 5-01	320	0	0	0	0	0	0	0	0	0	3	0	1	3	0	0	0	0	0	0

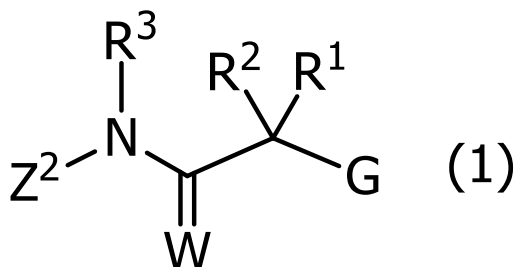
5 Можливі промислові застосування

[0201] Гетероциклічні амідні сполуки за даним винаходом є новими сполуками і є застосовними в якості селективних гербіцидів для застосування щодо рису, кукурудзи, соєвих бобів, пшениці, буряку й ріпака.

Формула винаходу

10 1. Гетероциклічна амідна сполука, представлена формулою (1):

[Xim. 1]



[у формулі W являє собою атом кисню або атом сірки,

кожний з R^1 і R^2 незалежно являє собою атом водню, C_1 - C_6 алкіл або (C_1-C_6) алкіл, необов'язково заміщений R^8 , або ж шляхом спільного утворення R^1 і R^2 C_2 - C_6 алкіленового ланцюга R^1 і R^2 разом зі зв'язуючим атомом вуглецю можуть утворювати 3-7-членне кільце,

R^3 являє собою атом водню, C_1 - C_6 алкіл або $(C_1$ - $C_6)$ алкіл, необов'язково заміщений R^9 ,

R^8 являє собою атом галогену або $-OR^{10}$,

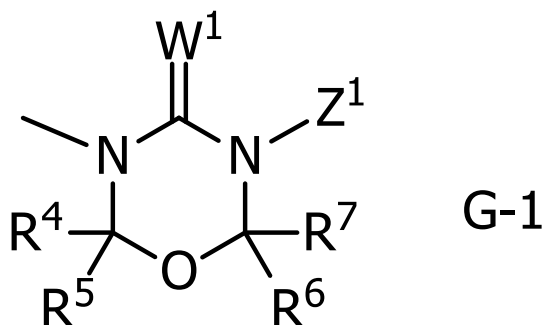
R^9 являє собою атом галогену або $-OR^{11}$,

кожний з R^{10} і R^{11} незалежно являє собою атом водню або C_1 - C_6 алкіл,

G являє собою кільце, представлене G-1 або G-2,

(а) якщо G являє собою кільце, представлене $G-1$,

[Хім. 2]

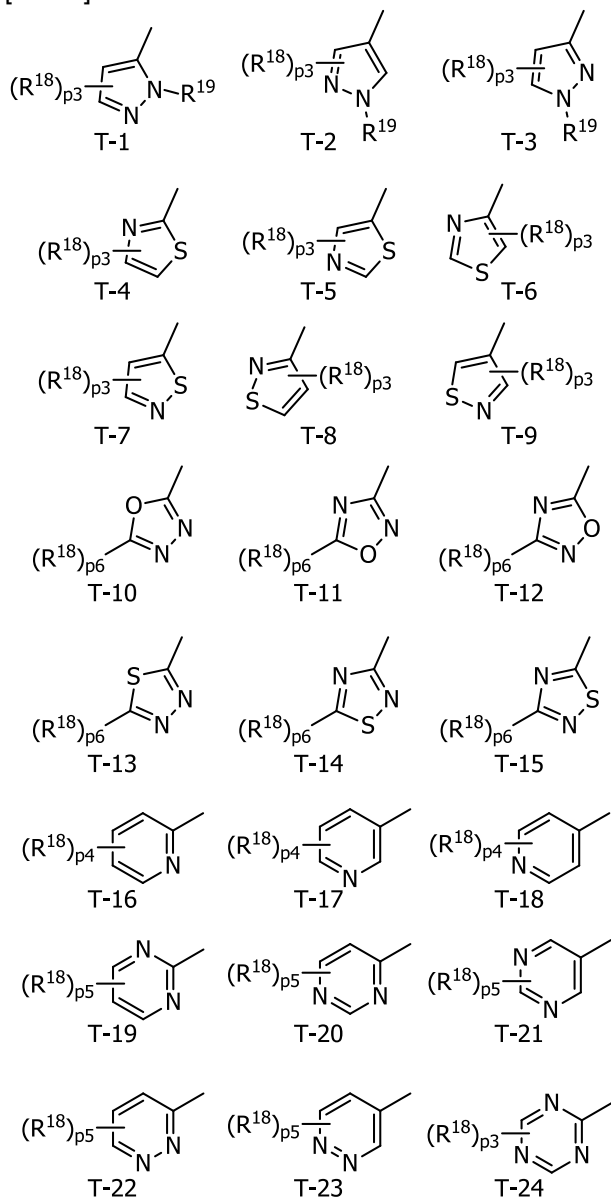


W^1 являє собою атом кисню або атом сірки,

- 5 Z^1 являє собою C_1 - C_6 алкіл, (C_1 - C_6)алкіл, необов'язково заміщений R^{12} , C_3 - C_6 циклоалкіл, (C_3 - C_6)циклоалкіл, необов'язково заміщений R^{12} , C_2 - C_6 алкеніл, (C_2 - C_6)алкеніл, необов'язково заміщений R^{12} , C_2 - C_6 алкініл, (C_2 - C_6)алкініл, необов'язково заміщений R^{12} , феніл, феніл, заміщений (R^{13})_{p1} або Q-1 - Q-3, і

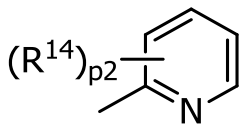
Z^2 являє собою ароматичне гетероциклічне кільце, представлене будь-яким з T-1 - T-24,

[Хім. 3]

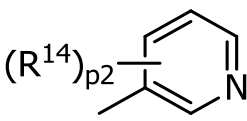


кожний з R^4 , R^5 , R^6 і R^7 незалежно являє собою атом водню або C_1 - C_6 алкіл,

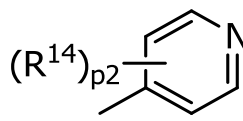
Q-1 - Q-3 являють собою ароматичні гетероциклічні кільця, відповідно представлені наступними структурними формулами,
[Хім. 4]



Q-1



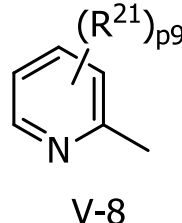
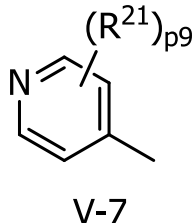
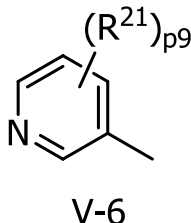
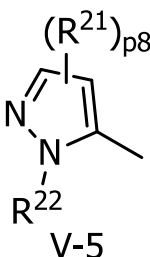
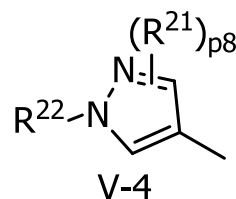
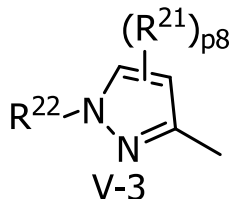
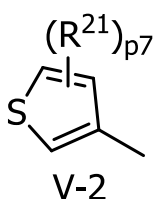
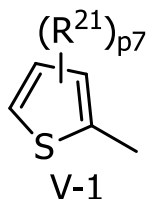
Q-2



