

РЕПУБЛИКА БЪЛГАРИЯ

(19) BG

(11) 64232 B1



ОПИСАНИЕ КЪМ ПАТЕНТ

ЗА

ИЗОБРЕТЕНИЕ

7(51) C 07 D 413/10
A 01 N 43/72
C 07 D 498/10,
417/10, 261/04,
291/04, 273/00,
263/10, 261/20,
277/10, 277/34,
403/10, 419/10

ПАТЕНТНО ВЕДОМСТВО

(21) Регистров № 103658
(22) Заявено на 10.08.99
(24) Начало на действие
на патента от: 08.01.98

Приоритетни данни

(31) 19701446 (32) 17.01.97 (33) DE

(41) Публикувана заявка в
бюлетин № 6 на 30.06.2000
(45) Отпечатано на 30.06.2004
(46) Публикувано в бюлетин № 6
на 30.06.2004
(56) Информационни източници:

(62) Разделена заявка от рег. №

(73) Патентоприетжател(и):
BASF AKTIENGESELLSCHAFT,
LUDWIGSHAFEN, CARL-BOSCH-
STRASSE 38 (DE)

(72) Изобретател(и):
Wolfgang Von Deyn, Neustadt
Regina Luise Hill, Speyer
Uwe Kardorff, Mannheim
Ernst Baumann, Dudenhofen
Stefan Engel, Idstein
Guido Mayer, Neustadt
Matthias Witschel, Ludwigshafen
Michael Rack, Heidelberg
Norbert Goetz, Worms
Joachim Gebhardt, Wachenheim
Ulf Misslitz, Neustadt
Helmut Walter, Obrigheim
Karl-Otto Westphalen, Speyer
Martina Otten
Joachim Rheinheimer
Ludwigshafen (DE)

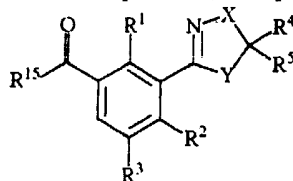
(74) Представител по индустриална
собственост:
Правда Георгиева Бойкова, 1000 София,
ул. "Хан Аспарух" 26

(86) № и дата на РСТ заявка:
PCT/EP1998/000069, 08.01.1998

(87) № и дата на РСТ публикация:
WO1998/031681, 23.07.1998

(54) 3-ХЕТЕРОЦИКЛИЛЗАМЕСТЕНИ БЕНЗОИЛОВИ ПРОИЗВОДНИ

(57) Изобретението се отнася до бензоилови производни с формула



в която R¹, R² са водород, нитро, халоген, циано, алкил, халогеналкил, алкокси, халогеналкокси, алкилтио, халогеналкилтио, алкилсулфинил, халогеналкилсулфинил, алкилсулфонил или халогеналкил-

BG 64232 B1

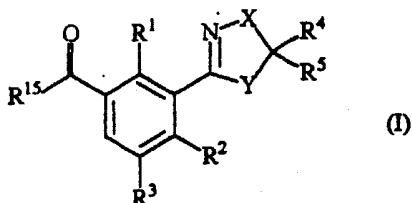
сулфонил, R^3 е водород, халоген или алкил, R^4 и R^5 са водород, халоген, циано, нитро, алкил, алкокси, алкилтио, диалкиламино, фенил или карбонил, като последните шест групи могат да бъдат заместени, X е O, S, NR^9 , CO или $CR^{10}R^{11}$; Y е O, S, NR^{12} , CO или $CR^{13}R^{14}$ и R^{15} в даден случай е заместен пиразол, който е свързан на 4-то място и носи хидрокси- или сулфонилоксигрупа на 5-то място. Изобретението се отнася също до соли на производните, които могат да се използват в земеделието, до метод и междинни продукти за тяхното получаване, до средства, които ги съдържат, и до използването на производните или средствата, които ги съдържат, като хербициди.

24 претенции

(54) 3-ХЕТЕРОЦИКЛИЛЗАМЕСТЕНИ БЕНЗОИЛОВИ ПРОИЗВОДНИ

Област на техниката

Настоящото изобретение се отнася до 3-хетероциклилзаместени бензоилови производни с формула (I)



в която заместителите имат следните значения:

R¹, R² са водород, нитро, халоген, циано, C₁-C₆ алкил, C₁-C₆ халогеналкил, C₁-C₆ алкокси, C₁-C₆ халогеналкокси, C₁-C₆ алкилтио, C₁-C₆ халогеналкилтио, C₁-C₆ алкилсулфинил, C₁-C₆ халогеналкилсулфинил, C₁-C₆ алкилсулфонил или C₁-C₆ халогеналкилсулфонил;

R³ е водород, халоген или C₁-C₆ алкил;

R⁴, R⁵ са водород, халоген, циано, нитро, C₁-C₄ алкил, C₁-C₄ алкокси- C₁-C₄ алкил, ди-(C₁-C₄ алкокси)-C₁-C₄ алкил, ди-(C₁-C₄ алкил)амино- C₁-C₄ алкил, [2,2-ди-(C₁-C₄ алкил)хидразино-1]-C₁-C₄ алкил, C₁-C₄ алкилиминоокси-C₁-C₄ алкил, C₁-C₄ алкоксикарбонил-C₁-C₄ алкил, C₁-C₄ алкилтио-C₁-C₄ алкил, C₁-C₄ халогеналкил, C₁-C₄ цианоалкил, C₃-C₈ циклоалкил, C₁-C₄ алкокси, C₁-C₄ алкокси-C₂-C₄ алкокси, C₁-C₄ халогеналкокси, хидрокси, C₁-C₄ алкилкарбонилокси, C₁-C₄ алкилтио, C₁-C₄ халогеналкилтио, ди-(C₁-C₄ алкил)амино, COR⁶, фенил или бензил, при което двата последно споменати заместителя могат да бъдат частично или напълно халогенирани и/или могат да носят една или повече от следните групи: нитро, циано, C₁-C₄ алкил, C₁-C₄ халогеналкил, C₁-C₄ алкокси или C₁-C₄ халогеналкокси; или

R⁴ и R⁵ заедно образуват C₂-C₆ алкандиолова верига, която може да бъде заместена еднократно до четирикратно с C₁-C₄ алкил и/или може да бъде прекъсната от кислород или азот в даден случай заместен с C₁-C₄ алкил; или

R⁴ и R⁵ образуват заедно с прилежащия им въглерод карбонилна или тиокарбонилна група;

R⁶ е водород, C₁-C₄ алкил, C₁-C₄ халогеналкил, C₁-C₄ алкокси, C₁-C₄ алкокси-C₂-C₄

алкокси, C₁-C₄ халогеналкокси, C₃-C₆ алкенилокси, C₃-C₆ алкинилокси или NR⁷R⁸;

R⁷ е водород или C₁-C₄ алкил;

R⁸ е C₁-C₄ алкил;

X е O, S, NR⁹, CO или CR¹⁰R¹¹;

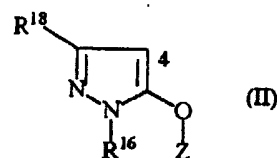
Y е O, S, NR¹², CO или CR¹³R¹⁴;

R⁹, R¹² са водород или C₁-C₄ алкил;

R¹⁰, R¹¹, R¹³, R¹⁴ са водород, C₁-C₄ алкил, C₁-C₄ халогеналкил, C₁-C₄ алкоксикарбонил, C₁-C₄ халогеналкоксикарбонил или CONR⁷R⁸; или

R⁴ и R⁹, или R⁴ и R¹⁰, или R⁵ и R¹², или R⁵ и R¹³ образуват заедно C₂-C₆ алкандиолова верига, която може да бъде едно- до четирикратно заместена с C₁-C₄ алкил и/или може да бъде прекъсната от кислород или в даден случай азот, заместен с C₁-C₄ алкил;

R¹⁵ означава свързан на 4 място пиразол с формула (II)



при което

R¹⁶ е C₁-C₄ алкил;

Z е H или SO₂R¹⁷;

R¹⁷ е C₁-C₄ алкил, C₁-C₄ халогеналкил, фенил или фенил, който е частично или напълно халогениран и/или носи една до три от следните групи:

нитро, циано, C₁-C₄ алкил, C₁-C₄ халогеналкил, C₁-C₄ алкокси или C₁-C₄ халогеналкокси;

R¹⁸ е водород или C₁-C₆ алкил;

при което X и Y не са едновременно кислород или сяра;

и с изключение на 4-[2-хлоро-3-(4,5-дихидроизоксазол-3-ил)-4-метилсулфонилбензоил]-1-етил-5-хидрокси-1H-пиразол, 4-[2-хлоро-3-(4,5-дихидроизоксазол-3-ил)-4-метилсулфонил-бензоил]-1,3-диметил-5-хидрокси-1H-пиразол, 4-[2-хлоро-3-(5-циано-4,5-дихидроизоксазол-3-ил)4-метилсулфонилбензоил]-1,3-диметил-5-хидрокси-1H-пиразол, 4-[2-хлоро-3-(4,5-дихидроизоксазол-2-ил)-4-метилсулфонилбензоил]-1,3-диметил-5-хидрокси-1H-пиразол и 4-[2-хлоро-3-(тиазолин-4,5-дион-2-ил)-4-метилсулфонил-бензоил]-1,3-диметил-5-хидрокси-1H-пиразол;

както и техните приемливи в земеделието соли.

Освен това, изобретението се отнася до метод и междинни продукти за получаването на съединенията с формула I, средства, които ги съдържат, както и използването на тези производни или на съдържащо ги средство за борба с вредни растения.

Предшестващо състояние на техниката

От литературата, например от WO 96/26206, са известни пиразол-4-ил-бензоилови производни.

Хербицидните свойства на известните досега съединения, както и поносимостта им от културните растения могат обаче само условно да бъдат удовлетворителни. Поради това, в основата на това изобретение лежи задачата да се намерят нови, по-специално хербицидно активни съединения с подобрени свойства.

Техническа същност на изобретението

Изобретението се отнася до 3-хетероциклизаместени бензоилови производни с формула I, както и до тяхното хербицидно действие.

Освен това изобретението се отнася до хербицидни средства, които съдържат съединенията (I) и притежават много добро хербицидно действие. Освен това изобретението се отнася и до методи за получаване на тези средства и до методи за борба с нежелано развитие на растения чрез съединенията с формула I.

Съединенията с формула I според вида на заместване могат да съдържат един или повече центрове на хиралност и тогава съществуват като енантиомерни или диастереомерни смеси. Предмет на изобретението са както чистите енантиомери или диастереомери, така и техните смеси.

Съединенията с формула I могат да съществуват също под формата на техните използвани в земеделието соли, при което по правило вида на солта не е от значение. Най-общо, се имат предвид соли с онези катиони или присъединителни с киселини соли с онези киселини, чиито катиони, съответно аниони не повлияват негативно хербицидното действие на съединенията с формула I.

Като катиони се имат предвид по-специално йоните на алкални метали, за предпочитане литий, натрий и калий, на алкалоземни метали, за предпочитане калций и магнезий и преходни метали за предпочитане манган, мед, цинк и желязо, както и амониеви, при което тук в даден случай един до четири водородни атома, могат да бъдат заместени с C_1-C_4 алкил, хидрокси- C_1-C_4 алкил, C_1-C_4 алкокси- C_1-C_4 ал-

кил, хидрокси- C_1-C_4 -алкокси- C_1-C_4 алкил, фенил или бензил, за предпочитане амоний, диметиламоний, диизопропиламоний, тетраметиламоний, тетрабутиламоний, 2-(2-хидроксиет-1-окси)ет-1-иламоний, ди(2-хидроксиет-1-ил)амоний, триметилбензиламоний, освен това фосфониеви йони, сулфониеви йони за предпочитане три-(C_1-C_4 алкил)сулфониеви и сулфоксониеви йони, за предпочитане три-(C_1-C_4 алкил)сулфоксониеви.

Анионите на използваемите присъединителни с киселини соли са на първо място хлорид, бромид, флуорид, хидрогенсулфат, сулфат, дихидрогенфосфат, хидрогенфосфат, нитрат, хидрогенкарбонат, карбонат, хексафлуоросиликат, хексафлуорофосфат, бензоат както и анионите на C_1-C_4 алканови киселини, за предпочитане формиат, ацетат, пропионат и бутират.

Споменатите органични молекулни части за заместителите $R^1 - R^{18}$ или като остатъци на фенилов пръстен представляват сборно понятие за индивидуалните изброявания на отделните членове на групите. Всичките въглеродни вериги, също всички части алкил, халогеналкил, цианоалкил, алкокси, халогеналкокси, алкилиминоокси, алкилкарбонилокси, алкилтио, халогеналкилтио, алкилсулфинил, халогеналкилсулфинил, алкилсулфонил, халогеналкилсулфонил, алкоксикарбонил, халогеналкоксикарбонил, алкенилокси, алкинилокси, диалкиламино, диалкилхидразино, алкоксиалкил, хидроксиалкоксиалкил, диалкоксиалкил, алкилтиоалкил, диалкиламиноалкил, диалкилхидразиноалкил, алкилиминооксиалкил, алкоксикарбонилалкил, и алкоксиалкокси могат да бъдат с права или разклонена верига. Доколкото не е посочено друго, халогенираните заместители носят за предпочитане един до пет еднакви или различни халогенни атома. Означението халоген се отнася за флуоро, хлоро, бромид или йодо.

Освен това означават например:

C_1-C_4 алкил: както алкиловата част на ди-(C_1-C_4 алкокси)- C_1-C_4 алкил, [2,2-ди-(C_1-C_4 алкил)хидразино-1]- C_1-C_4 алкил, C_1-C_6 алкилиминоокси- C_1-C_4 алкил, хидрокси- C_1-C_4 -алкокси- C_1-C_4 алкил и C_1-C_4 алкилкарбонилокси: например метил, етил, пропил, 1-метилетил, бутил, 1-метилпропил, 2-метилпропил и 1,1-диметилетил;

C_1-C_4 алкил: C_1-C_4 алкил както е назован по-горе, както напр. пентил, 1-метилбутил,

2-метилбутил, 3-метилбутил, 2,2-диметилпропил, 1-етилпропил, хексил, 1,1-диметилпропил, 1,2-диметилпропил, 1-метилпентил, 2-метилпентил, 3-метилпентил, 4-метилпентил, 1,1-диметилбутил, 1,2-диметилбутил, 1,3-диметилбутил, 2,2-диметилбутил, 2,3-диметилбутил, 3,3-диметилбутил, 1-етилбутил, 2-етилбутил, 1,1,2-триметилпропил, 1-етил-1-метилпропил, и 1-етил-3-метилпропил;

C_1-C_4 -халогеналкил: C_1-C_4 алкилов остатък, както е споменат по-горе, който е заместен частично или напълно с флуоро, хлоро, бромо и/или йодо, а също например хлорометил, дихлорометил, трихлорометил, флуорометил, дифлуорометил, трифлуорометил, хлорофлуорометил, дихлорофлуорометил, хлородифлуорометил, 2-флуоретил, 2-хлоретил, 2-брометил, 2-йодетил, 2,2-дифлуоретил, 2,2,2-трифлуоретил, 2-хлоро-2-флуоретил, 2-хлоро-2,2-дифлуоретил, 2,2-дихлоро-2-флуоретил, 2,2,2-трихлоретил, пентафлуоретил, 2-флуоропропил, 3-флуоропропил, 2,2-дифлуоропропил, 2,3-дифлуоропропил, 2-хлоропропил, 3-хлоропропил, 2,3-дихлоропропил, 2-бромопропил, 3-бромопропил, 3,3,3-трифлуоропропил, 3,3,3-трихлоропропил, 2,2,3,3,3-пентафлуоропропил, хептафлуоропропил, 1-(флуоро-метил)-2-флуоретил, 1-(хлорометил)-2-хлоретил, 1-(бромометил)-2-брометил, 4-флуоробутил, 4-хлоробутил, 4-бромобутил и нонафлуоробутил;

C_1-C_4 халогеналкил: C_1-C_4 халогеналкил, както е назован по-горе, както и например 5-флуоропентил, 5-хлоропентил, 5-бромопентил, 5-йодопентил, ундекафлуоропентил, 6-флуорохексил, 6-хлорохексил, 6-бромохексил, 6-йодохексил и додекафлуорохексил;

C_1-C_4 цианоалкил; например цианометил, 1-цианоет-1-ил, 2-цианоет-1-ил, 1-цианопроп-1-ил, 2-цианопроп-1-ил, 3-цианопроп-1-ил, 1-цианопроп-2-ил, 2-цианопроп-2-ил, 1-цианобут-1-ил, 2-цианобут-1-ил, 3-цианобут-1-ил, 4-цианобут-1-ил, 1-цианобут-2-ил, 2-цианобут-2-ил, 1-цианобут-3-ил, 2-циано-бут-3-ил, 1-циано-2-метил-проп-3-ил, 2-циано-2-метил-проп-3-ил, 3-циано-2-метил-проп-3-ил, и 2-цианометилпроп-2-ил;

C_1-C_4 алкокси: както и частта алкокси на ди- (C_1-C_4 алкокси)- C_1-C_4 алкил и хидрокси- C_1-C_4 -алкокси- C_1-C_4 алкил, напр. метокси, етокси, пропокси, 1-метилетокси, бутокси, 1-метил-пропокси, 2-метилпропокси и 1,1-диметилетокси;