Q-3

- 5 R^{12} являє собою атом галогену, феніл або $-OR^{15}$,
 R^{13} являє собою атом галогену, C_1 - C_6 алкіл, C_1 - C_6 галогеналкіл або $-OR^{16}$, і якщо $p1$ являє собою ціле число 2 або більше, кожний з R^{13} може бути аналогічним або відмінним, крім того, якщо 2 R^{13} є суміжними, 2 суміжних R^{13} за допомогою утворення $-CH_2CH_2CH_2-$, $-CH_2CH_2O-$, $-CH_2OCH_2-$, $-OCH_2O-$, $-CH_2CH_2S-$, $-CH_2CH_2CH_2CH_2-$, $-CH_2CH_2CH_2O-$, $-CH_2CH_2OCH_2-$, $-CH_2OCH_2O-$, $-OCH_2CH_2O-$, $-CH_2CH_2CH_2S-$, $-OCH_2CH_2S-$ або $-CH=CH-CH=CH-$ можуть утворювати 5-членне кільце або 6-членне кільце разом з атомом вуглецю, з яким зв'язаний кожний з 2 R^{13} , і в даному випадку атоми водню, зв'язані з кожним атомом вуглецю, що утворює кільце, необов'язково можуть бути заміщені атомом(-ами) галогену, C_1 - C_6 алкільною групою(-ами) або C_1 - C_6 галогеналкільною групою(-ами),
- 10 R^{14} являє собою атом галогену, C_1 - C_6 алкіл, C_1 - C_6 галогеналкіл або $-OR^{17}$, і якщо $p2$ являє собою ціле число 2 або більше, кожний з R^{14} може бути аналогічним або відмінним, крім того, якщо 2 R^{14} є суміжними, 2 суміжних R^{14} за допомогою утворення $-CH_2CH_2CH_2-$, $-CH_2CH_2O-$, $-CH_2OCH_2-$, $-OCH_2O-$, $-CH_2CH_2S-$, $-CH_2CH_2CH_2CH_2-$, $-CH_2CH_2CH_2O-$, $-CH_2CH_2OCH_2-$, $-CH_2OCH_2O-$, $-OCH_2CH_2O-$, $-CH_2CH_2CH_2S-$, $-OCH_2CH_2S-$ або $-CH=CH-CH=CH-$ можуть утворювати 5-членне кільце або 6-членне кільце разом з атомом вуглецю, з яким зв'язаний кожний з 2 R^{14} , і в даному випадку атоми водню, зв'язані з кожним атомом вуглецю, що утворює кільце, необов'язково можуть бути заміщені атомом(-ами) галогену, C_1 - C_6 алкільною групою(-ами) або C_1 - C_6 галогеналкільною групою(-ами),
- 15 R^{15} являє собою атом водню або C_1 - C_6 алкіл,
 R^{16} являє собою атом водню, C_1 - C_6 алкіл, C_1 - C_6 галогеналкіл або феніл,
 R^{17} являє собою C_1 - C_6 алкіл, C_1 - C_6 галогеналкіл або феніл,
 R^{18} являє собою атом галогену, C_1 - C_6 алкіл, C_1 - C_6 галогеналкіл, C_3 - C_6 циклоалкіл, ціано, -
20 $C(O)OR^{20}$, феніл, $-OR^{23}$, нітро, $-N(R^{24})R^{25}$, $-S(O)_qR^{26}$ або V-1 - V-8, і якщо $p3$, $p4$ або $p5$ являють собою ціле число 2 або більше, кожний з R^{18} може бути аналогічним або відмінним, крім того, якщо 2 R^{18} є суміжними, 2 суміжних R^{18} за допомогою утворення $-CH_2CH_2CH_2-$, $-CH_2CH_2O-$, $-CH_2OCH_2-$, $-OCH_2O-$, $-CH_2CH_2S-$, $-CH_2CH_2CH_2CH_2-$, $-CH_2CH_2CH_2O-$, $-CH_2CH_2OCH_2-$, $-CH_2OCH_2O-$, $-OCH_2CH_2O-$, $-CH_2CH_2CH_2S-$, $-OCH_2CH_2S-$ або $-CH=CH-CH=CH-$ можуть утворювати 5-членне кільце або 6-членне кільце разом з атомом вуглецю, з яким зв'язаний кожний з 2 R^{18} , і в даному випадку атоми водню, зв'язані з кожним атомом вуглецю, що утворює кільце, необов'язково можуть бути заміщені атомом(-ами) галогену, C_1 - C_6 алкільною групою(-ами) або C_1 - C_6 галогеналкільною групою(-ами),
- 25 V-1 - V-8 являють собою ароматичні гетероциклічні кільця, відповідно представлені наступними структурними формулами,
- 30
- 35
- 40

[Хім. 5]



кожний з R^{19} і R^{20} незалежно являє собою C_1 - C_6 алкіл або C_1 - C_6 галогеналкіл,

R^{21} являє собою атом галогену, C_1 - C_6 алкіл або C_1 - C_6 галогеналкіл, і якщо $p7$, $p8$ або $p9$ являють собою ціле число 2 або більше, кожний з R^{21} може бути аналогічним або відмінним,

крім того, якщо 2 R^{21} є суміжними, 2 суміжних R^{21} за допомогою утворення $-CH_2CH_2CH_2-$, $-CH_2CH_2O-$, $-CH_2OCH_2-$, $-OCH_2O-$, $-CH_2CH_2S-$, $-CH_2SCH_2-$, $-CH_2CH_2CH_2CH_2-$, $-CH_2CH_2CH_2O-$, $-CH_2CH_2OCH_2-$, $-CH_2OCH_2O-$, $-OCH_2CH_2O-$, $-CH_2CH_2CH_2S-$, $-OCH_2CH_2S-$ або $-CH=CH-CH=CH-$ можуть утворювати 5-членне кільце або 6-членне кільце разом з атомом вуглецю, з яким зв'язаний кожний з 2 R^{21} , і в даному випадку атоми водню, зв'язані з кожним атомом вуглецю, що утворює кільце, необов'язково можуть бути заміщені атомом(-ами) галогену, C_1 - C_6 алкільною групою(-ами) або C_1 - C_6 галогеналкільною групою(-ами),

R^{22} являє собою C_1 - C_6 алкіл або C_1 - C_6 галогеналкіл,

R^{23} являє собою атом водню, C_1 - C_6 алкіл, C_1 - C_6 галогеналкіл або феніл,

кожний з R^{24} і R^{25} незалежно являє собою атом водню або C_1 - C_6 алкіл, або ж R^{24} за допомогою утворення C_2 - C_6 алкіленового ланцюга разом з R^{25} може утворювати 3-7-членне кільце разом зі зв'язуючим атомом азоту, і в даному випадку даний алкіленовий ланцюг може містити 1 атом кисню, атом сірки або атом азоту і може необов'язково бути заміщений атомом(-ами) галогену, C_1 - C_6 алкільною групою(-ами), C_1 - C_6 галогеналкільною групою(-ами), C_1 - C_6 алкоксигрупою(-ами), формільною групою(-ами), C_1 - C_6 алкілкарбонільною групою(-ами), C_1 - C_6 алкоксикарбонільною групою(-ами) або оксогрупою(-ами),

R^{26} являє собою C_1 - C_6 алкіл або C_1 - C_6 галогеналкіл,

$r1$ являє собою ціле число 1, 2, 3, 4 або 5,

$r2$ являє собою ціле число 0, 1, 2, 3 або 4,

$r3$ являє собою ціле число 0, 1 або 2,

$r4$ являє собою ціле число 0, 1, 2, 3 або 4,

$r5$ являє собою ціле число 0, 1, 2 або 3,

$r6$ являє собою ціле число 0 або 1,

$r7$ являє собою ціле число 0, 1, 2 або 3,

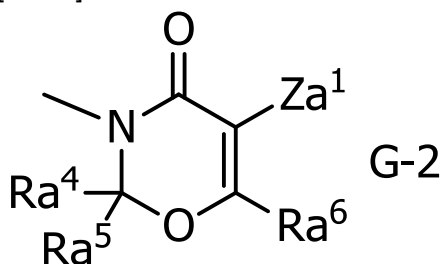
$r8$ являє собою ціле число 0, 1 або 2,

$r9$ являє собою ціле число 0, 1, 2, 3 або 4, і

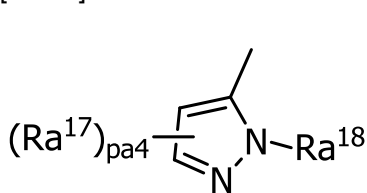
q являє собою ціле число 0, 1 або 2, або

(b) якщо G являє собою кільце, представлене G-2,

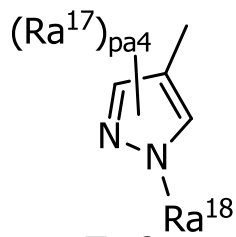
[Хім. 6]



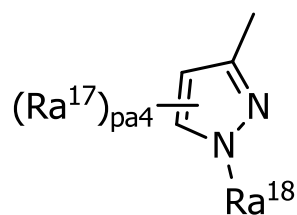
Za^1 являє собою феніл, феніл, заміщений $(Ra^{13})_{pa1}$ або Qa-1 - Qa-8,
 Z^2 являє собою ароматичне гетероциклічне кільце, представлене будь-яким з Ta-1 - Ta-13,
 [Xim. 7]



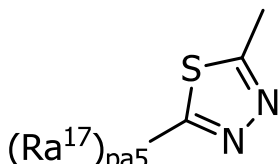
Ta-1



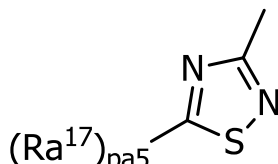
Ta-2



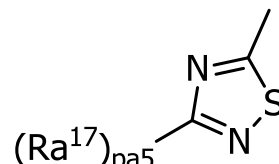
Ta-3



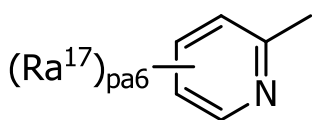
Ta-4



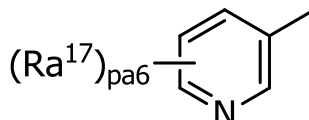
Ta-5



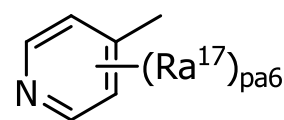
Ta-6



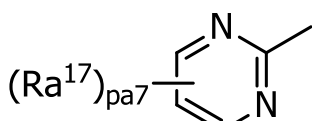
Ta-7



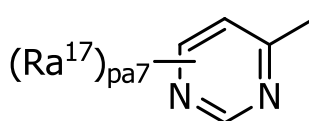
Ta-8



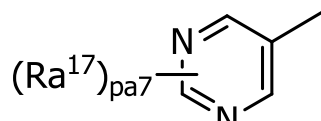
Ta-9



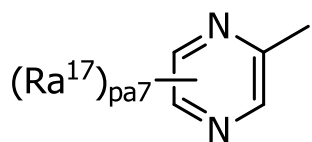
Ta-10



Ta-11



Ta-12

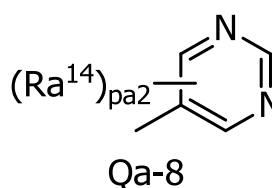
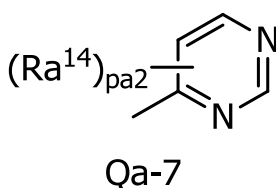
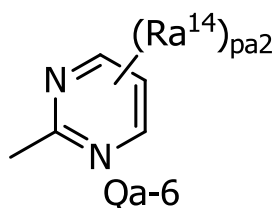
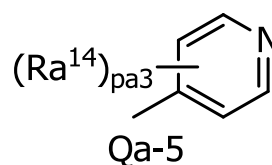
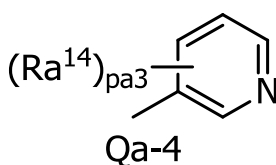
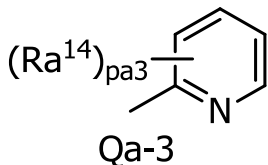
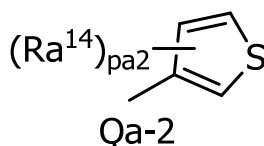
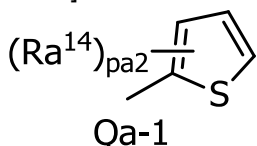


Ta-13

5

кожний з Ra^4 і Ra^5 незалежно являє собою атом водню або C_1 - C_6 алкіл,
 Ra^6 являє собою атом водню, C_1 - C_6 алкіл або $(C_1$ - $C_6)$ алкіл, необов'язково заміщений Ra^9 ,
 Qa-1 - Qa-8 являють собою ароматичні гетероциклічні кільця, відповідно представлені наступними структурними формулами,

[Xim. 8]



Ra^9 являє собою атом галогену або $-ORa^{12}$,

Ra^{12} являє собою атом водню або C_1 - C_6 алкіл,

5 Ra^{13} являє собою атом галогену, C_1 - C_6 алкіл, C_1 - C_6 галогеналкіл або $-ORa^{15}$, і якщо $pa1$ являє собою ціле число 2 або більше, кожний з Ra^{13} може бути аналогічним або відмінним,

крім того, якщо 2 Ra^{13} є суміжними, 2 суміжних Ra^{13} за допомогою утворення $-CH_2CH_2CH_2-$, $-CH_2CH_2O-$, $-CH_2OCH_2-$, $-OCH_2O-$, $-CH_2CH_2S-$,

10 $-CH_2SCH_2-$, $-CH_2CH_2CH_2CH_2-$, $-CH_2CH_2CH_2O-$, $-CH_2CH_2OCH_2-$, $-CH_2OCH_2O-$, $-OCH_2CH_2O-$, $-CH_2CH_2CH_2S-$, $-OCH_2CH_2S-$ або $-CH=CH-CH=CH-$ можуть утворювати 5-членне кільце або 6-членне кільце разом з атомом вуглецю, з яким зв'язаний кожний з 2 Ra^{13} , і в даному випадку атоми водню, зв'язані з кожним атомом вуглецю, що утворює кільце, необов'язково можуть бути заміщені атомом(-ами) галогену, C_1 - C_6 алкільною групою(-ами) або C_1 - C_6 галогеналкільною групою(-ами),