C_1-C_6 алкокси: C_1-C_4 алкокси както е посочен по-горе, както и например пентокси, 1-метилбутокси, 2-метилбутокси, 3-метоксилбутокси, 1,1-диметилпропокси, 1,2-диметилпропокси, 2,2-диметилпропокси, 1-етилпропокси, хексокси, 1-метилпентокси, 2-метилпентокси, 3-метилпентокси, 4-метилпентокси, 1,1-диметилбутокси, 1,2-диметилбутокси, 1,3-диметилбутокси, 2,2-диметилбутокси, 2,3-диметилбутокси, 3,3-диметилбутокси, 1-етилбутокси, 2-етилбутокси, 1,1,2-триметилпропокси, 1,2,2-триметилпропокси. 1-етил-1-метилпропокси и 1-етил-2-метилпропокси;

C_1-C_4 халогеналкокси: C_1-C_4 алкоксиостатък както е посочен по-горе, който е заместен частично или напълно с флуоро, хлоро, бромо и/или йодо, също например флуорометокси, дифлуорометокси, трифлуорометокси, хлородифлуорометокси, бромодифлуорометокси, 2-флуоретокси, 2-хлоретокси, 2-брометокси, 2-йодетокси, 2,2-дифлуоретокси, 2,2,2-трифлуоретокси, 2-хлоро-2-флуоретокси, 2-хлоро-2,2-дифлуоретокси, 2,2-дихлоро-2-флуоретокси, 2,2,2-трихлоретокси, пентафлуоретокси, 2-флуоропропокси, 3-флуоропропокси, 2-хлоропропокси, 3-хлоропропокси, 2-бромопропокси, 3-бромопропокси, 2,2-дифлуоропропокси, 2,3-дифлуоропропокси, 2,3-дихлоропропокси, 3,3,3-трифлуоропропокси, 3,3,3-трихлоропропокси, 2,2,3,3,3-пентафлуоропропокси, хептафлуоропропокси, 1-(флуорометил)-2-флуоретокси, 1-(хлорометил)-2-хлоретокси, 1-(бромометил)-2-брометокси, 4-флуоробутокси, 4-хлоробутокси, 4-бромобутокси и нонафлуоробутокси;

C_1-C_6 халогеналкокси: C_1-C_4 халогеналкокси, както е посочен по-горе, както и напр. 5-флуоропентокси, 5-хлоропентокси, 5-бромопентокси, 5-йодопентокси, ундекафлуоропентокси, 6-флуорохексокси, 6-хлорохексокси, 6-бромохексокси, 6-йодохексокси и додекафлуорохексокси;

C_1-C_6 алкилиминоокси: както и C_1-C_4 алкилиминооксичастите на C_1-C_4 алкилиминоокси- C_1-C_4 алкил, напр. метилиминоокси, етилиминоокси, 1-пропилиминоокси, 2-пропилиминоокси, 1-бутилиминоокси, 2-бутилиминоокси, 2-метил-проп-1-илиминоокси, 1-пентилиминоокси, 2-пентилиминоокси, 3-пентилиминоокси, 3-метил-бут-2-илиминоокси, 2-метил-бут-1-илиминоокси, 3-метил-бут-1-илиминоокси, 1-хексилиминоокси, 2-хексил-имино-

окси, 3-хексилиминоокси, 2-метилпент-1-илиминоокси, 3-метилпент-1-илиминоокси, 4-метилпент-1-илиминоокси, 2-етилбут-1-илиминоокси, 3-етилбут-1-илиминоокси, 2,3-диметилбут-1-илиминоокси, 3-метилпент-2-илиминоокси, 4-метилпент-2-илиминоокси и 3,3-диметилбут-2-илиминоокси;

C_1-C_4 алкилтио: напр. метилтио, етилтио, пропилтио, 1-метилетилтио, бутилтио, 1-метилпропилтио, 2-метилпропилтио и 1,1-диметилетилтио;

C_1-C_6 алкилтио: C_1-C_4 алкилтио, както е посочен по-горе, както и напр. пентилтио, 1-метилбутилтио, 2-метилбутилтио, 3-метилбутилтио, 2,2-диметилпропилтио, 1-етилпропилтио, хексилтио, 1,1-диметилпропилтио, 1,2-диметилпропилтио, 1-метилпентилтио, 2-метилпентилтио, 3-метилпентилтио, 4-метилпентилтио, 1,1-диметилбутилтио, 1,2-диметилбутилтио, 1,3-диметилбутилтио, 2,2-диметилбутилтио, 2,3-диметилбутилтио, 3,3-диметилбутилтио, 1-етилбутилтио, 2-етилбутилтио, 1,1,2-триметилпропилтио, 1,2,2-триметилпропилтио, 1-етил-1-метилпропилтио и 1-етил-2-метилпропилтио;

C_1-C_4 халогеналкилтио: C_1-C_4 алкилтио-остатък както е дефиниран по-горе, който частично или напълно е заместен с флуоро, хлоро, бром и/или йодо, също например флуорометилтио, дифлуорометилтио, трифлуорометилтио, хлоридифлуорометилтио, бромодифлуорометилтио, 2-флуороетилтио, 2-хлороетилтио, 2-бромоетилтио, 2-йодоетилтио, 2,2-дифлуороетилтио, 2,2,2-трифлуороетилтио, 2,2,2-трихлороетилтио, 2-хлоро-2-флуороетилтио, 2-хлоро-2,2-дифлуороетилтио, 2,2-дихлоро-2-флуороетилтио, пентафлуороетилтио, 2-флуоропропилтио, 3-флуоропропилтио, 2-хлоропропилтио, 3-хлоропропилтио, 2-бромпропилтио, 3-бромпропилтио, 2,2-дифлуоропропилтио, 2,3-дифлуоропропилтио, 2,3-дихлоропропилтио, 3,3,3-трифлуоропропилтио, 3,3,3-трихлоропропилтио, 2,2,3,3,3-пентафлуоропропилтио, хептафлуоропропилтио, 1-(флуорометил)-2-флуороетилтио, 1-(хлорометил)-2-хлоро-етилтио, 1-(бромоетил)-2-бромоетилтио, 4-флуоробутилтио, 4-хлоробутилтио, 4-бромобутилтио и наофлуоробутилтио;

C_1-C_4 халогеналкилтио: C_1-C_4 халогеналкилтио както е дефиниран по-горе както и напр. 5-флуоропентилтио, 5-хлоропентилтио, 5-бромопентилтио, 5-йодопентилтио, ундекафлуоропентилтио, 6-флуорохексилтио, 6-хлорохек-

силтио, 6-бромохексилтио, 6-йодохексилтио и додекафлуорохексилтио;

C_1-C_6 алкилсулфинил (C_1-C_6 -алкил-S(=O)-): напр. метилсулфинил, етилсулфинил, пропилсулфинил, 1-метилетилсулфинил, бутилсулфинил, 1-метилпропилсулфинил, 2-метилпропилсулфинил, 1,1-диметилетилсулфинил, пентилсулфинил, 1-метилбутилсулфинил, 2-метилбутилсулфинил, 3-метилбутилсулфинил, 2,2-диметилпропилсулфинил, 1-етилпропилсулфинил, 1,1-диметилпропилсулфинил, 1,2-диметилпропилсулфинил, хексилсулфинил, 1-метилпентилсулфинил, 2-метилпентилсулфинил, 3-метилпентилсулфинил, 4-метилпентилсулфинил, 1,1-диметилбутилсулфинил, 1,2-диметилбутилсулфинил, 1,3-диметилбутилсулфинил, 2,2-диметилбутилсулфинил, 2,3-диметилбутилсулфинил, 3,3-диметилбутилсулфинил, 1-етилбутилсулфинил, 2-етилбутилсулфинил, 1,1,2-триметилпропилсулфинил, 1,2,2-триметилпропилсулфинил, 1-етил-1-метилпропилсулфинил и 1-етил-2-метилпропилсулфинил;

C_1-C_6 халогеналкилсулфинил: C_1-C_6 алкилсулфинилов остатък както е дефиниран по-горе, който частично или напълно е заместен с флуоро, хлоро, бром и/или йодо, също и напр. флуорометилсулфинил, дифлуорометилсулфинил, трифлуорометилсулфинил, хлоридифлуорометилсулфинил, бромодифлуорометилсулфинил, 2-флуороетилсулфинил, 2-хлороетилсулфинил, 2-бромоетилсулфинил, 2-йодоетилсулфинил, 2,2-дифлуороетилсулфинил, 2,2,2-трифлуороетилсулфинил, 2,2,2-трихлороетилсулфинил, 2-хлоро-2-флуороетилсулфинил, 2-хлоро-2,2-дифлуороетилсулфинил, 2,2-дихлоро-2-флуороетилсулфинил, пентафлуороетилсулфинил, 2-флуоропропилсулфинил, 3-флуоропропилсулфинил, 2-хлоропропилсулфинил, 3-хлоропропилсулфинил, 2-бромпропилсулфинил, 3-бромпропилсулфинил, 2,2-дифлуоропропилсулфинил, 2,3-дифлуоропропилсулфинил, 2,3-дихлоропропилсулфинил, 3,3,3-трифлуоропропилсулфинил, 3,3,3-трихлоропропилсулфинил, 2,2,3,3,3-пентафлуоропропилсулфинил, 1-(флуорометил)-2-флуороетилсулфинил, 1-(хлорометил)-2-хлороетилсулфинил, 1-(бромометил)-2-бромоетилсулфинил, 4-флуоробутилсулфинил, 4-хлоробутилсулфинил, 4-бромобутилсулфинил, наофлуоробутилсулфинил, 5-флуоропентилсулфинил, 5-хлоропентилсулфинил, 5-бромопентилсулфинил, 5-йодопентилсулфинил, ундекаф-

луоропентилсулфинил, 6-флуорохексилсулфинил, 6-хлорохексилсулфинил, 6-бромохексилсулфинил, 6-йодохексилсулфинил и додекафлуорохексилсулфинил;

C_1 - C_6 алкилсулфонил (C_1 - C_6 -алкил- $S(=O)_2$ -): напр. метилсулфонил, етилсулфонил, пропилсулфонил, 1-метилетилсулфонил, бутилсулфонил, 1-метилпропилсулфонил, 2-метилпропилсулфонил, 1,1-диметилетилсулфонил, пентилсулфонил, 1-метилбутилсулфонил, 2-метилбутилсулфонил, 3-метилбутилсулфонил, 1,1-диметилпропилсулфонил, 1,2-диметилпропилсулфонил, 2,2-диметилпропилсулфонил, 1-етилпропилсулфонил, хексилсулфонил, 1-метилпентилсулфонил, 2-метилпентилсулфонил, 3-метилпентилсулфонил, 4-метилпентилсулфонил, 1,1-диметилбутилсулфонил, 1,2-диметилбутилсулфонил, 1,3-диметилбутилсулфонил, 2,2-диметилбутилсулфонил, 2,3-диметилбутилсулфонил, 3,3-диметилбутилсулфонил, 1-етилбутилсулфонил, 2-етилбутилсулфонил, 1,1,2-триметилпропилсулфонил, 1,2,2-триметилпропилсулфонил, 1-етил-1-метилпропилсулфонил и 1-етил-2-метилпропилсулфонил;

C_1 - C_6 халогеналкилсулфонил: C_1 - C_6 алкилсулфонилов остатък както е дефиниран погоре, който частично или напълно е заместен с флуоро, хлоро, бромо и/или йодо, също напр. флуорометилсулфонил, дифлуорометилсулфонил, трифлуорометилсулфонил, хлородифлуорометилсулфонил, бромодифлуорометилсулфонил, 2-флуороетилсулфонил, 2-хлоретилсулфонил, 2-бромоетилсулфонил, 2-йодоетилсулфонил, 2,2-дифлуороетилсулфонил, 2,2,2-трифлуороетилсулфонил, 2-хлоро-2-флуороетилсулфонил, 2-хлоро-2,2-дифлуороетилсулфонил, 2,2-дихлоро-2-флуороетилсулфонил, 2,2,2-трихлороетилсулфонил, пентафлуороетилсулфонил, 2-флуоропропилсулфонил, 3-флуоропропилсулфонил, 2-хлоропропилсулфонил, 3-хлоропропилсулфонил, 2-бромопропилсулфонил, 3-бромопропилсулфонил, 2,2-дифлуоропропилсулфонил, 2,3-дифлуоропропилсулфонил, 2,3-дихлоропропилсулфонил, 3,3,3-трифлуоропропилсулфонил, 3,3,3-трихлоропропилсулфонил, 2,2,3,3,3-пентафлуоропропилсулфонил, хептафлуоропропилсулфонил, 1-(флуорометил)-2-флуороетилсулфонил, 1-(хлорометил)-2-хлороетилсулфонил, 1-(бромометил)-2-бромоетилсулфонил, 4-флуоробутилсулфонил, 4-хлоробутилсулфонил, 4-бромобутилсулфонил, нонафлуоробутилсулфонил, 5-флуоропентилсулфонил, 5-хло-

ропентилсулфонил, 5-бромопентилсулфонил, 5-йодопентилсулфонил, 6-флуорохексилсулфонил, 6-бромохексилсулфонил, 6-йодохексилсулфонил и додекафлуорохексилсулфонил;

C_1 - C_4 алкоксикарбонил: напр. метоксикарбонил, етоксикарбонил, пропоксикарбонил, 1-метилетоксикарбонил, бутоксикарбонил, 1-метилпропоксикарбонил, 2-метилпропоксикарбонил и 1,1-диметоксикарбонил;

C_1 - C_4 халогеналкоксикарбонил: C_1 - C_4 алкоксикарбонилов остатък, както е дефиниран погоре, който частично и напълно е заместен с флуоро, хлоро, бромо и/или йодо, също напр. флуорометоксикарбонил, дифлуорометоксикарбонил, трифлуорометоксикарбонил, хлородифлуорометоксикарбонил, бромодифлуорометоксикарбонил, 2-флуороетоксикарбонил, 2-хлороетоксикарбонил, 2-бромоетоксикарбонил, 2-йодоетоксикарбонил, 2,2-дифлуороетоксикарбонил, 2,2,2-трифлуороетоксикарбонил, 2-хлоро-2-флуороетоксикарбонил, 2-хлоро-2,2-дифлуороетоксикарбонил, 2,2-дихлоро-2-флуороетоксикарбонил, 2,2,2-трихлороетоксикарбонил, пентафлуороетоксикарбонил, 2-флуоропропоксикарбонил, 3-флуоропропоксикарбонил, 2-хлоропропоксикарбонил, 3-хлоропропоксикарбонил, 2-бромопропоксикарбонил, 3-бромопропоксикарбонил, 2,2-дифлуоропропоксикарбонил, 2,3-дифлуоропропоксикарбонил, 2,3-дихлоропропоксикарбонил, 3,3,3-трифлуоропропоксикарбонил, 3,3,3-трихлоропропоксикарбонил, 2,2,3,3,3-пентафлуоропропоксикарбонил, хептафлуоропропоксикарбонил, 1-(флуорометил)-2-флуороетоксикарбонил, 1-(хлорометил)-2-хлороетоксикарбонил, 1-(бромометил)-2-бромоетоксикарбонил, 4-флуоробутоксикарбонил, 4-хлоробутоксикарбонил, 4-бромобутоксикарбонил и 4-йодобутоксикарбонил;

C_3 - C_6 алкенилокси; например проп-1-ен-1-илокси, проп-2-ен-1-илокси, 1-метилетенилокси, бутен-1-илокси, бутен-2-илокси, бутен-3-илокси, 1-метил-проп-1-ен-1-илокси, 2-метил-проп-1-ен-1-илокси, 1-метил-проп-2-ен-1-илокси, 2-метил-проп-2-ен-1-илокси, пентен-1-илокси, пентен-2-илокси, пентен-3-илокси, пент-4-илокси, 1-метил-бут-1-ен-1-илокси, 2-метил-бут-1-ен-1-илокси, 3-метил-бут-1-ен-1-илокси, 1-метил-бут-2-ен-1-илокси, 2-метил-бут-2-ен-1-илокси, 3-метил-бут-2-ен-1-илокси, 1-метил-бут-3-ен-1-илокси, 2-метил-бут-3-ен-1-илокси, 3-метил-бут-3-ен-1-илокси, 1,1-диметил-проп-2-ен-1-илокси, 1,2-диметил-проп-1-ен-1-илокси,

1,2-диметил-проп-2-ен-1-илокси, 1-этил-проп-1-ен-2-илокси, 1-этил-проп-2-ен-1-илокси, гекс-1-ен-1-илокси, гекс-2-ен-1-илокси, гекс-3-ен-1-илокси, гекс-4-ен-1-илокси, гекс-5-ен-1-илокси, 1-метил-пент-1-ен-1-илокси, 2-метил-пент-1-ен-1-илокси, 3-метил-пент-1-ен-1-илокси, 4-метил-пент-1-ен-1-илокси, 1-метил-пент-2-ен-1-илокси, 2-метил-пент-2-ен-1-илокси, 3-метил-пент-2-ен-1-илокси, 4-метил-пент-2-ен-1-илокси, 1-метил-пент-3-ен-1-илокси, 2-метил-пент-3-ен-1-илокси, 3-метил-пент-3-ен-1-илокси, 4-метил-пент-3-ен-1-илокси, 1-метил-пент-4-ен-1-илокси, 2-метил-пент-4-ен-1-илокси, 3-метил-пент-4-ен-1-илокси, 4-метил-пент-4-ен-1-илокси, 1,1-диметил-бут-2-ен-1-илокси, 1,1-ди-метил-бут-3-ен-1-илокси, 1,2-диметил-бут-1-ен-1-илокси, 1,2-диметил-бут-2-ен-1-илокси, 1,2-диметил-бут-3-ен-1-илокси, 1,3-диметил-бут-1-ен-1-илокси, 1,3-диметил-бут-2-ен-1-илокси, 1,3-диметил-бут-3-ен-1-илокси, 2,2-диметил-бут-3-ен-1-илокси, 2,3-диметил-бут-1-ен-1-илокси, 2,3-диметил-бут-2-ен-1-илокси, 2,3-диметил-бут-3-ен-1-илокси, 3,3-диметил-бут-1-ен-1-илокси, 3,3-диметил-бут-2-ен-1-илокси, 1-этил-бут-1-ен-1-илокси, 1-этил-бут-2-ен-1-илокси, 1-этил-бут-3-ен-1-илокси, 2-этил-бут-1-ен-1-илокси, 2-этил-бут-2-ен-1-илокси, 2-этил-бут-3-ен-1-илокси, 1,1,2-триметил-проп-1-ен-1-илокси, 1-этил-1-метил-проп-2-ен-1-илокси, 1-этил-2-метил-проп-1-ен-1-илокси и 1-этил-2-метил-проп-2-ен-1-илокси;

C_3-C_6 алкинилокси: например проп-1-ин-1-илокси, проп-2-ин-1-илокси, бут-1-ин-1-илокси, бут-1-ин-3-илокси, бут-1-ин-4-илокси, бут-2-ин-1-илокси, пент-1-ин-1-илокси, пент-1-ин-3-илокси, пент-1-ин-4-илокси, пент-1-ин-5-илокси, пент-2-ин-1-илокси, пент-2-ин-4-илокси, пент-2-ин-5-илокси, 3-метил-бут-1-ин-3-илокси, 3-метил-бут-1-ин-4-илокси, гекс-1-ин-1-илокси, гекс-1-ин-3-илокси, гекс-1-ин-4-илокси, гекс-1-ин-5-илокси, гекс-1-ин-6-илокси, гекс-2-ин-1-илокси, гекс-2-ин-4-илокси, гекс-2-ин-5-илокси, гекс-2-ин-6-илокси, гекс-3-ин-1-илокси, гекс-3-ин-2-илокси, 3-метилпент-1-ин-1-илокси, 3-метил-пент-1-ин-3-илокси, 3-метил-пент-1-ин-4-илокси, 3-метил-пент-1-ин-5-илокси, 4-метил-пент-1-ин-1-илокси, 4-метил-пент-2-ин-4-илокси и 4-метилпент-2-ин-5-илокси;

Ди- (C_1-C_4) алкил)амино: например N,N-диметиламино, N,N-диетиламино, N,N-дипропиламино, N,N-ди-(1-метилетил)-амино, N,N-дибутиламино, N,N-ди-(1-метилпропил)амино, N,N-ди-(2-метилпропил)амино, N,N-ди-(1,1-ди-

метилетил)амино, N-этил-N-метиламино, N-метил-N-пропиламино, N-метил-N-(1-метилетил)-амино, N-бутил-N-метиламино, N-метил-N-(1-метилпропил)амино, N-метил-N-(2-метилпропил)амино, N-(1,1-диметилетил)-N-метиламино, N-этил-N-пропиламино, N-этил-N-(1-метилетил)-амино, N-бутил-N-етиламино, N-этил-N-(1-метилпропил)амино, N-этил-N-(2-метилпропил)амино, N-этил-N-(1,1-диметилетил)амино, N-(1-метилетил)-N-пропиламино, N-бутил-N-пропиламино, N-(1-метилпропил)-N-пропиламино, N-(2-метилпропил)-N-пропиламино, N-(1,1-диметилетил)-N-пропиламино, N-бутил-N-(1-метилетил)амино, N-(1-метилетил)-N-(1-метилпропил)амино, N-(1-метилетил)-N-(2-метилпропил)амино, N-(1,1-диметилетил)-N-(1-метилетил)амино, N-бутил-N-(1-метилпропил)амино, N-бутил-N-(2-метилпропил)амино, N-(1-метилпропил)-N-(2-метилпропил)амино, N-(1,1-диметилетил)-N-(1-метилпропил)амино и N-(1,1-диметилетил)-N-(2-метилпропил)амино;

[2,2-Ди- (C_1-C_4) -алкил)хидразино-1], как-то и диалкилхидразиночасти на [2,2-ди- (C_1-C_4) -алкил)хидразино-1]- C_1-C_4 алкил; например 2,2-диметилхидразино-1,2,2-диэтилхидразино-1, 2,2-дипропилхидразино-1, 2,2-ди-(1-метилетил)хидразино-1, 2,2-дибутилхидразино-1, 2,2-ди-(1-метилпропил)хидразино-1, 2,2-ди-(1,1-диметилетил)хидразино-1, 2-этил-2-метилхидразино-1, 2-метил-2-пропилхидразино-1, 2-метил-2-(1-метилетил)хидразино-1, 2-бутил-2-метилхидразино-1, 2-метил-2-(1-метилпропил)-хидразино-1, 2-метил-2-(2-метилпропил)хидразино-1, 2-(1,1-диметилетил)-2-метилхидразино-1, 2-этил-2-пропилхидразино-1, 2-этил-2-(1-метилетил)хидразино-1, 2-бутил-2-этилхидразино-1, 2-этил-2-(1-метилпропил)хидразино-1, 2-этил-2-(1,1-диметилетил)хидразино-1, 2-(1-метилетил)-2-пропилхидразино-1, 2-бутил-2-пропилхидразино-1, 2-(1-метилпропил)-2-пропилхидразино-1, 2-(1,1-диметилетил)-2-пропилхидразино-1, 2-бутил-2-(1-метилетил)хидразино-1, 2-(метилетил)-2-(1-метилпропил)хидразино-1, 2-(1-метилетил)-2-(2-метилпропил)хидразино-1, 2-(1,1-диметилетил)-2-(1-метилетил)хидразино-1, 2-бутил-2-(1-метилпропил)хидразино-1, 2-бутил-2-(2-метилпропил)хидразино-1, 2-бутил-2-(1,1-

диметилетил) хидразино-1, 2-(1-метилпропил)-2-(2-метилпропил) хидразино-1, 2-(1,1-диметилетил)-2-(1-метилпропил) хидразино-1 и 2-(1,1-диметилетил)-2-(2-метилпропил) хидразино-1;

Ди-(C₁-C₄ алкил)амино-C₁-C₄ алкил: C₁-C₄ алкил заместен с ди-(C₁-C₄ алкил)амино както е дефиниран по-горе също и напр. N,N-диметиламинометил, N,N-диетиламинометил, N,N-дипропиламинометил, N,N-ди-(1-метилетил)аминометил, N,N-дибутиламинометил, N,N-ди-(1-метилпропил)аминометил, N,N-ди-(2-метилпропил)аминометил, N,N-ди-(1,1-диметилетил)аминометил, N-етил-N-метиламинометил, N-метил-N-пропиламинометил, N-метил-N-(1-метилетил)аминометил, N-бутил-N-метиламинометил, N-метил-N-(1-метилпропил)аминометил, N-метил-N-(2-метилпропил)аминометил, N-(1,1-диметилетил)-N-метиламинометил, N-етил-N-пропиламинометил, N-етил-N-(1-метилетил)аминометил, N-бутил-N-етиламинометил, N-етил-N-(1-метилпропил)аминометил, N-етил-N-(2-метилпропил)аминометил, N-етил-N-(1,1-диметилетил)аминометил, N-(1-метилетил)-N-пропиламинометил, N-бутил-N-пропиламинометил, N-(1-метилпропил)-N-пропиламинометил, N-(2-метилпропил)-N-пропиламинометил, N-(1,1-диметилетил)-N-пропиламинометил, N-бутил-N-(1-метилетил)аминометил, N-(1-метилетил)-N-(1-метилпропил)аминометил, N-(1-метилетил)-N-(2-метилпропил)аминометил, N-(1,1-диметилетил)-N-(1-метилетил)аминометил, N-бутил-N-(1-метилпропил)аминометил, N-бутил-N-(2-метилпропил)аминометил, N-бутил-N-(1,1-диметилетил)аминометил, N-(1-метилпропил)-N-(2-метилпропил)аминометил, N-(1,1-диметилетил)-N-(1-метилпропил)аминометил, N-(1,1-диметилетил)-N-(2-метилпропил)аминометил, 2-(N,N-диметиламино)етил, 2-(N,N-диетиламино)етил, 2-(N,N-дипропиламино)етил, 2-[N,N-ди-(1-метилетил)амино]етил, 2-[N,N-дибутиламино]етил, 2-[N,N-ди-(1-метилпропил)амино]етил, 2-[N,N-ди-(2-метилпропил)амино]етил, 2-[N,N-ди-(1,1-диметилетил)амино]етил, 2-[N-етил-N-метиламино]етил, 2-[N-метил-N-пропиламино]етил, 2-[N-метил-N-(1-метилетил)амино]етил, 2-[N-метил-N-(2-метилпропил)амино]етил, 2-[N-(1,1-диметилетил)-N-метиламино]етил, 2-[N-етил-N-пропиламино]етил, 2-[N-етил-N-(1-метилетил)амино]етил, 2-[1N-бутил-N-етиламино]етил,

2-[N-етил-N-(1-метилпропил)амино]етил, 2-[N-етил-N-(2-метилпропил)амино]етил, 2-[N-етил-N-(1,1-диметилетиламино)етил, 2-[N-(1-метилетил)-N-пропиламино]етил, 2-(N-бутил-N-пропиламино)етил, 2-[N-(1-метилпропил)-N-пропиламино]етил, 2-[N-(2-метилпропил)-N-пропиламино]етил, 2-[N-(1,1-диметилетил)-N-пропиламино]-етил, 2-[N-бутил-N-(1-метилетил)амино]етил, 2-[N-(1-метилетил)-N-(1-метилпропил)амино]етил, 2-[N-(1-метилетил)-N-(2-метилпропил)амино]етил, 2-[N-(1,1-диметилетил)-N-(1-метилетил)амино]етил, 2-[N-бутил-N-(1-метилпропил)амино]етил, 2-[N-бутил-N-(2-метилпропил)амино]етил, 2-[N-бутил-N-(1,1-диметилетил)амино]етил, 2-[N-(1-метилпропил)-N-(2-метилпропил)амино]етил, 2-[N-(1,1-диметилетил)-N-(1-метилпропил)амино]етил, 2-[N-(1,1-диметилетил)-N-(2-метилпропил)амино]етил, 3-(N,N-диметиламино)пропил, 3-(N,N-диетиламино)пропил, 4-(N,N-диметиламино)бутил и 4-(N,N-диетиламино)бутил;

C₁-C₄ алкокси-C₁-C₄ алкил: C₁-C₄ алкил заместен с C₁-C₄ алкокси както е дефиниран по-горе, също напр. метоксиметил, етоксиметил, пропоксиметил, (1-метилетокси)метил, бутоксиметил, (1-метилпропокси)метил, (2-метилпропокси)метил, (1,1-диметилетокси)метил, 2-(метокси)етил, 2-(етокси)етил, 2-(пропокси)етил, 2-(1-метилетокси)етил, 2-(бутокси)етил, 2-(1-метилпропокси)етил, 2-(2-метилпропокси)-етил, 2-(1,1-диметилетокси)етил, 2-(метокси)пропил, 2-(етокси)пропил, 2-(пропокси)пропил, 2-(1-метилетокси)пропил, 2-(бутокси)пропил, 2-(1-метилпропокси)пропил, 2-(2-метилпропокси)пропил, 2-(1,1-диметилетокси)пропил, 3-(метокси)пропил, 3-(етокси)пропил, 3-(пропокси)пропил, 3-(1-метилетокси)пропил, 3-(бутокси)пропил, 3-(1-метилпропокси)-пропил, 3-(2-метилпропокси)пропил, 3-(1,1-диметилетокси)-пропил, 2-(метокси)бутил, 2-(етокси)бутил, 2-(пропокси)бутил, 2-(1-метилетокси)бутил, 2-(бутокси)бутил, 2-(1-метилпропокси)-бутил, 2-(2-метилпропокси)бутил, 2-(1,1-диметилетокси)бутил, 3-(метокси)бутил, 3-(етокси)бутил, 3-(пропокси)бутил, 3-(1-метилетокси)бутил, 3-(бутокси)бутил, 3-(1-метилпропокси)бутил, 3-(2-метилпропокси)бутил, 3-(1,1-диметилетокси)бутил, 4-(метокси)бутил, 4-(етокси)бутил, 4-(пропокси)бутил, 4-(1-метилетокси)бутил, 4-(бутокси)бутил, 4-(1-метилпропокси)бутил, 4-(2-метилпропокси)бутил и 4-(1,1-диметилетокси)бутил;

C_1-C_4 алкилтио- C_1-C_4 алкил: C_1-C_4 алкил заместен с C_1-C_4 алкилтио както е дефиниран по-горе, също напр. метилтио метил, етилтиометил, пропилтиометил, (1-метилетилтио)метил, бутилтиометил, (1-метилпропилтио)метил, (2-метилпропилтио)метил, (1,1-диметилетилтио)метил, 2-метилтиоетил, 2-етилтиоетил, 2-(пропилтио)етил, 2-(1-метилетилтио)етил, 2-(бутилтио)етил, 2-(1-метилпропилтио)етил, 2-(2-метилпропилтио)етил, 2-(1,1-диметилетилтио)етил, 2-(метилтио)пропил, 3-(метилтио)пропил, 2-(етилтио)пропил, 3-(етилтио)пропил, 3-(пропилтио)пропил, 3-(бутилтио)пропил, 4-(метилтио)бутил, 4-(етилтио)бутил, 4-(пропилтио)бутил и 4-(бутилтио)бутил;

C_1-C_4 алкоксикарбонил- C_1-C_4 алкил: C_1-C_4 алкил заместен с C_1-C_4 алкоксикарбонил както е дефиниран по-горе, също метоксикарбонилметил, етоксикарбонилметил, пропоксикарбонилметил, (1-метилетоксикарбонил)метил, бутоксикарбонилметил, (1-метилпропоксикарбонил)метил, (2-метилпропоксикарбонил)метил, (1,1-диметилетоксикарбонил)метил, 2-(метоксикарбонил)етил, 2-(етоксикарбонил)етил, 2-(пропоксикарбонил)етил, 2-(1-метилетоксикарбонил)етил, 2-(бутоксикарбонил)етил, 2-(1-метилпропоксикарбонил)етил, 2-(2-метилпропоксикарбонил)етил, 2-(1,1-диметилетоксикарбонил)етил, 2-(метоксикарбонил)пропил, 2-(етоксикарбонил)пропил, 2-(пропоксикарбонил)пропил, 2-(1-метилетоксикарбонил)пропил, 2-(бутоксикарбонил)пропил, 2-(1-метилпропоксикарбонил)пропил, 2-(2-метилпропоксикарбонил)пропил, 2-(1,1-диметилетоксикарбонил)пропил, 3-(метоксикарбонил)пропил, 3-(етоксикарбонил)пропил, 3-(пропоксикарбонил)пропил, 3-(1-метилетоксикарбонил)пропил, 3-(бутоксикарбонил)пропил, 3-(1-метилпропоксикарбонил)пропил, 3-(2-метилпропоксикарбонил)пропил, 3-(1,1-диметилетоксикарбонил)пропил, 2-(метоксикарбонил)бутил, 2-(етоксикарбонил)бутил, 2-(пропоксикарбонил)бутил, 2-(1-метилетоксикарбонил)бутил, 2-(бутоксикарбонил)бутил, 2-(1-метилпропоксикарбонил)бутил, 2-(2-метилпропоксикарбонил)бутил, 2-(1,1-диметилетоксикарбонил)бутил, 3-(метоксикарбонил)бутил, 3-(етоксикарбонил)бутил, 3-(пропоксикарбонил)бутил, 3-(1-метилетоксикарбонил)бутил, 3-(бутоксикарбонил)бутил, 3-(1-метилпропоксикарбонил)бутил, 3-(2-метилпропоксикарбонил)бутил, 3-(1,1-диметилетоксикарбонил)бутил, 4-(метоксикарбо-

нил)бутил, 4-(етоксикарбонил)бутил, 4-(пропоксикарбонил)бутил, 4-(1-метилетоксикарбонил)бутил, 4-(бутоксикарбонил)бутил, 4-(1-метилпропоксикарбонил)бутил, 4-(2-метилпропоксикарбонил)бутил, 4-(1,1-диметилетоксикарбонил)бутил;

C_1-C_4 алкокси- C_2-C_4 алкокси: C_1-C_4 алкокси заместен с C_1-C_4 алкокси както е дефиниран по-горе, също напр. 2-(метокси)етокси, 2-(етокси)етокси, 2-(пропоксикарбонил)етокси, 2-(1-метилетокси)етокси, 2-(бутоксикарбонил)етокси, 2-(1-метилпропоксикарбонил)етокси, 2-(1,1-диметилетокси)етокси, 2-(метокси)пропоксикарбонил, 2-(пропоксикарбонил)пропоксикарбонил, 2-(1-метилетокси)пропоксикарбонил, 2-(2-метилпропоксикарбонил)пропоксикарбонил, 2-(1,1-диметилетокси)пропоксикарбонил, 3-(метокси)пропоксикарбонил, 3-(етокси)пропоксикарбонил, 3-(пропоксикарбонил)пропоксикарбонил, 3-(1-метилетокси)пропоксикарбонил, 3-(бутоксикарбонил)пропоксикарбонил, 3-(1-метилпропоксикарбонил)пропоксикарбонил, 3-(2-метилпропоксикарбонил)пропоксикарбонил, 3-(1,1-диметилетокси)пропоксикарбонил, 2-(метокси)бутоксикарбонил, 2-(етокси)бутоксикарбонил, 2-(пропоксикарбонил)бутоксикарбонил, 2-(1-метилетокси)бутоксикарбонил, 2-(бутоксикарбонил)бутоксикарбонил, 2-(1-метилпропоксикарбонил)бутоксикарбонил, 2-(2-метилпропоксикарбонил)бутоксикарбонил, 2-(1,1-диметилетокси)бутоксикарбонил, 3-(метокси)бутоксикарбонил, 3-(етокси)бутоксикарбонил, 3-(пропоксикарбонил)бутоксикарбонил, 3-(1-метилетокси)бутоксикарбонил, 3-(бутоксикарбонил)бутоксикарбонил, 3-(1-метилпропоксикарбонил)бутоксикарбонил, 3-(2-метилпропоксикарбонил)бутоксикарбонил, 4-(метокси)бутоксикарбонил, 4-(етокси)бутоксикарбонил, 4-(пропоксикарбонил)бутоксикарбонил, 4-(1-метилетокси)бутоксикарбонил, 4-(бутоксикарбонил)бутоксикарбонил, 4-(1-метилпропоксикарбонил)бутоксикарбонил и 4-(1,1-диметилетокси)бутоксикарбонил;

C_2-C_6 алкандиил: напр. етан-1,2-диил, пропан-1,3-диил, бутан-1,4-диил, пентан-1,5-диил, и хексан-1,6-диил;

C_3-C_6 -циклоалкил: напр. циклопропил, циклобутил, циклопентил, циклохекеил, циклохептил или циклооктил;

Всички фенилови пръстени са за предпочитане незаместени или носят един до три халогенни атома/или нитрогрупа, цианов остатък и/или един или два заместителя метил, трифлуорметил, метокси или трифлуорметокси.