15 Ra^{14} являє собою атом галогену, C_1 - C_6 алкіл, C_1 - C_6 галогеналкіл або $-ORa^{16}$, і якщо $pa2$ або $pa3$ являє собою ціле число 2 або більше, кожний з Ra^{14} може бути аналогічним або відмінним,

крім того, якщо 2 Ra^{14} є суміжними, 2 суміжних Ra^{14} за допомогою утворення $-CH_2CH_2CH_2-$, $-CH_2CH_2O-$, $-CH_2OCH_2-$, $-OCH_2O-$, $-CH_2CH_2S-$,

20 $-CH_2SCH_2-$, $-CH_2CH_2CH_2CH_2-$, $-CH_2CH_2CH_2O-$, $-CH_2CH_2OCH_2-$, $-CH_2OCH_2O-$, $-OCH_2CH_2O-$, $-CH_2CH_2CH_2S-$, $-OCH_2CH_2S-$ або $-CH=CH-CH=CH-$ можуть утворювати 5-членне кільце або 6-членне кільце разом з атомом вуглецю, з яким зв'язаний кожний з 2 Ra^{14} , і в даному випадку атоми водню, зв'язані з кожним атомом вуглецю, що утворює кільце, необов'язково можуть бути заміщені атомом(-ами) галогену, C_1 - C_6 алкільною групою(-ами) або C_1 - C_6 галогеналкільною групою(-ами),

25 Ra^{15} являє собою атом водню, C_1 - C_6 алкіл, C_1 - C_6 галогеналкіл або феніл,

Ra^{16} являє собою C_1 - C_6 алкіл, C_1 - C_6 галогеналкіл або феніл,

Ra^{17} являє собою атом галогену, C_1 - C_6 алкіл, C_1 - C_6 галогеналкіл, C_3 - C_6 циклоалкіл, ціано, $-C(O)ORa^{19}$, феніл, $-ORa^{21}$, нітро, $-N(Ra^{22})Ra^{23}$, $-S(O)_{qa}Ra^{24}$ або $Va-1$ - $Va-3$, і якщо $pa4$, $pa6$ або $pa7$ являють собою ціле число 2 або більше, кожний з Ra^{17} може бути аналогічним або

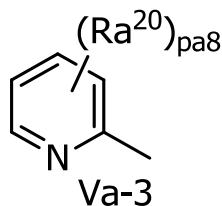
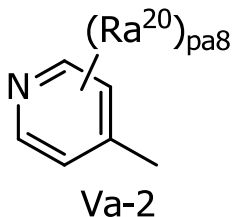
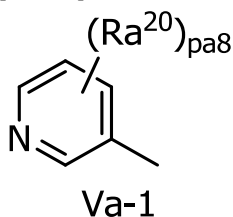
30 відмінним, крім того, якщо 2 Ra^{17} є суміжними, 2 суміжних Ra^{17} за допомогою утворення $-CH_2CH_2CH_2-$, $-CH_2CH_2O-$, $-CH_2OCH_2-$, $-OCH_2O-$, $-CH_2CH_2S-$,

$-CH_2SCH_2-$, $-CH_2CH_2CH_2CH_2-$, $-CH_2CH_2CH_2O-$, $-CH_2CH_2OCH_2-$, $-CH_2OCH_2O-$, $-OCH_2CH_2O-$, $-CH_2CH_2CH_2S-$, $-OCH_2CH_2S-$ або $-CH=CH-CH=CH-$ можуть утворювати 5-членне

35 кільце або 6-членне кільце разом з атомом вуглецю, з яким зв'язаний кожний з 2 Ra^{17} , і в даному випадку атоми водню, зв'язані з кожним атомом вуглецю, що утворює кільце, необов'язково можуть бути заміщені атомом(-ами) галогену, C_1 - C_6 алкільною групою(-ами) або C_1 - C_6 галогеналкільною групою(-ами),

40 $Va-1$ - $Va-3$ являють собою ароматичні гетероциклічні кільця, відповідно представлені наступними структурними формулами,

[Хім. 9]



кожний з Ra^{18} і Ra^{19} незалежно являє собою C_1 - C_6 алкіл або C_1 - C_6 галогеналкіл,

Ra^{20} являє собою атом галогену, C_1 - C_6 алкіл або C_1 - C_6 галогеналкіл, і якщо $pa8$ являє собою ціле число 2 або більше, кожний з Ra^{20} може бути аналогічним або відмінним,

крім того, якщо 2 Ra^{20} є суміжними, 2 суміжних Ra^{20} за допомогою утворення $-CH_2CH_2CH_2-$, $-CH_2CH_2O-$, $-CH_2OCH_2-$, $-OCH_2O-$, $-CH_2CH_2S-$,

$-CH_2SCH_2-$, $-CH_2CH_2CH_2CH_2-$, $-CH_2CH_2CH_2O-$, $-CH_2CH_2OCH_2-$, $-CH_2OCH_2O-$,

$-OCH_2CH_2O-$, $-CH_2CH_2CH_2S-$, $-OCH_2CH_2S-$ або $-CH=CH-CH=CH-$ можуть утворювати 5-членне

кільце або 6-членне кільце разом з атомом вуглецю, з яким зв'язаний кожний з 2 Ra^{20} , і в даному випадку атоми водню, зв'язані з кожним атомом вуглецю, що утворює кільце, необов'язково можуть бути заміщені атомом(-ами) галогену, C_1 - C_6 алкільною групою(-ами) або C_1 - C_6 галогеналкільною групою(-ами),

Ra^{21} являє собою C_1 - C_6 алкіл, C_1 - C_6 галогеналкіл або феніл,

кожний з Ra^{22} і Ra^{23} незалежно являє собою атом водню або C_1 - C_6 алкіл, або ж Ra^{22} за допомогою утворення C_2 - C_6 алкіленового ланцюга разом з Ra^{23} може утворювати 3-7-членне кільце разом зі зв'язуючим атомом азоту, і в даному випадку даний алкіленовий ланцюг може містити 1 атом кисню, атом сірки або атом азоту і може бути необов'язково заміщеним атомом(-ами) галогену, C_1 - C_6 алкільною групою(-ами), C_1 - C_6 галогеналкільною групою(-ами), C_1 - C_6 алкоксигрупою(-ами), формільною групою(-ами), C_1 - C_6 алкілкарбонільною групою(-ами) або C_1 - C_6 алкоксихарбонільною групою(-ами),

Ra^{24} являє собою C_1 - C_6 алкіл або C_1 - C_6 галогеналкіл,

$pa1$ являє собою ціле число 1, 2, 3, 4 або 5,

$pa2$ являє собою ціле число 0, 1, 2 або 3,

$pa3$ являє собою ціле число 0, 1, 2, 3 або 4,

$pa4$ являє собою ціле число 0, 1 або 2,

$pa5$ являє собою ціле число 0 або 1,

$pa6$ являє собою ціле число 0, 1, 2, 3 або 4,

$pa7$ являє собою ціле число 0, 1, 2 або 3, і

$pa8$ являє собою ціле число 0, 1, 2, 3 або 4,

qa являє собою ціле число 0, 1 або 2], або її сіль.

2. Гетероциклічна амідна сполука або її сіль за п. 1, яка відрізняється тим, що G являє собою кільце, представлене G-1.