Предпочитани са 3-хетероцикллизаместените бензоилови производни с формула I, в която заместителите имат следните значения:

R^1 , R^2 са водород, нитро, халоген, циано, C_1-C_6 алкил, C_1-C_6 халогеналкил, C_1-C_6 алкокси, C_1-C_6 халогеналкокси, C_1-C_6 алкил-

тио, C₁-C₆ халогеналкилтио, C₁-C₆ алкилсулфинил, C₁-C₆ халогеналкилсулфинил, C₁-C₆ алкилсулфонил или C₁-C₆ халогеналкилсулфонил;

R³ е водород, халоген или C₁-C₆ алкил;

R⁴, R⁵ са водород, халоген, циано, нитро, C₁-C₄ алкил, C₁-C₄ алкокси-C₁-C₄ алкил, ди-(C₁-C₄ алкокси) C₁-C₄ алкил, ди-(C₁-C₄ алкил)амино-C₁-C₄ алкил, [2,2-ди-(C₁-C₄ алкил)хидразино-1]-C₁-C₄ алкил, C₁-C₆ алкилиминоокси-C₁-C₄ алкил, C₁-C₄ алкоксикарбонил-C₁-C₄ алкил, C₁-C₄ алкилтио-C₁-C₄ алкил, C₁-C₄-халогеналкил, C₁-C₄ цианоалкил, C₃-C₈ циклоалкил, C₁-C₄ алкокси, C₁-C₄ алкокси-C₂-C₄ алкокси, C₁-C₄ халогеналкокси, C₁-C₄ алкилтио, C₁-C₄ халогеналкилтио, ди-(C₁-C₄-алкил)амино, COR⁶, фенил или бензил, при което двата последни заместители могат да бъдат частично или напълно халогенирани и/или могат да носят една до три от следните групи: нитро, циано, C₁-C₄ алкил, C₁-C₄ халогеналкил, C₁-C₄ алкокси или C₁-C₄ халогеналкокси; или

R⁴ и R⁵ образуват заедно C₂-C₆ алкандилова верига, която може да бъде еднократно до четирикратно заместена с C₁-C₄ алкил и/или да бъде прекъсната с кислород или азот в даден случай заместен с C₁-C₆ алкил; или

R⁴ и R⁵ образуват заедно с въглеродния атом, с който са свързани карбонилна или тиокарбонилна група;

R⁶ C₁-C₄ алкил, C₁-C₄ халогеналкил, C₁-C₄ алкокси, C₁-C₄ алкокси-C₂-C₄ алкокси, C₁-C₄ халогеналкокси, C₃-C₆ алкенилокси, C₃-C₆ алкинилокси или NR⁷R⁸;

R⁷ е водород или C₁-C₄ алкил;

R⁸ C₁-C₄ алкил;

X е O, S, NR⁹, CO или CR¹⁰R¹⁴;

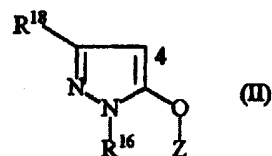
Y е O, S, NR¹², CO или CR¹³R¹⁴;

R⁹, R¹² са водород или C₁-C₄ алкил;

R¹⁰, R¹¹, R¹³, R¹⁴ са водород, C₁-C₄ алкил, C₁-C₄ халогеналкил, C₁-C₄ алкоксикарбонил, C₁-C₄ халогеналкоксикарбонил или CONR⁷R⁸; или

R⁴ и R⁹, или R⁴ и R¹⁰, или R⁵ и R¹², или R⁵ и R¹³ образуват заедно C₂-C₆ алкандилова верига, която може да бъде заместена еднократно до четирикратно със C₁-C₄ алкил и/или може да бъде прекъсната с кислород или азот, в даден случай заместен с C₁-C₄ алкил;

R¹⁵ е свързан на 4-място пиразол с формула (II)



в която

R¹⁶ означава C₁-C₆ алкил;

Z е H или SO₂R¹⁷;

R¹⁷ е C₁-C₄ алкил, C₁-C₄ халогеналкил,

10 фенил или фенил, който е частично или напълно халогениран и/или носи една до три от следните групи: нитро, циано, C₁-C₄ алкил, C₁-C₄ халогеналкил, C₁-C₄ алкокси или C₁-C₄ халогеналкокси;

15 R¹⁸ е водород или C₁-C₆ алкил,

при което X и Y не означават едновременно кислород или сяра; и с изключение на 4-[2-хлоро-3-(4,5-дихидроизоксазол-3-ил)-4-метилсулфонилбензоил]-1-етил-5-хидрокси-1H-пиразол, 4-[2-хлоро-3-(4,5-дихидроизоксазол-3-ил)-4-метилсулфонилбензоил]-1,3-диметил-5-хидрокси-1H-пиразол, 4-[2-хлоро-3-(5-циано-4,5-дихидроизоксазол-3-ил)-4-метилсулфонилбензоил]-1,3-диметил-5-хидрокси-1H-пиразол, 4-[2-хлоро-3-(4,5-дихидроотиазол-2-ил)-4-метилсулфонилбензоил]-1,3-диметил-5-хидрокси-1H-пиразол и 4-[2-хлоро-3-(тиазолин-4,5-дион-2-ил)-4-метилсулфонилбензоил]-1,3-диметил-5-хидрокси-1H-пиразол;

30 както и техните приложими в земеделието соли.

С оглед на използването на съединенията съгласно изобретението с формула I като хербициди, заместителите имат за предпочитане следните значения, а именно самостоятелно или в комбинация:

R¹, R² са нитро, халоген, циано, C₁-C₆ алкил, C₁-C₆ халогеналкил, C₁-C₆ алкокси, C₁-C₆ халогеналкокси, C₁-C₆ алкилтио, C₁-C₆ халогеналкилтио, C₁-C₆ алкилсулфинил, C₁-C₆ халогеналкилсулфинил, C₁-C₆ алкилсулфонил или C₁-C₆ халогеналкилсулфонил;

особено се предпочитат нитро, халоген, като например хлоро и бромо, C₁-C₆ алкил като напр. метил и етил, C₁-C₆ алкокси като напр. метокси и етокси, C₁-C₆ халогеналкил като напр. дифлуорометил и трифлуорометил, C₁-C₆ алкилтио като напр. метилтио и етилтио, C₁-C₆ алкилсулфинил като напр. метилсулфинил и етилсулфинил, C₁-C₆ алкилсулфонил ка-

то напр. метилсулфонил, етилсулфонил и пропилсулфонил или C_1-C_6 халогеналкилсулфонил като напр. трифлуорометилсулфонил и пентафлуороетилсулфонил;

R^3 е водород;

R^4 , R^5 са водород, халоген, циано, нитро, C_1-C_4 алкил, C_1-C_4 алкокси- C_1-C_4 алкил, ди-(C_1-C_4 алкокси)- C_1-C_4 алкил, ди-(C_1-C_4 алкил)амино- C_1-C_4 алкил, [2,2-ди-(C_1-C_4 алкил)хидразино-1]- C_1-C_4 алкил, C_1-C_6 алкилиминоокси- C_1-C_4 алкил, C_1-C_6 -алкоксикарбонил- C_1-C_4 алкил, C_1-C_4 алкилтио- C_1-C_4 алкил, C_1-C_4 халогеналкил, C_1-C_4 цианоалкил, C_3-C_8 циклоалкил, C_1-C_4 алкокси, C_1-C_4 алкокси- C_2-C_4 алкокси, C_1-C_4 халогеналкокси, C_1-C_4 алкилтио, C_1-C_4 халогеналкилтио, ди-(C_1-C_4 алкил)амино, COR^6 , фенил или бензил, при което двата последни заместители могат да бъдат частично или напълно халогенирани и/или да носят една до три от следните групи: нитро, циано, C_1-C_4 алкил, C_1-C_4 халогеналкил, C_1-C_4 алкокси или C_1-C_6 халогеналкокси; или

R^4 и R^5 образуват заедно C_2-C_6 алкандилова верига, която може да бъде едно- до четирикратно заместена с C_1-C_4 алкил и/или може да бъде прекъсната с кислород или азот, заместен в даден случай с C_1-C_4 алкил;

особено за предпочитане R^4 означава водород, C_1-C_4 алкил, C_1-C_4 халогеналкил, C_1-C_4 алкоксикарбонил или $CONR^7R^8$;

особено за предпочитане R^5 означава водород или C_1-C_4 алкил; или

особено за предпочитане R^4 и R^5 образуват C_2-C_6 алкандилова верига, която може да бъде заместена еднократно до четирикратно с C_1-C_4 алкил и/или може да бъде прекъсната с кислород или с азот, в даден случай заместен с C_1-C_4 алкил;

R^6 е C_1-C_4 алкил, C_1-C_4 алкокси или NR^7R^8 ;

R^7 е водород или C_1-C_4 алкил;

R^8 е C_1-C_4 алкил;

X е O , S , NR^9 , CO или $CR^{10}R^{11}$;

Y е O , S , NR^{12} или $CR^{13}R^{14}$;

R^9 , R^{11} са водород или C_1-C_4 алкил;

R^{10} , R^{11} , R^{13} , R^{14} са водород, C_1-C_4 алкил, C_1-C_4 халогеналкил, C_1-C_4 алкоксикарбонил, C_1-C_4 халогеналкоксикарбонил или $CONR^7R^8$; или

R^4 и R^9 , или R^4 и R^{10} , или R^5 и R^{12} , или R^5 и R^{13} образуват заедно C_2-C_6 алкандилова верига, която може да бъде заместена еднократно до четирикратно с C_1-C_4 алкил и/или може

да бъде прекъсната с кислород или азот, в даден случай заместен с C_1-C_4 алкил;

R^{16} е C_1-C_6 алкил; особено са предпочитани метил, етил, пропил, 2-метилпропил или

5 бутил;

Z е H или SO_2R^{17} ;

R^{17} е C_1-C_4 алкил, фенил или фенил, който е частично или напълно халогениран и/или носи една до три от следните групи: нитро, циано, C_1-C_4 алкил, C_1-C_4 халогеналкил, C_1-C_4 алкокси или C_1-C_4 халогеналкокси;

R^{18} е водород или C_1-C_6 алкил; особено се предпочитат водород или метил.

Изобретението има следните форми на изпълнение на 3-хетероциклилзаместени бензоилови производни с формула I;

1. В една предпочитана форма на изпълнение на 3-хетероциклилзаместени бензоилови производни с формула I, Z означава SO_2R^{17} .

- Особено предпочитани при това са 3-хетероциклилзаместени бензоилови производни с формула I, в която R^{18} означава водород.

- Също така особено предпочитани са при това 3-хетероциклилзаместени бензоилови производни с формула I в която R^{18} означава метил.

Особено предпочитани са при това 3-хетероциклилзаместени бензоилови производни с формула I, в която R^{17} означава C_1-C_4 алкил.

2. В друга предпочитана форма на изпълнение на 3-хетероциклилзаместени бензоилови производни с формула I, Z означава водород.

- Особено предпочитани са при това 3-хетероциклил-заместени бензоилови производни с формула I, в която X означава кислород и Y е $CR^{13}R^{14}$.

Специално предпочитани са при това 3-хетероциклилзаместени бензоилови производни с формула I в която:

R^4 означава халоген, нитро, C_1-C_4 алкил, C_1-C_4 алкокси- C_1-C_4 алкил, C_1-C_4 алкоксикарбонил- C_1-C_4 алкил, C_1-C_4 -алкилтио, C_1-C_4 алкил, C_1-C_4 халогеналкил, C_1-C_4 цианоалкил, C_3-C_8 пиклоалкил, C_1-C_4 алкокси, C_1-C_4 алкокси- C_2-C_4 алкокси, C_1-C_4 халогеналкокси, C_1-C_4 алкилтио, C_1-C_4 халогеналкилтио, ди- (C_1-C_4 алкил)амино, COR^6 , фенил или бензил, при което двата последни заместители могат да бъдат частични или напълно халогенирани и/или да носят една до три от следните групи: нитро, циано, C_1-C_4 алкил, C_1-C_4 халогеналкил, C_1-C_4 алкокси или C_1-C_4 халогеналкокси;

R^5 е водород или C_1-C_4 алкил; или

R^4 и R^5 образуват заедно C_2-C_6 алкандиолова верига, която може да бъде заместена еднократно до четирикратно с C_1-C_4 алкил и/или може да бъде прекъсната с кислород или азот, в даден случай заместен с C_1-C_4 алкил; или

R^5 и R^{13} образуват заедно алкандиолова верига, която може да бъде еднократно до четирикратно заместен с C_1-C_4 алкил и/или да бъде прекъсната с кислород или азот, в даден случай заместен с C_1-C_4 алкил.

Извънредно предпочитани са при това 3-хетероциклизаместени бензоилови производни с формула I, в която

R^4 означава C_1-C_4 алкил, C_1-C_4 халогеналкил, C_1-C_4 алкоксикарбонил или $CONR^2R^3$;

R^5 е водород или C_1-C_4 алкил; или

R^4 и R^5 образуват заедно C_2-C_6 алкандиолова верига, която може да бъде заместена еднократно до четирикратно с C_1-C_4 алкил и/или може да бъде прекъсната с кислород или азот, в даден случай заместен с C_1-C_4 алкил; или

Особено извънредно предпочитани са при това 3-хетероциклизаместени бензоилови производни с формула I, в която R^{18} означава водород.

* Също така особено предпочитани са при това и 3-хетероциклизаместени бензоилови производни с формула I, в която R^4 и R^5 означават водород.

Извънредно предпочитани са при това 3-хетероциклизаместени бензоилови производни с формула I, в която R^8 означава водород.

Особено извънредно предпочитани са при това 3-хетероциклизаместени бензоилови производни с формула I, в която

R^1 означава нитро, C_1-C_6 алкил, като напр. метил и етил, C_1-C_6 алкокси като например метокси и етокси, C_1-C_6 халогеналкил като например дифлуорометил и трифлуорометил, C_1-C_6 алкилсулфонил като напр. метилсулфонил, етилсулфонил и пропилсулфонил или C_1-C_6 халогеналкилсулфонил напр. трифлуорометилсулфонил и пентафлуороетилсулфонил;

Също така особено извънредно предпочитани са при това 3-хетероциклизаместени бензоилови производни с формула I, в която

R^2 означава нитро, халоген като напр. хлоро и бромо, C_1-C_6 алкил като напр. метил и етил, C_1-C_6 халогеналкил като напр. дифлуорометил и трифлуорометил, C_1-C_6 алкилтио като напр. метилтио и етилтио, C_1-C_6 алкилсул-

финил като напр. метилсулфинил и етилсулфинил, C_1-C_6 алкилсулфонил като напр. метилсулфонил, етилсулфонил и пропилсулфонил или C_1-C_6 халогеналкилсулфонил като напр. трифлуорометилсулфонил и пентафлуороетилсулфонил;

Също така особено извънредно предпочитан е 4-[2-хлоро-3-(4,5-дихидроизоксазол-3-ил)-4-метилсулфонилбензоил]-1-метил-5-хидрокси-1 Н-пиразол.

Също така особено извънредно предпочитани са приложимите в земеделието соли на 4-[2-хлоро-3-(4,5-дихидроизоксазол-3-ил)-4-метилсулфонилбензоил]-1-метил-5-хидрокси-1 Н-пиразол, по-специално солите с алкални метали като напр. литий, натрий и калий и амониите соли, при което в тях ако е желателно един до четири водородни атоми могат да бъдат заместени с C_1-C_4 алкил, хидрокси- C_1-C_4 алкил, C_1-C_4 алкокси- C_1-C_4 алкил, хидрокси- C_1-C_4 алкокси- C_1-C_4 алкил, фенол или бензил, за предпочитане амоний, диметиламоний, диизопропиламоний, тетраметиламоний, тетрабутиламоний, 2-(2-хидроксиет-1-окси)ет-1-иламоний, ди-(2-хидроксиет-1-ил)амоний, триметилбензиламоний.

Също така извънредно предпочитани са при това 3-хетероциклизаместени бензоилови производни с формула I, в която R^{18} означава метил.

Особено извънредно предпочитани при това са 3-хетероциклизаместени бензоилови производни с формула I, в която

R^1 означава нитро, C_1-C_6 алкил, като напр. метил и етил, C_1-C_6 алкокси като напр. метокси и етокси, C_1-C_6 халогеналкил като напр. дифлуорометил и трифлуорометил, C_1-C_6 алкилсулфонил като напр. метилсулфонил, етилсулфонил и пропилсулфонил или C_1-C_6 халогеналкилсулфонил напр. трифлуорометилсулфонил и пентафлуороетилсулфонил;

Също така особено извънредно предпочитани са при това 3-хетероциклизаместени бензоилови производни с формула I, в която

R^2 означава нитро, халоген като напр. хлоро и бромо, C_1-C_6 алкил като напр. метил и етил, C_1-C_6 халогеналкил като напр. дифлуорометил и трифлуорометил, C_1-C_6 алкилтио като напр. метилтио и етилтио, C_1-C_6 алкилсулфинил като напр. метилсулфинил и етилсулфинил, C_1-C_6 алкилсулфонил като напр. метилсулфонил, етилсулфонил и пропилсулфонил

или C_1-C_6 халогеналкилсулфонил като напр. трифлуорометилсулфонил и пентафлуороетилсулфонил;

Също така особено предпочитани са при това 3-хетероциклизаместени бензоилови производни с формула I, в която

X означава S, NR⁹, CO или CR¹⁰R¹¹; или
Y означава O, S, NR¹² или CO;

* Специално предпочитани са при това 3-хетероциклизаместени бензоилови производни с формула I, в която R¹⁸ означава водород.

* Също така специално предпочитани са при това 3-хетероциклизаместени бензоилови производни с формула I, в която R¹⁸ означава C_1-C_6 алкил.

Извънредно предпочитани са при това 3-хетероциклизаместени бензоилови производни с формула I, в която

R⁴ означава халоген, циано, C_1-C_4 алкил, C_1-C_4 алкокси- C_1-C_4 алкил, C_1-C_4 алкоксикарбонил- C_1-C_4 алкил, C_1-C_4 алкилтио- C_1-C_4 алкил, C_1-C_4 халогеналкил, C_1-C_4 цианоалкил, C_3-C_8 циклоалкил, C_1-C_6 алкокси, C_1-C_4 алкокси- C_1-C_4 алкокси, C_1-C_4 халогеналкокси, C_1-C_4 алкилтио, C_1-C_4 халогеналкилтио, ди-(C_1-C_4 алкил)амино, COR⁶, фенил или бензил, при което двата последни заместители могат да бъдат частично или напълно халогенирани и/или могат да носят една до три от следните групи: нитро, циано, C_1-C_4 алкил, C_1-C_4 халогеналкил, C_1-C_4 алкокси или C_1-C_4 халогеналкокси;

R⁵ е водород или C_1-C_4 алкил; или

R⁴ и R⁵ образуват заедно C_2-C_6 алкандиолова верига, която може да бъде заместена еднократно до четирикратно с C_1-C_4 алкил и/или може да бъде прекъсната с кислород или азот, в даден случай заместен с C_1-C_4 алкил; или

R⁴ и R⁹, или R⁴ и R¹⁰, или R⁵ и R¹², или R⁵ и R¹³ образуват заедно C_2-C_6 алкандиолова верига, която може да бъде еднократно до четирикратно заместена с C_1-C_4 алкил и/или да бъ-

де прекъсната с кислород или азот, в даден случай заместен с C_1-C_4 алкил.

*Също така специално предпочитани са при това 3-хетероциклизаместени бензоилови производни с формула I, в която

X означава S, NR⁹ или CO или
Y е O, NR¹² или CO.

Извънредно предпочитани са при това 3-хетероциклизаместени бензоилови производни с формула I, в която

R⁴ означава халоген, циано, нитро, C_1-C_4 алкил, C_1-C_4 алкокси- C_1-C_4 алкил, C_1-C_4 алкоксикарбонил- C_1-C_4 алкил, C_1-C_4 алкилтио- C_1-C_4 алкил, C_1-C_4 халогеналкил, C_1-C_4 цианоалкил, C_3-C_8 циклоалкил, C_1-C_6 алкокси, C_1-C_4 алкокси- C_1-C_4 алкокси, C_1-C_4 халогеналкокси, C_1-C_4 алкилтио, C_1-C_4 халогеналкилтио, ди-(C_1-C_4 алкил)амино, COR⁶, фенил или бензил, при което двата последно споменати заместители могат да бъдат частично или напълно халогенирани и/или да носят една до три от следните групи: нитро, циано, C_1-C_4 алкил, C_1-C_4 халогеналкил, C_1-C_4 алкокси или C_1-C_4 халогеналкокси;

R⁵ е водород или C_1-C_4 алкил; или

R⁴ и R⁵ образуват заедно C_1-C_4 алкандиолова верига, която може да бъде еднократно до четирикратно заместена с C_1-C_4 алкил и/или може да бъде прекъсната с кислород или азот, в даден случай заместен с C_1-C_4 алкил; или

R⁴ и R⁹, или R⁴ и R¹⁰, или R⁵ и R¹², или R⁵ и R¹³ образуват заедно C_2-C_6 алкандиолова верига, която може да бъде заместена еднократно до четирикратно с C_1-C_4 алкил и/или прекъсната с кислород или азот, в даден случай заместен с C_1-C_4 алкил.

Особено извънредно предпочитани са съединенията Ia1 (= I с R¹ = Cl, R² = SO₂CH₃, R³ = H, R¹⁶, R¹⁸ = CH₃, Z = H), особено съединенията от таблица 1.

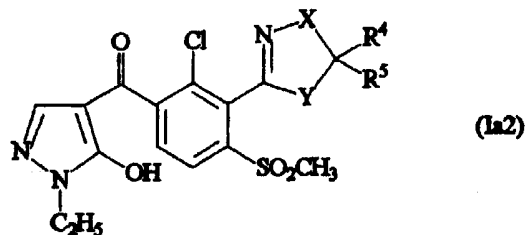
№	X	R ⁴	R ⁵	Y
Ia1.18	C(CH ₃) ₂	H	H	S
Ia1.19	CH ₂	H	C ₂ H ₅	S
Ia1.20	CH ₂	CH ₃	CH ₃	S
Ia1.21	CH(CH ₃)	H	CH ₃	S
Ia1.22	CH(C ₂ H ₅)	H	CH ₃	S
Ia1.23	CH(C ₂ H ₅)	H	C ₂ H ₅	S
Ia1.24	-CH-(CH ₂) ₄ -		H	S
Ia1.25	CH[CH(CH ₃) ₂]	H	H	S
Ia1.26	CH ₂	H	CH(CH ₃) ₂	S
Ia1.27	CH ₂	H	CH ₃	NH
Ia1.28	CH ₂	H	H	NH
Ia1.29	C(CH ₃) ₂	H	H	NH
Ia1.30	CH ₂	H	C ₂ H ₅	NH
Ia1.31	CH ₂	CH ₃	CH ₃	NH
Ia1.32	CH(CH ₃)	H	CH ₃	NH
Ia1.33	CH(C ₂ H ₅)	H	CH ₃	NH
Ia1.34	CH(C ₂ H ₅)	H	C ₂ H ₅	NH
Ia1.35	-CH-(CH ₂) ₄ -		H	NH
Ia1.36	CH[CH(CH ₃) ₂]	H	H	NH
Ia1.37	CH ₂	H	CH(CH ₃) ₂	NH
Ia1.38	CH ₂	H	CH ₃	NCH ₃
Ia1.39	CH ₂	H	H	NCH ₃
Ia1.40	C(CH ₃) ₂	H	H	NCH ₃
Ia1.41	CH ₂	H	C ₂ H ₅	NCH ₃
Ia1.42	CH ₂	CH ₃	CH ₃	NCH ₃
Ia1.43	CH(CH ₃)	H	CH ₃	NCH ₃
Ia1.44	CH(C ₂ H ₅)	H	CH ₃	NCH ₃

№	X	R ⁴	R ⁵	Y
Ia1.45	CH[CH(CH ₃) ₂]	H	H	NCH ₃
Ia1.46	CH ₂	H	CH(CH ₃) ₂	NCH ₃
Ia1.47	CH(C ₂ H ₅)	H	C ₂ H ₅	NCH ₃
Ia1.48	-CH-(CH ₂) ₄ -		H	NCH ₃
Ia1.49	CH ₂	H	CH ₃	NC ₂ H ₅
Ia1.50	CH ₂	H	H	NC ₂ H ₅
Ia1.51	C(CH ₃) ₂	H	H	NC ₂ H ₅
Ia1.52	CH ₂	H	C ₂ H ₅	NC ₂ H ₅
Ia1.53	CH ₂	CH ₃	CH ₃	NC ₂ H ₅
Ia1.54	CH(CH ₃)	H	CH ₃	NC ₂ H ₅
Ia1.55	CH(C ₂ H ₅)	H	CH ₃	NC ₂ H ₅
Ia1.56	CH[CH(CH ₃) ₂]	H	H	NC ₂ H ₅
Ia1.57	CH ₂	H	CH(CH ₃) ₂	NC ₂ H ₅
Ia1.58	CH(C ₂ H ₅)	H	C ₂ H ₅	NC ₂ H ₅
Ia1.59	-CH-(CH ₂) ₄ -		H	NC ₂ H ₅
Ia1.60	CH ₂		=O	S
Ia1.61	CH(CH ₃)		=O	S
Ia1.62	CH(C ₂ H ₅)		=O	S
Ia1.63	CH[CH(CH ₃) ₂]		=O	S
Ia1.64	C(CH ₃) ₂		=O	S
Ia1.65	CCH ₃ (C ₂ H ₅)		=O	S
Ia1.66	CCH ₃ [CH(CH ₃) ₂]		=O	S
Ia1.67	CH ₂		=O	NH
Ia1.68	CH(CH ₃)		=O	NH
Ia1.69	CH(C ₂ H ₅)		=O	NH
Ia1.70	CH[CH(CH ₃) ₂]		=O	NH
Ia1.71	C(CH ₃) ₂		=O	NH

№	X	R ⁴	R ⁵	Y
Ia1.72	CCH ₃ (C ₂ H ₅)		=O	NH
Ia1.73	CCH ₃ [CH(CH ₃) ₂]		=O	HN
Ia1.74	CH ₂		=O	NCH ₃
Ia1.75	CH(CH ₃)		=O	NCH ₃
Ia1.76	CH(C ₂ H ₅)		=O	NCH ₃
Ia1.77	CH[CH(CH ₃) ₂]		=O	NCH ₃
Ia1.78	C(CH ₃) ₂		=O	NCH ₃
Ia1.79	CCH ₃ (C ₂ H ₅)		=O	NCH ₃
Ia1.80	CCH ₃ [CH(CH ₃) ₂]		=O	NCH ₃
Ia1.81	O	COOCH ₃	H	CH ₂
Ia1.82	O	COOC ₂ H ₅	H	CH ₂
Ia1.83	O	CONHCH ₃	H	CH ₂
Ia1.84	O	CON(CH ₃) ₂	H	CH ₂
Ia1.85	O	CONHC ₂ H ₅	H	CH ₂
Ia1.86	O	CON(C ₂ H ₅) ₂	H	CH ₂
Ia1.87	O	CH ₃	H	CH ₂
Ia1.88	O	C ₂ H ₅	H	CH ₂
Ia1.89	O	CH(CH ₃) ₂	H	CH ₂
Ia1.90	O	COC ₂ H ₅	H	CH ₂
Ia1.91	O	CH ₂ CN	H	CH ₂
Ia1.92	O	CH ₂ N(CH ₃) ₂	H	CH ₂
Ia1.93	O	CH ₂ ON=C(CH ₃) ₂	H	CH ₂
Ia1.94	O	CH(OC ₂ H ₅) ₂	H	CH ₂
Ia1.95	O	CH(OCH ₃) ₂	H	CH ₂
Ia1.96	O	CH ₃	CH ₃	CH ₂
Ia1.97	O	CH ₃	C ₂ H ₅	CH ₂

№	X	R ⁴	R ⁵	Y
Ia1.98	O	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	CH ₂
Ia1.99	O	-(CH ₂) ₄ -		CH ₂
Ia1.100	O	-(CH ₂) ₂ -O-(CH ₂) ₂		CH ₂
Ia1.101	O	H	-(CH ₂) ₃ -CH-	
Ia1.102	O	H	-(CH ₂) ₄ -CH-	
Ia1.103	O	CH ₃	H	CHCH ₃
Ia1.104	S	=O		O
Ia1.105	CH ₂	=S		S
Ia1.106	CH(CH ₃)	=S		S
Ia1.107	CH(C ₂ H ₅)	=S		S
Ia1.108	C(CH ₃) ₂	=S		S
Ia1.109	O	=O		NH
Ia1.110	O	=O		NCH ₃
Ia1.111	O	CH ₃	H	NH
Ia1.112	O	C ₂ H ₅	H	NH
Ia1.113	O	CH ₃	CH ₃	NH
Ia1.114	O	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	NH
Ia1.115	O	CH ₃	H	NCH ₃
Ia1.116	O	C ₂ H ₅	H	NCH ₃
Ia1.117	O	CH ₃	CH ₃	NCH ₃
Ia1.118	O	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	NCH ₃
Ia1.119	NH	=O		NH
Ia1.120	NH	=O		NCH ₃
Ia1.121	NCH ₃	=O		NH
Ia1.122	NCH ₃	=O		NCH ₃
Ia1.123	NC ₂ H ₅	=O		NH
Ia1.124	NC ₂ H ₅	=O		NC ₂ H ₅

Особено извънредно предпочитани са следните бензоилови производни с формула I: съединенията Ia2.1-Ia2.124, които се различават от съответните съединения Ia1.1-Ia1.124 по това, че R¹⁶ означава етил и R¹⁸ означава водород.



Също така особено извънредно предпочитани са съединенията Ib1 (=I с R¹, R² = Cl, R³ = H, R¹⁶, R¹⁸ = CH₃, Z = H), особено съединенията от таблица 2.

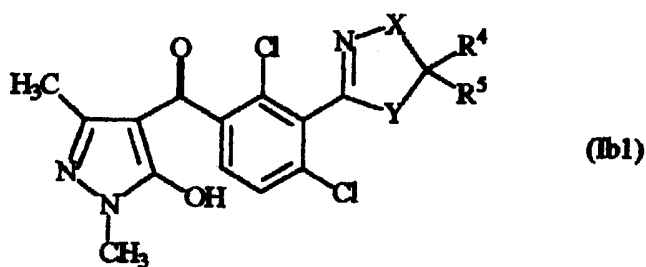


Таблица 2

№	X	R ⁴	R ⁵	Y
Ib1.1	CH ₂	H	CH ₃	O
Ib1.2	CH ₂	H	H	O
Ib1.3	C(CH ₃) ₂	H	H	O
Ib1.4	CH ₂	H	C ₂ H ₅	O
Ib1.5	CH ₂	CH ₃	CH ₃	O
Ib1.6	CH(CH ₃)	H	CH ₃	O
Ib1.7	CH(C ₂ H ₅)	H	CH ₃	O

№	X	R ⁴	R ⁵	Y
Ib1.8	CH[CH(CH ₃) ₂]	H	H	O
Ib1.9	CH ₂	H	CH(CH ₃) ₂	O
Ib1.10	CH(C ₂ H ₅)	H	C ₂ H ₅	O
Ib1.11	-CH-(CH ₂) ₄ -		H	O
Ib1.12	C=O	CH ₃	CH ₃	O
Ib1.13	C=O	H	C ₂ H ₅	O
Ib1.14	C=O	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	O
Ib1.15	C=O	H	H	O
Ib1.16	C=O	H	CH ₃	O
Ib1.17	CH ₂	H	CH ₃	S
Ib1.18	CH ₂	H	H	S
Ib1.19	C(CH ₃) ₂	H	H	S
Ib1.20	CH ₂	H	C ₂ H ₅	S
Ib1.21	CH ₂	CH ₃	CH ₃	S
Ib1.22	CH(CH ₃)	H	CH ₃	S
Ib1.23	CH(C ₂ H ₅)	H	CH ₃	S
Ib1.24	CH(C ₂ H ₅)	H	C ₂ H ₅	S
Ib1.25	-CH-(CH ₂) ₄ -		H	S
Ib1.26	CH[CH(CH ₃) ₂]	H	H	S
Ib1.27	CH ₂	H	CH(CH ₃) ₂	S
Ib1.28	CH ₂	H	CH ₃	NH
Ib1.29	CH ₂	H	H	NH
Ib1.30	C(CH ₃) ₂	H	H	NH
Ib1.31	CH ₂	H	C ₂ H ₅	NH
Ib1.32	CH ₂	CH ₃	CH ₃	NH
Ib1.33	CH(CH ₃)	H	CH ₃	NH
Ib1.34	CH(C ₂ H ₅)	H	CH ₃	NH