3. Гетероциклічна амідна сполука або її сіль за п. 2, яка відрізняється тим, що

R^4 , R^5 , R^6 і R^7 являють собою атоми водню,

кожний з R^8 , R^9 , R^{12} і R^{14} незалежно являє собою атоми галогену,

R^{16} являє собою атом водню, C_1 - C_6 алкіл або C_1 - C_6 галогеналкіл,

R^{18} являє собою атом галогену, C_1 - C_6 алкіл, C_1 - C_6 галогеналкіл, C_3 - C_6 циклоалкіл, ціано, $-C(O)OR^{20}$, феніл, $-OR^{23}$, нітро, $-S(O)_2R^{26}$, V-2, V-5 або V-6, і якщо $pa3$, $pa4$ або $pa5$ являють собою ціле число 2 або більше, кожний з R^{18} може бути аналогічним або відмінним,

крім того, якщо 2 R^{18} є суміжними, 2 суміжних R^{18} за допомогою утворення $-CH_2CH_2CH_2-$, $-CH_2CH_2O-$, $-CH_2OCH_2-$, $-OCH_2O-$, $-CH_2CH_2S-$,

$-CH_2SCH_2-$, $-CH_2CH_2CH_2CH_2-$, $-CH_2CH_2CH_2O-$, $-CH_2CH_2OCH_2-$, $-CH_2OCH_2O-$,

$-OCH_2CH_2O-$, $-CH_2CH_2CH_2S-$, $-OCH_2CH_2S-$ або $-CH=CH-CH=CH-$ можуть утворювати 5-членне

кільце або 6-членне кільце разом з атомом вуглецю, з яким зв'язаний кожний з 2 R^{18} , і в даному випадку атоми водню, зв'язані з кожним атомом вуглецю, що утворює кільце, необов'язково можуть бути заміщені атомом(-ами) галогену, C_1 - C_6 алкільною групою(-ами) або C_1 - C_6 галогеналкільною групою(-ами), і

R^{21} являє собою атом галогену.

4. Гетероциклічна амідна сполука або її сіль за п. 3, яка відрізняється тим, що

W являє собою атом кисню,

кожний з R^1 і R^2 незалежно являє собою атом водню або C_1 - C_6 алкіл, або ж за допомогою утворення R^1 разом з R^2 C_2 алкіленового ланцюга R^1 і R^2 можуть утворювати 3-членне кільце разом зі зв'язуючим атомом вуглецю,

- R^3 являє собою атом водню або C_1 - C_6 алкіл,
 R^{13} являє собою атом галогену, C_1 - C_6 алкіл, C_1 - C_6 галогеналкіл або $-OR^{16}$,
 R^{16} являє собою C_1 - C_6 алкіл або C_1 - C_6 галогеналкіл,
 R^{18} являє собою атом галогену, C_1 - C_6 алкіл, C_1 - C_6 галогеналкіл, C_3 - C_6 циклоалкіл, ціано, -
 5 $C(O)OR^{20}$, феніл, $-OR^{23}$, нітро, $-S(O)_qR^{26}$, V-2, V-5 або V-6, і якщо 2 R^{18} є суміжними, 2 суміжних R^{18} за допомогою утворення $-CH=CH-CH=CH-$ можуть утворювати 6-членне кільце разом з атомом вуглецю, з яким зв'язаний кожний з 2 R^{18} ,
 кожний з R^{20} і R^{22} незалежно являє собою C_1 - C_6 алкіл,
 R^{23} являє собою C_1 - C_6 алкіл, C_1 - C_6 галогеналкіл або феніл, і
 10 R^{26} являє собою C_1 - C_6 алкіл.
 5. Гетероциклічна амідна сполука або її сіль за п. 4, яка відрізняється тим, що
 Z^1 являє собою C_3 - C_6 циклоалкіл, (C_3 - C_6)циклоалкіл, необов'язково заміщений R^{12} , феніл, феніл, заміщений (R^{13})_{p1} або Q-1 - Q-3,
 Z^2 являє собою T-1, T-2, T-3, T-4, T-5, T-6, T-7, T-8, T-9, T-10, T-13, T-14, T-15, T-16, T-17, T-
 15 18, T-19, T-20, T-21, T-22, T-23 або T-24,
 R^{13} являє собою атом галогену, C_1 - C_6 алкіл або $-OR^{16}$, і
 R^{16} являє собою C_1 - C_6 алкіл.
 6. Гетероциклічна амідна сполука або її сіль за п. 5, яка відрізняється тим, що
 Z^2 являє собою T-1, T-2, T-3, T-4, T-7, T-10, T-13, T-14, T-15, T-16, T-17, T-18, T-19, T-20, T-
 20 21, T-22, T-23 або T-24.
 7. Гетероциклічна амідна сполука або її сіль за п. 6, яка відрізняється тим, що
 Z^1 являє собою феніл, феніл, заміщений (R^{13})_{p1} або Q-2, і
 Z^2 являє собою T-1, T-3, T-4, T-7, T-10, T-13, T-14, T-15, T-16, T-17, T-18, T-19, T-20, T-22 або
 T-24.
 8. Гетероциклічна амідна сполука або її сіль за п. 1, яка відрізняється тим, що
 25 G являє собою кільце, представлене G-2.
 9. Гетероциклічна амідна сполука або її сіль за п. 8, яка відрізняється тим, що
 кожний з R^1 і R^2 незалежно являє собою C_1 - C_6 алкіл або (C_1 - C_6)алкіл, необов'язково
 заміщений R^8 , або ж за допомогою спільного утворення R^1 і R^2 C_2 - C_6 алкіленового ланцюга R^1 і
 30 R^2 разом зі зв'язуючим атомом вуглецю можуть утворювати 3-7-членне кільце,
 R^3 являє собою атом водню,
 R^8 являє собою атом галогену,
 Ra^4 і Ra^5 являють собою атоми водню,
 Ra^6 являє собою C_1 - C_6 алкіл або (C_1 - C_6)алкіл, необов'язково заміщений Ra^9 ,
 35 Ra^9 являє собою атом галогену,
 Ra^{13} являє собою атом галогену, C_1 - C_6 алкіл або C_1 - C_6 галогеналкіл, і якщо $pa1$ являє собою
 ціле число 2 або більше, кожний з Ra^{13} може бути аналогічним або відмінним,
 крім того, якщо 2 Ra^{13} є суміжними, 2 суміжних Ra^{13} за допомогою утворення $-CH_2CH_2CH_2-$, -
 CH_2CH_2O- , $-CH_2OCH_2-$, $-OCH_2O-$, $-CH_2CH_2S-$,
 40 $-CH_2SCH_2-$, $-CH_2CH_2CH_2CH_2-$, $-CH_2CH_2CH_2O-$, $-CH_2CH_2OCH_2-$, $-CH_2OCH_2O-$,
 $-OCH_2CH_2O-$, $-CH_2CH_2CH_2S-$, $-OCH_2CH_2S-$ або $-CH=CH-CH=CH-$ можуть утворювати 5-членне
 кільце або 6-членне кільце разом з атомом вуглецю, з яким зв'язаний кожний з 2 Ra^{13} , і в
 даному випадку атоми водню, зв'язані з кожним атомом вуглецю, що утворює кільце,
 необов'язково можуть бути заміщені атомом(-ами) галогену, C_1 - C_6 алкільною групою(-ами) або
 45 C_1 - C_6 галогеналкільною групою(-ами),
 Ra^{14} являє собою атом галогену, C_1 - C_6 алкіл або C_1 - C_6 галогеналкіл, і якщо $pa2$ або $pa3$ являє
 собою ціле число 2 або більше, кожний з Ra^{14} може бути аналогічним або відмінним,
 крім того, якщо 2 Ra^{14} є суміжними, 2 суміжних Ra^{14} за допомогою утворення $-CH_2CH_2CH_2-$, -
 CH_2CH_2O- , $-CH_2OCH_2-$, $-OCH_2O-$, $-CH_2CH_2S-$,
 50 $-CH_2SCH_2-$, $-CH_2CH_2CH_2CH_2-$, $-CH_2CH_2CH_2O-$, $-CH_2CH_2OCH_2-$, $-CH_2OCH_2O-$,
 $-OCH_2CH_2O-$, $-CH_2CH_2CH_2S-$, $-OCH_2CH_2S-$ або $-CH=CH-CH=CH-$ можуть утворювати 5-членне
 кільце або 6-членне кільце разом з атомом вуглецю, з яким зв'язаний кожний з 2 Ra^{14} , і в
 даному випадку атоми водню, зв'язані з кожним атомом вуглецю, що утворює кільце,
 необов'язково можуть бути заміщені атомом(-ами) галогену, C_1 - C_6 алкільною групою(-ами) або
 55 C_1 - C_6 галогеналкільною групою(-ами),
 Ra^{17} являє собою атом галогену, C_1 - C_6 алкіл, C_1 - C_6 галогеналкіл, C_3 - C_6 циклоалкіл, ціано, -
 $C(O)ORa^{19}$, феніл, $-ORa^{21}$, нітро, $-S(O)_{qa}Ra^{24}$ або Va-1 - Va-3, і якщо $pa4$, $pa6$ або $pa7$ являють
 собою ціле число 2 або більше, кожний з Ra^{17} може бути аналогічним або відмінним,
 крім того, якщо 2 Ra^{17} є суміжними, 2 суміжних Ra^{17} за допомогою утворення $-CH_2CH_2CH_2-$, -
 60 CH_2CH_2O- , $-CH_2OCH_2-$, $-OCH_2O-$, $-CH_2CH_2S-$,