№	X	R ⁴	R ⁵	Y
Ib1.35	CH(C ₂ H ₅)	H	C ₂ H ₅	NH
Ib1.36	-CH-(CH ₂) ₄ -		H	NH
Ib1.37	CH[CH(CH ₃) ₂]	H	H	NH
Ib1.38	CH ₂	H	CH(CH ₃) ₂	NH
Ib1.39	CH ₂	H	CH ₃	NCH ₃
Ib1.40	CH ₂	H	H	NCH ₃
Ib1.41	C(CH ₃) ₂	H	H	NCH ₃
Ib1.42	CH ₂	H	C ₂ H ₅	NCH ₃
Ib1.43	CH ₂	CH ₃	CH ₃	NCH ₃
Ib1.44	CH(CH ₃)	H	CH ₃	NCH ₃
Ib1.45	CH(C ₂ H ₅)	H	CH ₃	NCH ₃
Ib1.46	CH[CH(CH ₃) ₂]	H	H	NCH ₃
Ib1.47	CH ₂	H	CH(CH ₃) ₂	NCH ₃
Ib1.48	CH(C ₂ H ₅)	H	C ₂ H ₅	NCH ₃
Ib1.49	-CH-(CH ₂) ₄ -		H	NCH ₃
Ib1.50	CH ₂	H	CH ₃	NC ₂ H ₅
Ib1.51	CH ₂	H	H	NC ₂ H ₅
Ib1.52	C(CH ₃) ₂	H	H	NC ₂ H ₅
Ib1.53	CH ₂	H	C ₂ H ₅	NC ₂ H ₅
Ib1.54	CH ₂	CH ₃	CH ₃	NC ₂ H ₅
Ib1.55	CH(CH ₃)	H	CH ₃	NC ₂ H ₅
Ib1.56	CH(C ₂ H ₅)	H	CH ₃	NC ₂ H ₅
Ib1.57	CH[CH(CH ₃) ₂]	H	H	NC ₂ H ₅
Ib1.58	CH ₂	H	CH(CH ₃) ₂	NC ₂ H ₅
Ib1.59	CH(C ₂ H ₅)	H	C ₂ H ₅	NC ₂ H ₅
Ib1.60	-CH-(CH ₂) ₄ -		H	NC ₂ H ₅

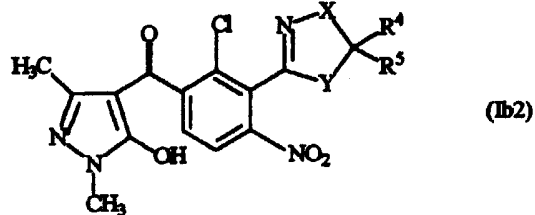
№	X	R ⁴	R ⁵	Y
Ib1.61	CH ₂	=O		S
Ib1.62	CH(CH ₃)	=O		S
Ib1.63	CH(C ₂ H ₅)	=O		S
Ib1.64	CH[CH(CH ₃) ₂]	=O		S
Ib1.65	C(CH ₃) ₂	=O		S
Ib1.66	CCH ₃ (C ₂ H ₅)	=O		S
Ib1.67	CCH ₃ [CH(CH ₃) ₂]	=O		S
Ib1.68	CH ₂	=O		NH
Ib1.69	CH(CH ₃)	=O		NH
Ib1.70	CH(C ₂ H ₅)	=O		NH
Ib1.71	CH[CH(CH ₃) ₂]	=O		NH
Ib1.72	C(CH ₃) ₂	=O		NH
Ib1.73	CCH ₃ (C ₂ H ₅)	=O		NH
Ib1.74	CCH ₃ [CH(CH ₃) ₂]	=O		NH
Ib1.75	CH ₂	=O		NCH ₃
Ib1.76	CH(CH ₃)	=O		NCH ₃
Ib1.77	CH(C ₂ H ₅)	=O		NCH ₃
Ib1.78	CH[CH(CH ₃) ₂]	=O		NCH ₃
Ib1.79	C(CH ₃) ₂	=O		NCH ₃
Ib1.80	CCH ₃ (C ₂ H ₅)	=O		NCH ₃
Ib1.81	CCH ₃ [CH(CH ₃) ₂]	=O		NCH ₃
Ib1.82	O	COOCH ₃	H	CH ₂
Ib1.83	O	COOC ₂ H ₅	H	CH ₂
Ib1.84	O	CONHCH ₃	H	CH ₂
Ib1.85	O	CON(CH ₃) ₂	H	CH ₂
Ib1.86	O	CONHC ₂ H ₅	H	CH ₂
Ib1.87	O	CON(C ₂ H ₅) ₂	H	CH ₂

№	X	R ⁴	R ⁵	Y
Ib1.88	O	CH ₃	H	CH ₂
Ib1.89	O	C ₂ H ₅	H	CH ₂
Ib1.90	O	CH(CH ₃) ₂	H	CH ₂
Ib1.91	O	COC ₂ H ₅	H	CH ₂
Ib1.92	O	CH ₂ CN	H	CH ₂
Ib1.93	O	CH ₂ N(CH ₃) ₂	H	CH ₂
Ib1.94	O	CH ₂ ON=C(CH ₃) ₂	H	CH ₂
Ib1.95	O	CH(OC ₂ H ₅) ₂	H	CH ₂
Ib1.96	O	CH(OCH ₃) ₂	H	CH ₂
Ib1.97	O	CH ₃	CH ₃	CH ₂
Ib1.98	O	CH ₃	C ₂ H ₅	CH ₂
Ib1.99	O	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	CH ₂
Ib1.100	O	-(CH ₂) ₄ -		CH ₂
Ib1.101	O	-(CH ₂) ₂ -O-(CH ₂) ₂ -		CH ₂
Ib1.102	O	H	-(CH ₂) ₃ -CH-	
Ib1.103	O	H	-(CH ₂) ₄ -CH-	
Ib1.104	O	CH ₃	H	CHCH ₃
Ib1.105	O	H	H	CH ₂
Ib1.106	S	=O		O
Ib1.107	CH ₂	=S		S
Ib1.108	CH(CH ₃)	=S		S
Ib1.109	CH(C ₂ H ₅)	=S		S
Ib1.110	C(CH ₃) ₂	=S		S
Ib1.111	O	=O		NH
Ib1.112	O	=O		NCH ₃
Ib1.113	O	CH ₃	H	NH
Ib1.114	O	C ₂ H ₅	H	NH

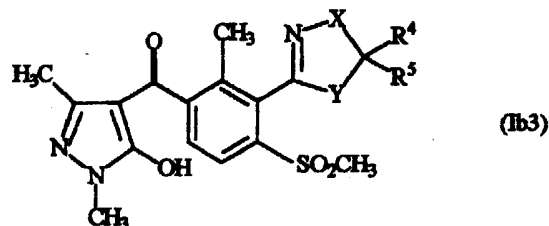
№	X	R ⁴	R ⁵	Y
Ib1.115	O	CH ₃	CH ₃	NH
Ib1.116	O	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	NH
Ib1.117	O	CH ₃	H	NCH ₃
Ib1.118	O	C ₂ H ₅	H	NCH ₃
Ib1.119	O	CH ₃	CH ₃	NCH ₃
Ib1.120	O	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	NCH ₃
Ib1.121	NH	=O		NH
Ib1.122	NH	=O		NCH ₃
Ib1.123	NCH ₃	=O		NH
Ib1.124	NCH ₃	=O		NCH ₃
Ib1.125	NC ₂ H ₅	=O		NH
Ib1.126	NC ₂ H ₅	=O		NC ₂ H ₅

Следните 3-хетероциклзаместени бензоилови производни с формула I са особено извънредно предпочитани:

- съединения Ib2.1-Ib2.126, които се различават от съответните съединения Ib1.1-Ib1.126 по това, че R² означава нитро.

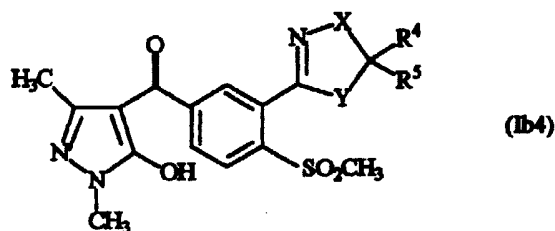


- съединения Ib3.1-Ib3.126, които се различават от съответните съединения Ib1.1-Ib1.126 по това, че R¹ означава метил и R² означава метилсулфонил.

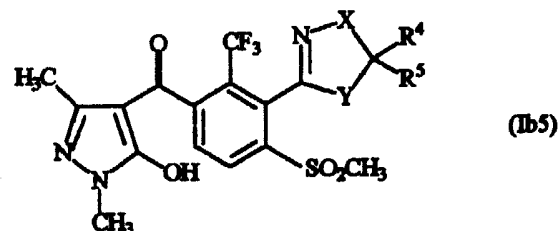


- съединения Ib4.1-Ib4.126, които се раз-

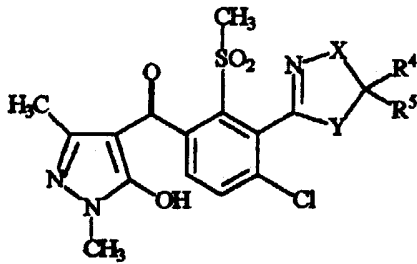
личават от съответните съединения Ib1.1-Ib1.126 по това, че R¹ означава водород и R² означава метилсулфонил.



- съединения Ib5.1-Ib5.126, които се различават от съответните съединения Ib1.1-Ib1.126 по това, че R¹ означава трифлуорометил и R² означава метилсулфонил.

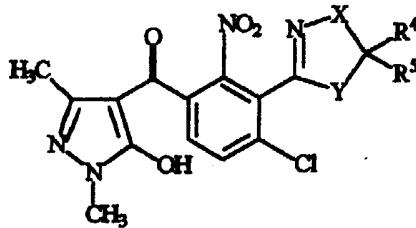


- съединения Ib6.1-Ib6.126, които се различават от съответните съединения Ib1.1-Ib1.126 по това, че R¹ означава метилсулфонил.



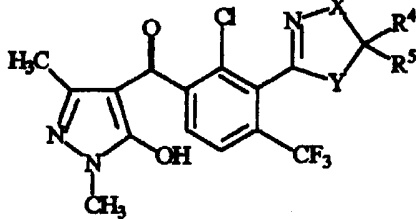
(Ib6) 5

- съединения Ib7.1-Ib7.126, които се различават от съответните съединения Ib1.1-Ib1.126 по това, че R¹ означава нитро.



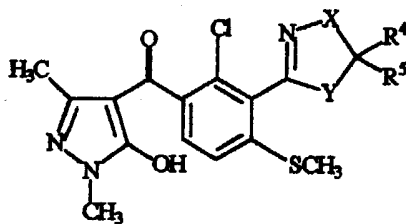
(Ib7) 10

- съединения Ib8.1-Ib8.126, които се различават от съответните съединения Ib1.1-Ib1.126 по това, че R² означава трифлуорометил.



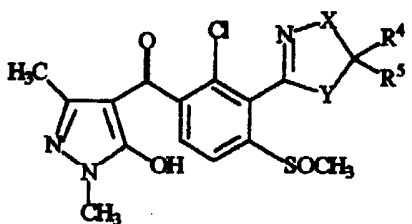
(Ib8) 15

- съединения Ib9.1-Ib9.126, които се различават от съответните съединения Ib1.1-Ib1.126 по това, че R² означава метилтио.



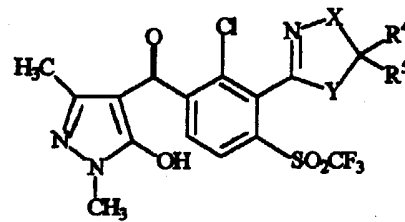
(Ib9) 20

- съединения Ib10.1-Ib10.126, които се различават от съответните съединения Ib1.1-Ib1.126 по това, че R² означава метилсулфинил.



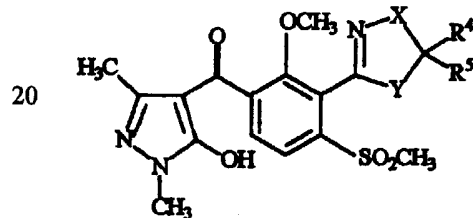
(Ib10) 25

- съединения Ib11.1-Ib11.126, които се различават от съответните съединения Ib1.1-Ib1.126 по това, че и R² означава трифлуорометилсулфонил.



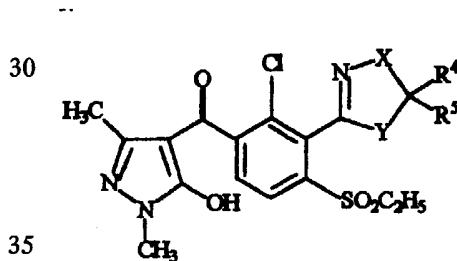
(Ib11) 30

- съединения Ib12.1-Ib12.126, които се различават от съответните съединения Ib1.1-Ib1.126 по това, че R¹ означава метокси и R² означава метилсулфонил.



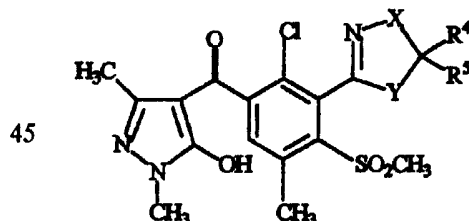
(Ib12) 35

- съединения Ib13.1-Ib13.126, които се различават от съответните съединения Ib1.1-Ib1.126 по това, че R² означава етилсулфонил.



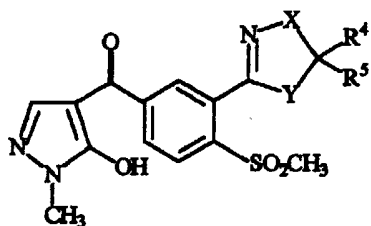
(Ib13) 40

- съединения Ib14.1-Ib14.126, които се различават от съответните съединения Ib1.1-Ib1.126 по това, че R² означава метилсулфонил и R³ означава метил.



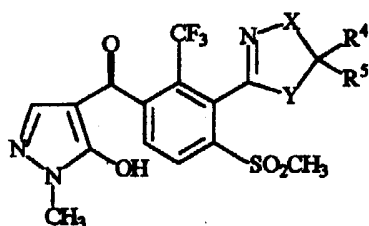
(Ib14) 45

- съединения Ib15.1-Ib15.126, които се различават от съответните съединения Ib1.1-Ib1.126 по това, че R² означава метилсулфо-



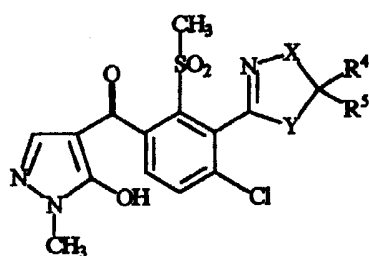
(Ib24)

- съединения Ib25.1-Ib25.126, които се различават от съответните съединения Ib1.1-Ib1.126 по това, че R¹ означава трифлуорометил, R² означава метилсулфонил и R¹⁸ означава водород.



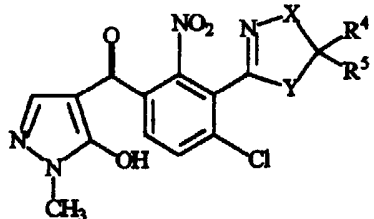
(Ib25)

- съединения Ib26.1-Ib26.126, които се различават от съответните съединения Ib1.1-Ib1.126 по това, че R¹ означава метилсулфонил и R¹⁸ означава водород.



(Ib26)

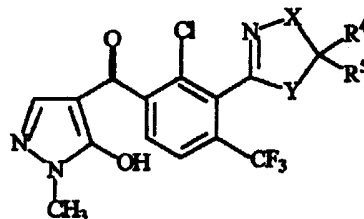
- съединения Ib27.1-Ib27.126, които се различават от съответните съединения Ib1.1-Ib1.126 по това, че R¹ означава нитро и R¹⁸ означава водород.



(Ib27)

- съединения Ib28.1-Ib28.126, които се различават от съответните съединения Ib1.1-Ib1.126 по това, че R² означава трифлуорометил и R¹⁸ означава водород.

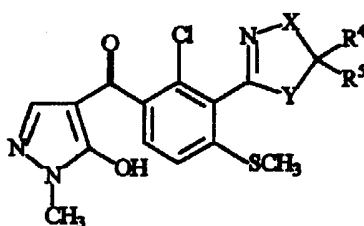
5



(Ib28)

- съединения Ib29.1-Ib29.126, които се различават от съответните съединения Ib1.1-Ib1.126 по това, че R² означава метилтио и R¹⁸ означава водород.

10



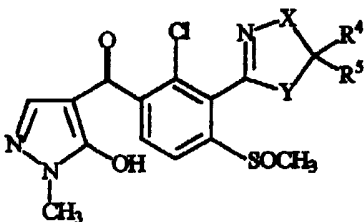
(Ib29)

15

20

- съединения Ib30.1-Ib30.126, които се различават от съответните съединения Ib1.1-Ib1.126 по това, че R² означава метилсулфонил и R¹⁸ означава водород.

25



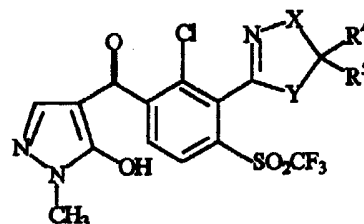
(Ib30)

30

- съединения Ib31.1-Ib31.126, които се различават от съответните съединения Ib1.1-Ib1.126 по това, че R² означава трифлуорометилсулфонил и R¹⁸ означава водород.