-CH₂SCH₂-, -CH₂CH₂CH₂CH₂-, -CH₂CH₂CH₂O-, -CH₂CH₂OCH₂-, -CH₂OCH₂O-,
-OCH₂CH₂O-, -CH₂CH₂CH₂S-, -OCH₂CH₂S- або -CH=CH-CH=CH- можуть утворювати 5-членне
кільце або 6-членне кільце разом з атомом вуглецю, з яким зв'язаний кожний з 2 Ra¹⁷, і в
даному випадку атоми водню, зв'язані з кожним атомом вуглецю, що утворює кільце,
необов'язково можуть бути заміщені атомом(-ами) галогену, C₁-C₆алкільною групою(-ами) або
C₁-C₆галогеналкільною групою(-ами), і

Ra²⁰ являє собою атом галогену.

10. Гетероциклічна амідна сполука або її сіль за п. 9, яка відрізняється тим, що

W являє собою атом кисню,

кожний з R¹, R² і Ra⁶ незалежно являє собою C₁-C₆алкіл,

Ra¹³ являє собою атом галогену,

Ra¹⁴ являє собою атом галогену, і якщо 2 Ra¹⁴ є суміжними, 2 суміжних Ra¹⁴ за допомогою
утворення -CH=CH-CH=CH- можуть утворювати 6-членне кільце разом з атомом вуглецю, з
яким зв'язаний кожний з 2 Ra¹⁴,

Ra¹⁷ являє собою атом галогену, C₁-C₆алкіл, C₁-C₆галогеналкіл, ціано, -C(O)ORa¹⁹, феніл, -
ORa²¹, -S(O)_qRa²⁴ або Va-1, і якщо 2 Ra¹⁷ є суміжними, 2 суміжних Ra¹⁷ за допомогою утворення
-CH=CH-CH=CH- можуть утворювати 6-членне кільце разом з атомом вуглецю, з яким зв'язаний
кожний з 2 Ra¹⁷, і

кожний з Ra¹⁸, Ra¹⁹ і Ra²⁴ незалежно являє собою C₁-C₆алкіл.

11. Гетероциклічна амідна сполука або її сіль за п. 10, яка відрізняється тим, що

Za¹ являє собою феніл, феніл, заміщений (Ra¹³)_{pa1}, Qa-1, Qa-2, Qa-3, Qa-4, Qa-5 або Qa-8, і

Z² являє собою Ta-2, Ta-4, Ta-5, Ta-6, Ta-7, Ta-8, Ta-9, Ta-11 або Ta-13.

12. Гетероциклічна амідна сполука або її сіль за п. 11, яка відрізняється тим, що

Za¹ являє собою феніл, Qa-1, Qa-2, Qa-4, Qa-5 або Qa-8, і

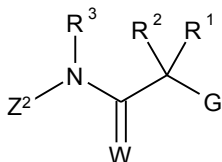
Z² являє собою Ta-2, Ta-4, Ta-6, Ta-7, Ta-8, Ta-9, Ta-11 або Ta-13.

13. Пестицид, який відрізняється тим, що 1, або 2, або більше вибраних з гетероциклічної
амідної сполуки або її солі за пп. 1-12 містяться в якості активного компонента(-ів).

14. Гербіцид, який відрізняється тим, що 1, або 2, або більше вибраних з гетероциклічної
амідної сполуки або її солі за пп. 1-12 містяться в якості активного компонента(-ів).

ФОРМУЛА ВИНАХОДУ

1. Гетероциклічна амідна сполука, представлена формулою (1):



, (1)

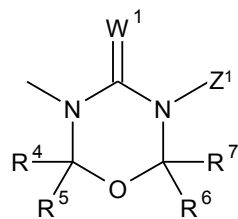
де у формулі W являє собою атом кисню,

кожний з R¹ та R² незалежно являє собою атом водню або C₁-C₆алкіл, або ж шляхом утворення
R¹ разом з R² C₂алкіленового ланцюга, R¹ та R² можуть утворювати 3-членне кільце разом зі
зв'язуючим атомом вуглецю,