35

40

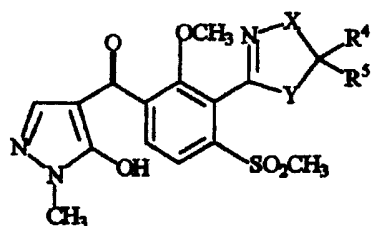


(Ib31)

45

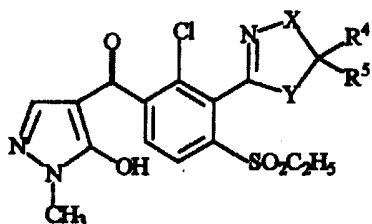
- съединения Ib32.1-Ib32.126, които се различават от съответните съединения Ib1.1-Ib1.126 по това, че R¹ означава метокси, R² означава метилсулфонил и R¹⁸ означава водород.

50



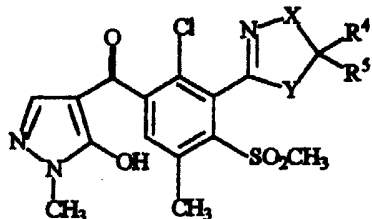
(Ib32)

- съединения Ib33.1-Ib33.126, които се различават от съответните съединения Ib1.1-Ib1.126 по това, че R² означава етилсулфонил и R¹⁸ означава водород.



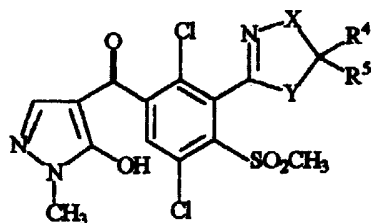
(Ib33)

- съединения Ib34.1-Ib34.126, които се различават от съответните съединения Ib1.1-Ib1.126 по това, че R² означава метилсулфонил, R³ означава метил и R¹⁸ означава водород



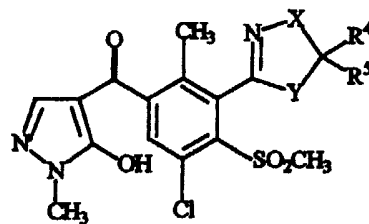
(Ib34)

- съединения Ib35.1-Ib35.126, които се различават от съответните съединения Ib1.1-Ib1.126 по това, че R² означава метилсулфонил, R³ означава хлоро и R¹⁸ означава водород.



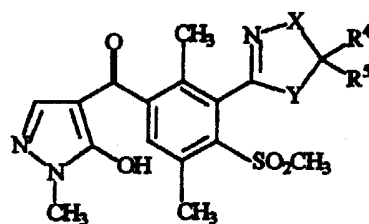
(Ib35)

- съединения Ib36.1-Ib36.126, които се различават от съответните съединения Ib1.1-Ib1.126 по това, че R¹ означава метил, R² означава метилсулфонил, R³ е хлоро и R¹⁸ означава водород.



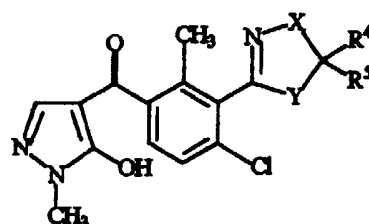
(Ib36)

- съединения Ib37.1-Ib37.126, които се различават от съответните съединения Ib1.1-Ib1.126 по това, че R¹ означава метил, R² означава метилсулфонил, R³ означава метил и R¹⁸ означава водород.



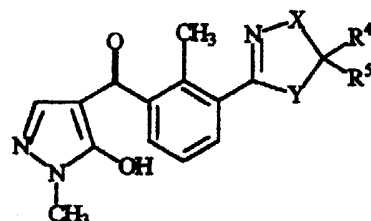
(Ib37)

- съединения Ib38.1-Ib38.126, които се различават от съответните съединения Ib1.1-Ib1.126 по това, че R¹ означава метил, и R¹⁸ означава водород.



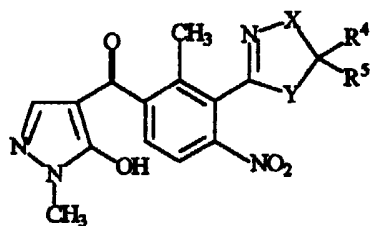
(Ib38)

- съединения Ib39.1-Ib39.126, които се различават от съответните съединения Ib1.1-Ib1.126 по това, че R¹ означава метил, R² означава водород и R¹⁸ означава водород.



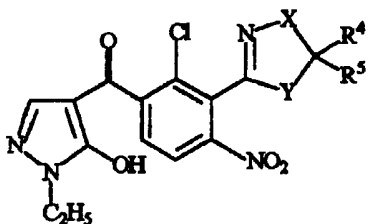
(Ib39)

- съединения Ib40.1-Ib40.126, които се различават от съответните съединения Ib1.1-Ib1.126 по това, че R¹ означава метил, R² означава нитро и R¹⁸ означава водород.



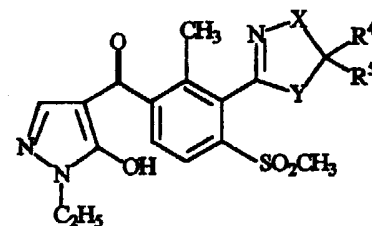
(Ib40)

- съединения Ib41.1-Ib41.126, които се различават от съответните съединения Ib1.1-Ib1.126 по това, че R² означава нитро, R¹⁶ означава етил и R¹⁸ означава водород.



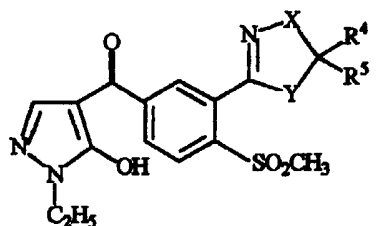
(Ib41)

- съединения Ib42.1-Ib42.126, които се различават от съответните съединения Ib1.1-Ib1.126 по това, че R¹ означава метил, R² означава метилсулфонил, R¹⁶ означава етил и R¹⁸ означава водород.



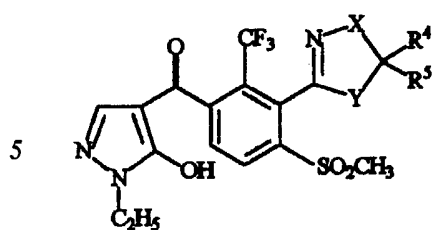
(Ib42)

- съединения Ib43.1-Ib43.126, които се различават от съответните съединения Ib1.1-Ib1.126 по това, че R¹ означава водород, R² означава метилсулфонил, R¹⁶ означава етил и R¹⁸ означава водород.



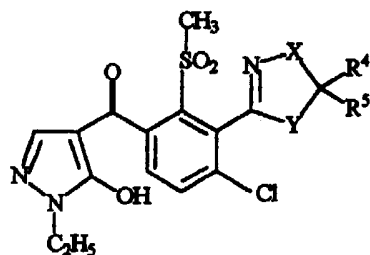
(Ib43)

- съединения Ib44.1-Ib44.126, които се различават от съответните съединения Ib1.1-Ib1.126 по това, че R¹ означава трифлуорометил, R² означава метилсулфонил, R¹⁶ означава етил и R¹⁸ означава водород.



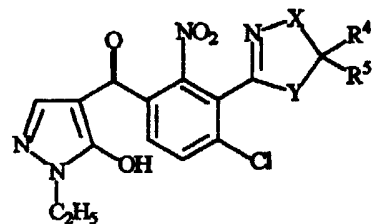
(Ib44)

- съединения Ib45.1-Ib45.126, които се различават от съответните съединения Ib1.1-Ib1.126 по това, че R¹ означава метилсулфонил, R¹⁶ означава етил и R¹⁸ означава водород.



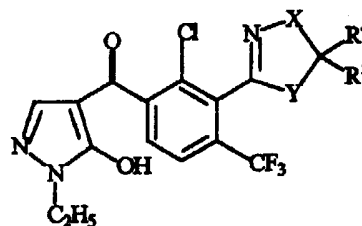
(Ib45)

- съединения Ib46.1-Ib46.126, които се различават от съответните съединения Ib1.1-Ib1.126 по това, че R¹ означава нитро, R¹⁶ означава етил и R¹⁸ означава водород.



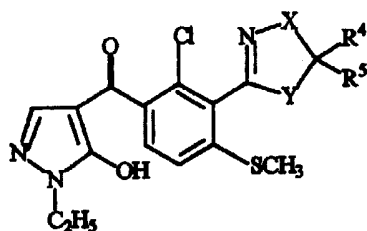
(Ib46)

- съединения Ib47.1-Ib47.126, които се различават от съответните съединения Ib1.1-Ib1.126 по това, че R² означава трифлуорометил, R¹⁶ означава етил и R¹⁸ означава водород.



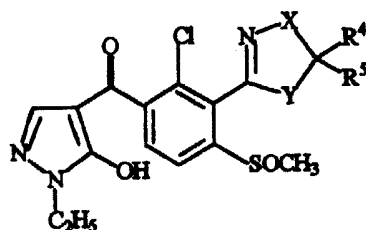
(Ib47)

- съединения Ib48.1-Ib48.126, които се различават от съответните съединения Ib1.1-Ib1.126 по това, че R² означава метилтио, R¹⁶ означава етил и R¹⁸ означава водород.



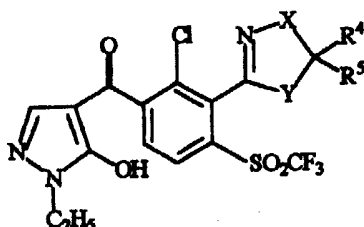
(Ib48)

- съединения Ib49.1-Ib49.126, които се различават от съответните съединения Ib1.1-Ib1.126 по това, че R² означава метилсулфинил, R¹⁶ означава етил и R¹⁸ означава водород.



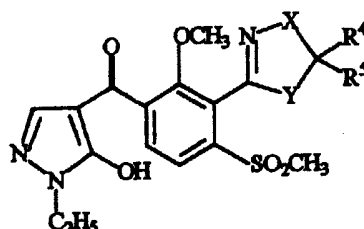
(Ib49)

- съединения Ib50.1-Ib50.126, които се различават от съответните съединения Ib1.1-Ib1.126 по това, че R² означава трифлуорометилсулфонил, R¹⁶ означава етил и R¹⁸ означава водород.



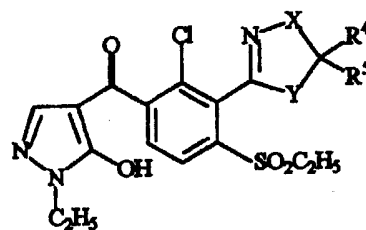
(Ib50)

- съединения Ib51.1-Ib51.126, които се различават от съответните съединения Ib1.1-Ib1.126 по това, че R¹ означава метокси, R² означава метилсулфонил, R¹⁶ означава етил и R¹⁸ означава водород.



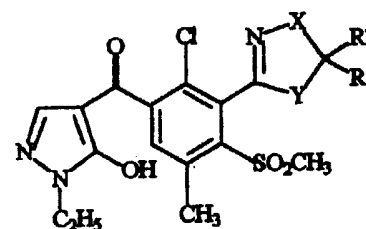
(Ib51)

- съединения Ib52.1-Ib52.126, които се различават от съответните съединения Ib1.1-Ib1.126 по това, че R² означава етилсулфонил, R¹⁶ означава етил и R¹⁸ означава водород.



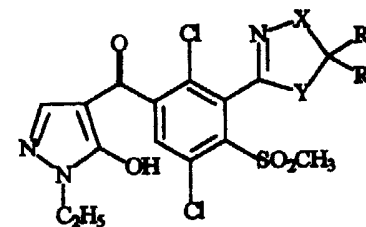
(Ib52)

- съединения Ib53.1-Ib53.126, които се различават от съответните съединения Ib1.1-Ib1.126 по това, че R² означава метилсулфонил, R³ означава метил, R¹⁶ означава етил и R¹⁸ означава водород.



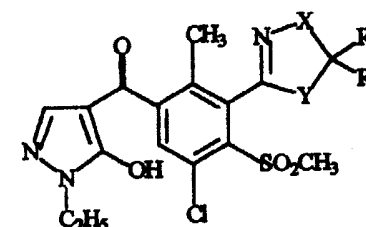
(Ib53)

- съединения Ib54.1-Ib54.126, които се различават от съответните съединения Ib1.1-Ib1.126 по това, че R² означава метилсулфонил, R³ означава хлоро, R¹⁶ означава етил и R¹⁸ означава водород.



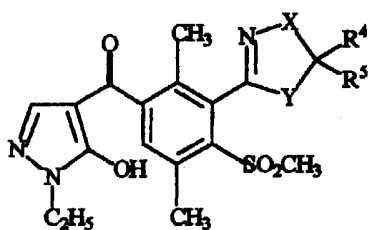
(Ib54)

- съединения Ib55.1-Ib55.126, които се различават от съответните съединения Ib1.1-Ib1.126 по това, че R¹ означава метил, R² означава метилсулфонил, R³ означава метил, R¹⁶ означава етил и R¹⁸ означава водород.



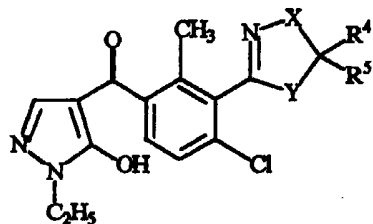
(Ib55)

- съединения Ib56.1-Ib56.126, които се различават от съответните съединения Ib1.1-Ib1.126 по това, че R¹ означава метил, R² означава метилсулфонил, R³ означава метил, R¹⁶ означава етил и R¹⁸ означава водород.



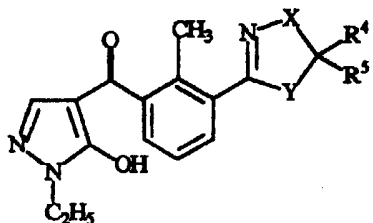
(Ib56)

- съединения Ib57.1-Ib57.126, които се различават от съответните съединения Ib1.1-Ib1.126 по това, че R¹ означава метил, R¹⁶ означава етил и R¹⁸ означава водород.



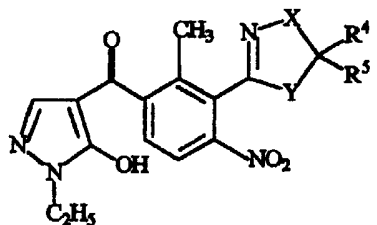
(Ib57)

- съединения Ib58.1-Ib58.126, които се различават от съответните съединения Ib1.1-Ib1.126 по това, че R¹ означава метил, R² означава водород, R¹⁶ означава етил и R¹⁸ означава водород.



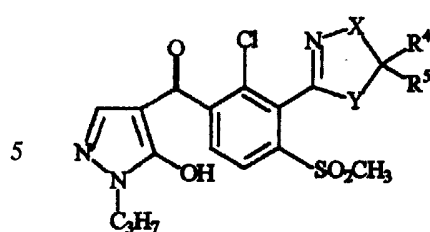
(Ib58)

- съединения Ib59.1-Ib59.126, които се различават от съответните съединения Ib1.1-Ib1.126 по това, че R¹ означава метил, R² означава нитро, R¹⁶ означава етил и R¹⁸ означава водород.



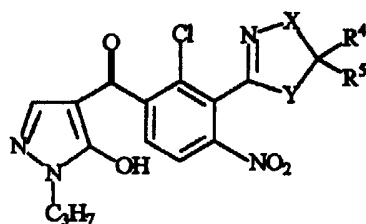
(Ib59)

- съединения Ib60.1-Ib60.126, които се различават от съответните съединения Ib1.1-Ib1.126 по това, че R² означава метилсулфонил, R³ означава метил, R¹⁶ означава норм-пропил и R¹⁸ означава водород.



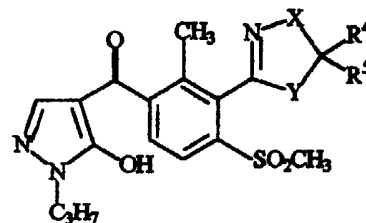
(Ib60)

- съединения Ib61.1-Ib61.126, които се различават от съответните съединения Ib1.1-Ib1.126 по това, че R² означава нитро, R¹⁶ означава норм-пропил и R¹⁸ означава водород.



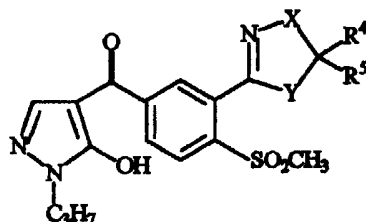
(Ib61)

- съединения Ib62.1-Ib62.126, които се различават от съответните съединения Ib1.1-Ib1.126 по това, че R¹ означава водород, R² означава метилсулфонил, R¹⁶ означава норм-пропил и R¹⁸ означава водород.



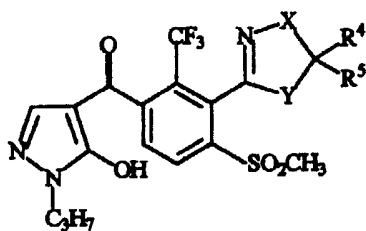
(Ib62)

- съединения Ib63.1-Ib63.126, които се различават от съответните съединения Ib1.1-Ib1.126 по това, че R¹ означава водород, R² означава метилсулфонил, R¹⁶ означава норм-пропил и R¹⁸ означава водород.