R³ являє собою атом водню або C₁-C₆алкіл,

G являє собою кільце, представлене G-1 або G-2,

(а) якщо G являє собою кільце, представлене G-1,

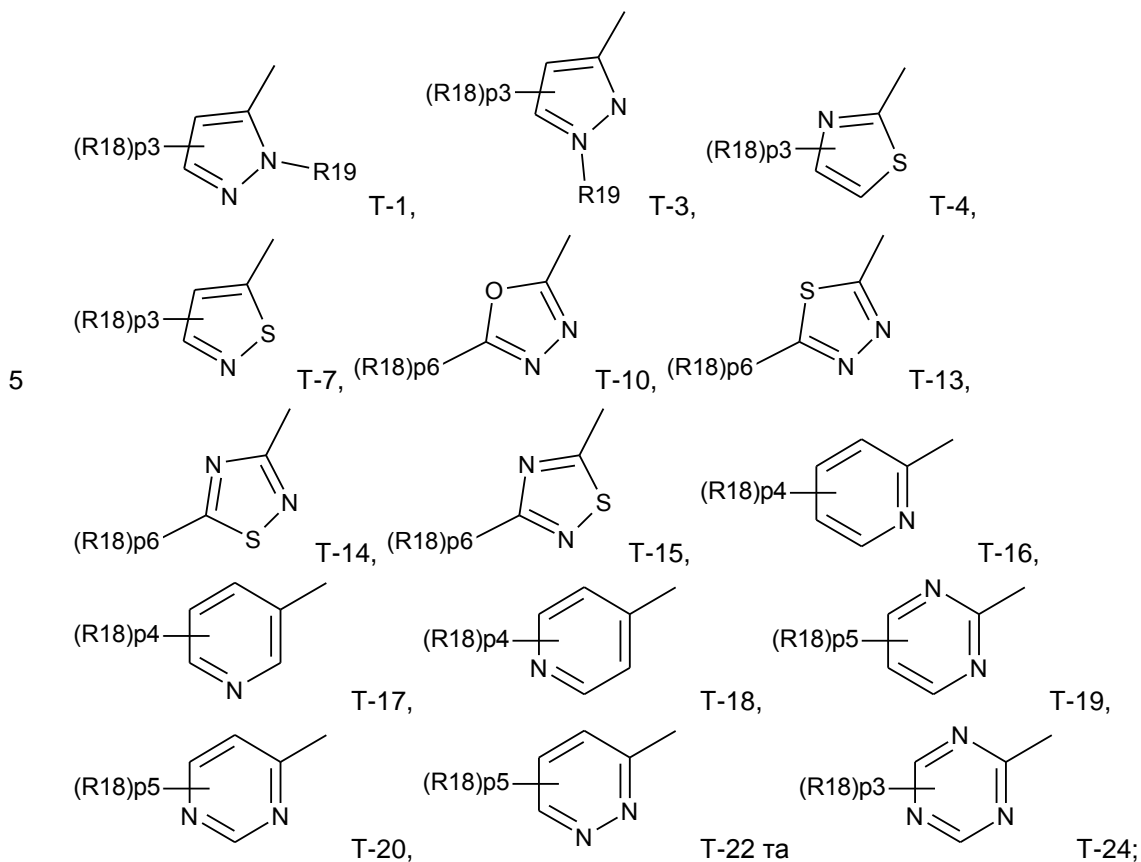


, G-1

W¹ являє собою атом кисню або атом сірки,

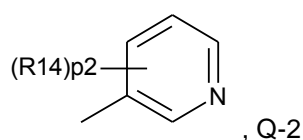
Z¹ являє собою феніл, феніл, заміщений (R¹³)_{p1} або Q-2, та

Z^2 являє собою ароматичне гетероциклічне кільце, представлене будь-яким з T-1, T-3, T-4, T-7, T-10, T-13, T-14, T-15, T-16, T-17, T-18, T-19, T-20, T-22 та T-24:



R^4 , R^5 , R^6 та R^7 являють собою атом водню,

10 Q-2 являє собою ароматичне гетероциклічне кільце, представлене наступною структурною формулою:



15 R^{13} являє собою атом галогену, C_1 - C_6 алкіл або $-OR^{16}$ та, коли p_1 являє собою ціле число 2 або більше, кожний R^{13} може бути однаковим або відмінним,

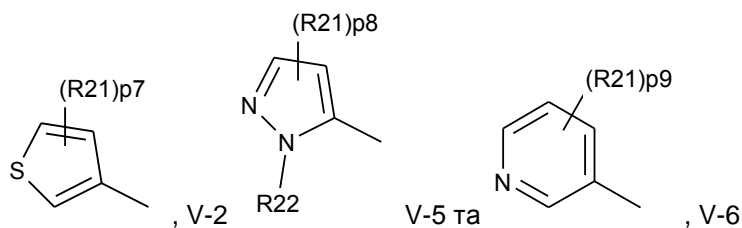
R^{14} являє собою атом галогену та, коли p_2 являє собою ціле число 2 або більше, кожний R^{14} може бути однаковим або відмінним,

R^{16} являє собою C_1 - C_6 алкіл,

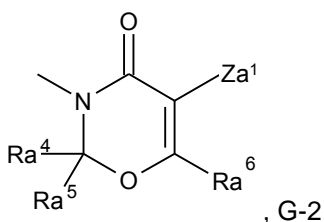
20 R^{18} являє собою атом галогену, C_1 - C_6 алкіл, C_1 - C_6 галогеналкіл, C_3 - C_6 циклоалкіл, ціано, $-C(O)OR^{20}$, феніл, $-OR^{23}$, нітро, $-S(O)_qR^{26}$, V-2, V-5 або V-6 та, коли p_3 , p_4 або p_5 являє собою ціле число 2 або більше, кожний R^{18} може бути однаковим або відмінним,

крім того, якщо 2 R^{18} розташовані поруч, то 2 розташовані поруч R^{18} , за допомогою утворення $-CH=CH-CH=CH-$, можуть утворювати 6-членне кільце разом з атомом вуглецю, до якого приєднаний кожний із 2 R^{18} , і в цьому випадку атоми водню, приєднані до кожного атому вуглецю, що утворює кільце, можуть необов'язково бути заміщені атомом(ами) галогену, C_1 - C_6 алкільною(ими) групою(ами) або C_1 - C_6 галогеналкільною(ими) групою(ами), V-2, V-5 та V-6 являють собою ароматичні гетероциклічні кільця, відповідно представлені наступними структурними формулами:

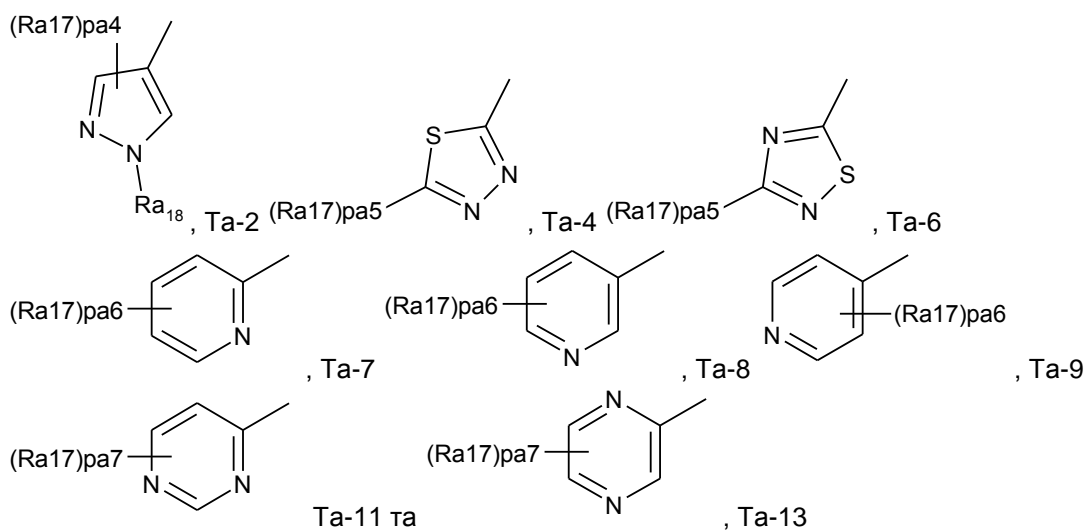
30



- R^{19} являє собою C_1 - C_6 алкіл або C_1 - C_6 галогеналкіл,
 R^{20} являє собою C_1 - C_6 алкіл,
 5 R^{21} являє собою атом галогену та, коли $p7$, $p8$ або $p9$ являє собою ціле число 2 або більше, кожний R^{21} може бути однаковим або відмінним,
 R^{22} являє собою C_1 - C_6 алкіл,
 R^{23} являє собою C_1 - C_6 алкіл, C_1 - C_6 галогеналкіл або феніл,
 R^{26} являє собою C_1 - C_6 алкіл,
 10 $p1$ являє собою ціле число 1, 2, 3, 4 або 5,
 $p2$ являє собою ціле число 0, 1, 2, 3 або 4,
 $p3$ являє собою ціле число 0, 1 або 2,
 $p4$ являє собою ціле число 0, 1, 2, 3 або 4,
 $p5$ являє собою ціле число 0, 1, 2 або 3,
 15 $p6$ являє собою ціле число 0 або 1,
 $p7$ являє собою ціле число 0, 1, 2 або 3,
 $p8$ являє собою ціле число 0, 1 або 2,
 $p9$ являє собою ціле число 0, 1, 2, 3 або 4, та
 q являє собою ціле число 0, 1 або 2, або
 20 (b) якщо G являє собою кільце, представлене G-2,

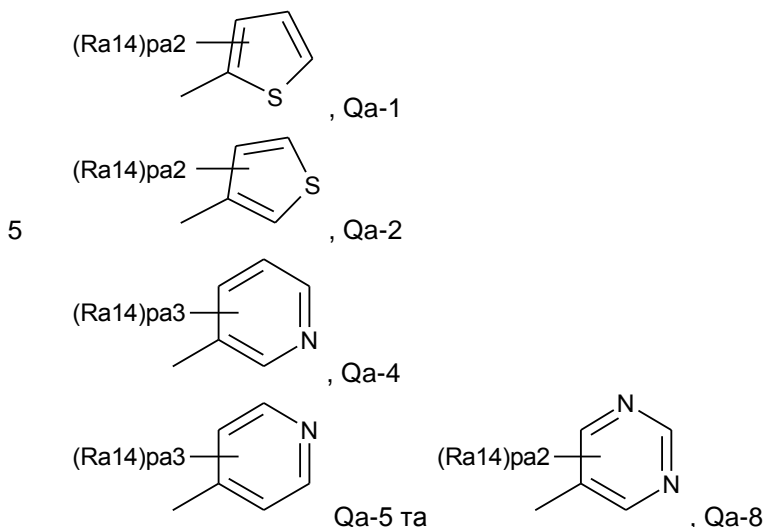


- Za^1 являє собою феніл або Qa-1, Qa-2, Qa-4, Qa-5 або Qa-8,
 25 Z^2 являє собою ароматичне гетероциклічне кільце, представлене будь-яким із Ta-2, Ta-4, Ta-6, Ta-7, Ta-8, Ta-9, Ta-11 або Ta-13:

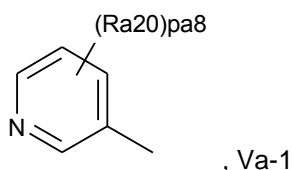


кожний із Ra^4 та Ra^5 незалежно являє собою атом водню,
 Ra^6 являє собою C_1 - C_6 алкіл, або (C_1-C_6) алкіл, необов'язково заміщений Ra^9 ,

Qa-1, Qa-2, Qa-4, Qa-5 та Qa-8 являють собою ароматичні гетероциклічні кільця, відповідно представлені наступними структурними формулами:



- 10 Ra⁹ являє собою атом галогену,
 Ra¹⁴ являє собою атом галогену та, коли pa2 або pa3 являє собою ціле число 2 або більше, кожний Ra¹⁴ може бути однаковим або відмінним,
 крім того, якщо 2 Ra¹⁴ розташовані поруч, то 2 розташовані поруч Ra¹⁴, за допомогою утворення -CH=CH-CH=CH-, можуть утворювати 6-членне кільце разом з атомом вуглецю, до якого приєднаний кожний із 2 Ra¹⁴, і в цьому випадку атоми водню, приєднані до кожного атому вуглецю, що утворює кільце, можуть необов'язково бути заміщені атомом(ами) галогену, C₁-C₆алкільною(ими) групою(ами) або C₁-C₆галогеналкільною(ими) групою(ами),
 15 Ra¹⁷ являє собою атом галогену, C₁-C₆алкіл, C₁-C₆галогеналкіл, ціано, -C(O)ORa¹⁹, феніл, -ORa²¹, -S(O)_{qa}Ra²⁴ або Va-1 та, коли pa4, pa6 або pa7 являє собою ціле число 2 або більше, кожний Ra¹⁷ може бути однаковим або відмінним,
 20 крім того, якщо 2 Ra¹⁷ розташовані поруч, то 2 розташовані поруч Ra¹⁷, за допомогою утворення -CH=CH-CH=CH-, можуть утворювати 6-членне кільце разом з атомом вуглецю, до якого приєднаний кожний із 2 Ra¹⁷, і в цьому випадку атоми водню, приєднані до кожного атому вуглецю, що утворює кільце, можуть необов'язково бути заміщені атомом(ами) галогену, C₁-C₆алкільною(ими) групою(ами) або C₁-C₆галогеналкільною(ими) групою(ами),
 25 Va-1 являють собою ароматичне гетероциклічне кільце, представлене наступною структурною формулою:



- 30 кожний із Ra¹⁸ та Ra¹⁹ незалежно являє собою C₁-C₆алкіл,
 Ra²⁰ являє собою атом галогену та, коли pa8 являє собою ціле число 2 або більше, кожний Ra²⁰ може бути однаковим або відмінним,
 Ra²¹ являє собою C₁-C₆алкіл, C₁-C₆галогеналкіл або феніл,
 Ra²⁴ являє собою C₁-C₆алкіл,
 35 pa2 являє собою ціле число 0, 1, 2 або 3,
 pa3 являє собою ціле число 0, 1, 2, 3 або 4,
 pa4 являє собою ціле число 0, 1 або 2,
 pa5 являє собою ціле число 0 або 1,
 pa6 являє собою ціле число 0, 1, 2, 3 або 4,
 40 pa7 являє собою ціле число 0, 1, 2 або 3, та
 pa8 являє собою ціле число 0, 1, 2, 3 або 4,
 qa являє собою ціле число 0, 1 або 2,
 або її сіль.

2. Гетероциклічна амідна сполука або її сіль за п. 1, яка **відрізняється** тим, що G являє собою кільце, представлене G-1.
3. Гетероциклічна амідна сполука або її сіль за п. 1, яка **відрізняється** тим, що G являє собою кільце, представлене G-2.
- 5 4. Пестицид, який **відрізняється** тим, що 1 або 2, або більше вибраних з гетероциклічної амідної сполуки або її солі за пп. 1-3 містяться як активні компоненти.
5. Гербіцид, який **відрізняється** тим, що 1 або 2, або більше вибраних з гетероциклічної амідної сполуки або її солі за пп. 1-3 містяться як активні компоненти.

Комп'ютерна верстка А. Крижанівський

Міністерство економічного розвитку і торгівлі України, вул. М. Грушевського, 12/2, м. Київ, 01008, Україна

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