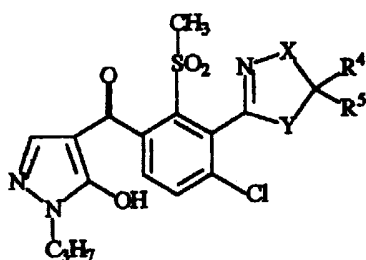
(Ib63)

- съединения Ib64.1-Ib64.126, които се различават от съответните съединения Ib1.1-Ib1.126 по това, че R¹ означава трифлуорометил, R² означава метилсулфонил, R¹⁶ означава норм-пропил и R¹⁸ означава водород.



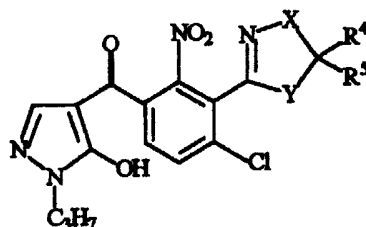
(Ib64)

- съединения Ib65.1-Ib65.126, които се различават от съответните съединения Ib1.1-Ib1.126 по това, че R¹ означава метилсулфонил, R¹⁶ означава норм-пропил и R¹⁸ означава водород.



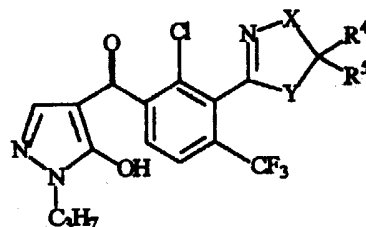
(Ib65)

- съединения Ib66.1-Ib66.126, които се различават от съответните съединения Ib1.1-Ib1.126 по това, че R¹ означава нитро, R¹⁶ означава норм-пропил и R¹⁸ означава водород.



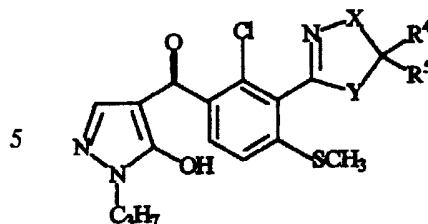
(Ib66)

- съединения Ib67.1-Ib67.126, които се различават от съответните съединения Ib1.1-Ib1.126 по това, че R² означава трифлуорометил, R¹⁶ означава норм-пропил и R¹⁸ означава водород.



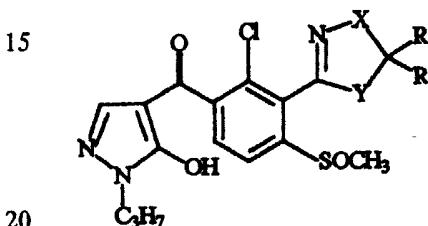
(Ib67)

- съединения Ib68.1-Ib68.126, които се различават от съответните съединения Ib1.1-Ib1.126 по това, че R² означава метилтио, R¹⁶ означава норм-пропил и R¹⁸ означава водород.



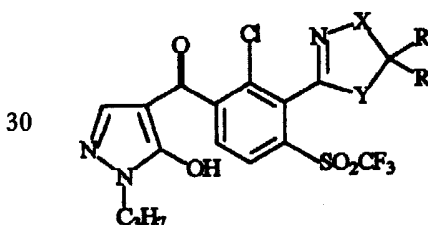
(Ib68)

- съединения Ib69.1-Ib69.126, които се различават от съответните съединения Ib1.1-Ib1.126 по това, че R² означава метилсулфонил, R¹⁶ означава норм-пропил и R¹⁸ означава водород.



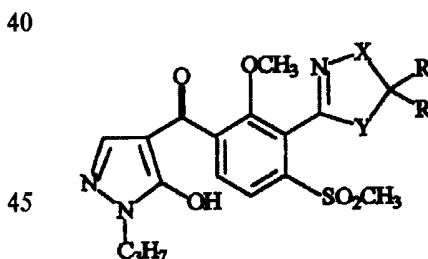
(Ib69)

- съединения Ib70.1-Ib70.126, които се различават от съответните съединения Ib1.1-Ib1.126 по това, че R² означава трифлуорометилсулфонил, R¹⁶ означава норм-пропил и R¹⁸ означава водород.



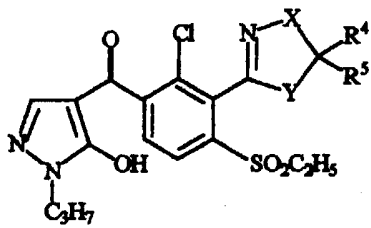
(Ib70)

- съединения Ib71.1-Ib71.126, които се различават от съответните съединения Ib1.1-Ib1.126 по това, че R¹ означава метокси, R² означава метилсулфонил, R¹⁶ означава норм-пропил и R¹⁸ означава водород.



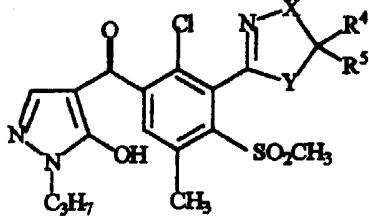
(Ib71)

- съединения Ib72.1-Ib72.126, които се различават от съответните съединения Ib1.1-Ib1.126 по това, че R² означава етилсулфонил, R¹⁶ означава норм-пропил и R¹⁸ означава водород.



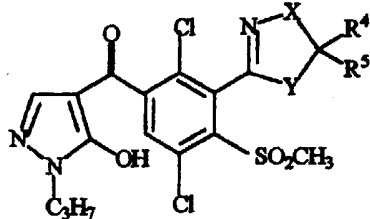
(Ib72)

- съединения Ib73.1-Ib73.126, които се различават от съответните съединения Ib1.1-Ib1.126 по това, че R² означава метилсулфонил, R³ означава метил, R¹⁶ означава норм-пропил и R¹⁸ означава водород.



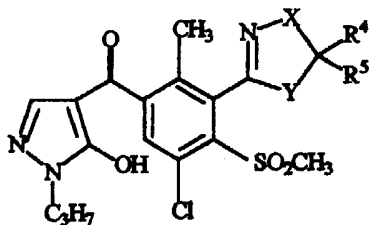
(Ib73)

- съединения Ib74.1-Ib74.126, които се различават от съответните съединения Ib1.1-Ib1.126 по това, че R² означава метилсулфонил, R³ означава хлоро, R¹⁶ означава норм-пропил и R¹⁸ означава водород.



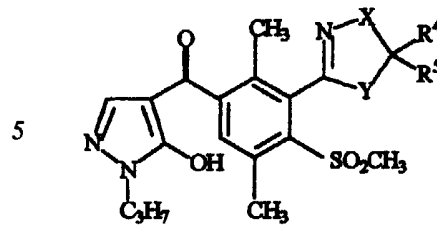
(Ib74)

- съединения Ib75.1-Ib75.126, които се различават от съответните съединения Ib1.1-Ib1.126 по това, че R¹ означава метил, R² означава метилсулфонил, R³ означава хлоро, R¹⁶ означава норм-пропил и R¹⁸ означава водород.



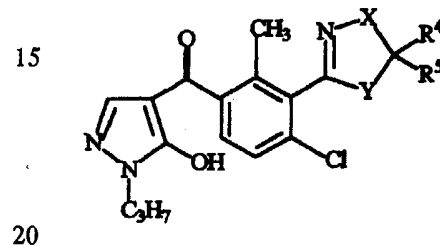
(Ib75)

- съединения Ib76.1-Ib76.126, които се различават от съответните съединения Ib1.1-Ib1.126 по това, че R¹ означава метил, R² означава метилсулфонил, R³ означава метил, R¹⁶ означава норм-пропил и R¹⁸ означава водород.



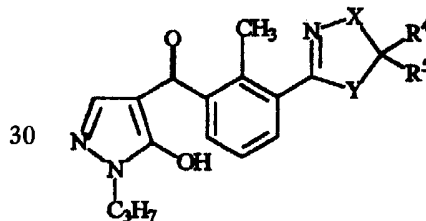
(Ib76)

- съединения Ib77.1-Ib77.126, които се различават от съответните съединения Ib1.1-Ib1.126 по това, че R¹ означава метил, R¹⁶ означава норм-пропил и R¹⁸ означава водород.



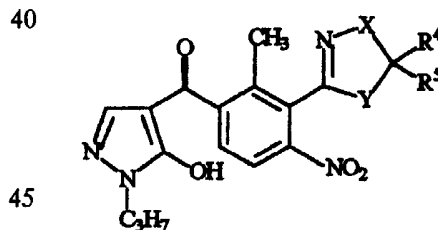
(Ib77)

- съединения Ib78.1-Ib78.126, които се различават от съответните съединения Ib1.1-Ib1.126 по това, че R¹ означава метил, R² означава водород, R¹⁶ означава норм-пропил и R¹⁸ означава водород.



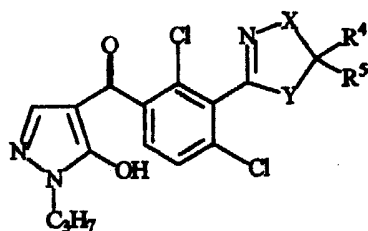
(Ib78)

- съединения Ib79.1-Ib79.126, които се различават от съответните съединения Ib1.1-Ib1.126 по това, че R¹ означава метил, R² означава нитро, R¹⁶ означава норм-пропил и R¹⁸ означава водород.



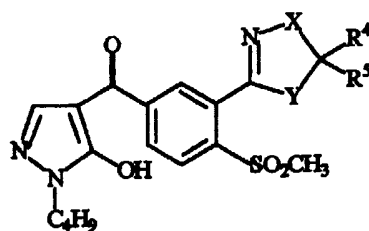
(Ib79)

- съединения Ib80.1-Ib80.126, които се различават от съответните съединения Ib1.1-Ib1.126 по това, че R¹⁶ означава норм-пропил и R¹⁸ означава водород.



(Ib80)

5

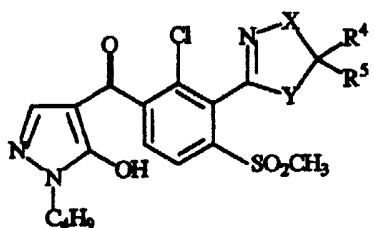


(Ib84)

- съединения Ib81.1-Ib81.126, които се различават от съответните съединения Ib1.1-Ib1.126 по това, че R² означава метилсулфонил, R¹⁶ означава норм-бутил и R¹⁸ означава водород.

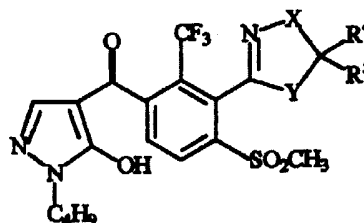
10

- съединения Ib85.1-Ib85.126, които се различават от съответните съединения Ib1.1-Ib1.126 по това, че R¹ означава трифлуорометил, R² означава метилсулфонил, R¹⁶ означава норм-бутил и R¹⁸ означава водород.



(Ib81)

15

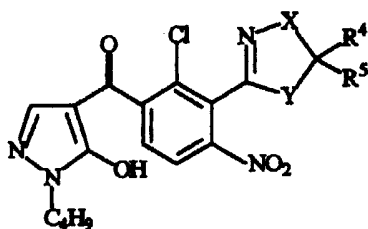


(Ib85)

- съединения Ib82.1-Ib82.126, които се различават от съответните съединения Ib1.1-Ib1.126 по това, че R² означава нитро, R¹⁶ означава норм-бутил и R¹⁸ означава водород.

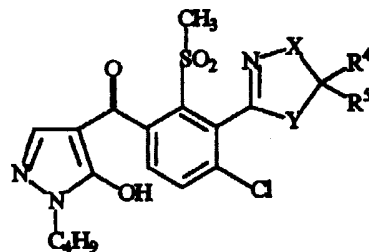
20

- съединения Ib86.1-Ib86.126, които се различават от съответните съединения Ib1.1-Ib1.126 по това, че R¹ означава метилсулфонил, R¹⁶ означава норм-бутил и R¹⁸ означава водород.



(Ib82)

25

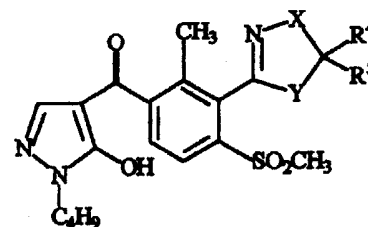


(Ib86)

- съединения Ib83.1-Ib83.126, които се различават от съответните съединения Ib1.1-Ib1.126 по това, че R¹ означава метил, R² означава метилсулфонил, R¹⁶ означава норм-бутил и R¹⁸ означава водород.

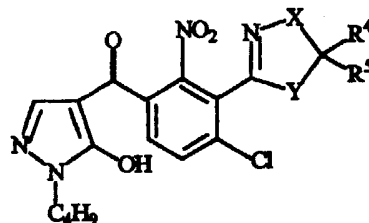
30

- съединения Ib87.1-Ib87.126, които се различават от съответните съединения Ib1.1-Ib1.126 по това, че R¹ означава нитро, R¹⁶ означава норм-бутил и R¹⁸ означава водород.



(Ib83)

35



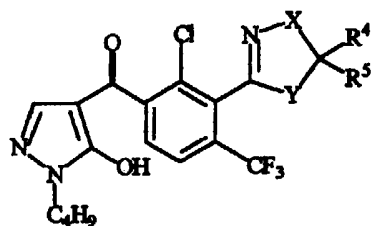
(Ib87)

- съединения Ib84.1-Ib84.126, които се различават от съответните съединения Ib1.1-Ib1.126 по това, че R¹ означава водород, R² означава метилсулфонил, R¹⁶ означава норм-бутил и R¹⁸ означава водород.

40

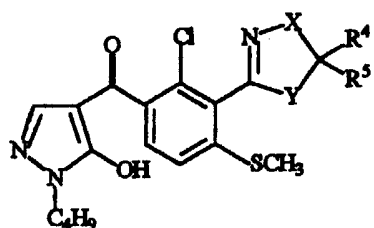
- съединения Ib88.1-Ib88.126, които се различават от съответните съединения Ib1.1-Ib1.126 по това, че R² означава трифлуорометил, R¹⁶ означава норм-бутил и R¹⁸ означава водород.

45



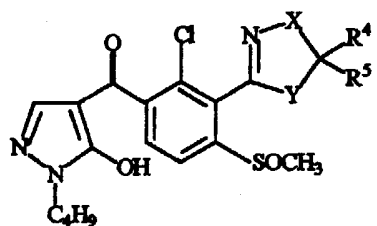
(Ib88)

- съединения Ib89.1-Ib89.126, които се различават от съответните съединения Ib1.1-Ib1.126 по това, че R² означава метилтио, R¹⁶ означава норм-бутил и R¹⁸ означава водород.



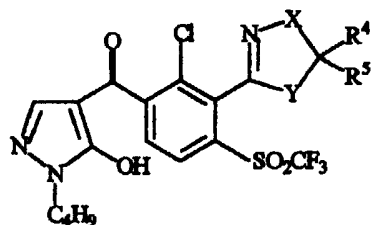
(Ib89)

- съединения Ib90.1-Ib90.126, които се различават от съответните съединения Ib1.1-Ib1.126 по това, че R² означава метилсулфонил, R¹⁶ означава норм-бутил и R¹⁸ означава водород.



(Ib90)

- съединения Ib91.1-Ib91.126, които се различават от съответните съединения Ib1.1-Ib1.126 по това, че R² означава трифлуорометилсулфонил, R¹⁶ означава норм-бутил и R¹⁸ означава водород.



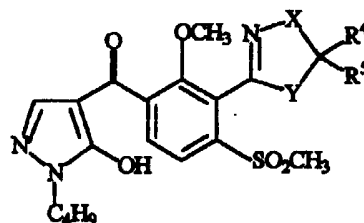
(Ib91)

- съединения Ib92.1-Ib92.126, които се различават от съответните съединения Ib1.1-Ib1.126 по това, че R¹ означава метокси, R² означава метилсулфонил, R¹⁶ означава норм-бутил и R¹⁸ означава водород.



(Ib92)

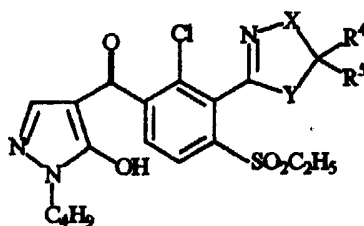
5



(Ib92)

- съединения Ib93.1-Ib93.126, които се различават от съответните съединения Ib1.1-Ib1.126 по това, че R² означава етилсулфонил, R¹⁶ означава норм-бутил и R¹⁸ означава водород.

15

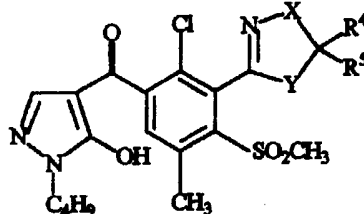


(Ib93)

20

- съединения Ib94.1-Ib94.126, които се различават от съответните съединения Ib1.1-Ib1.126 по това, че R² означава метилсулфонил, R³ означава метил, R¹⁶ означава норм-бутил и R¹⁸ означава водород.

25

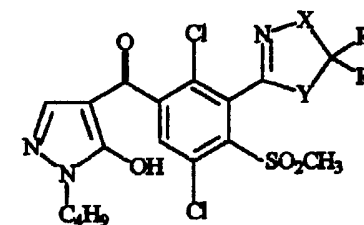


(Ib94)

30

- съединения Ib95.1-Ib1.126, които се различават от съответните съединения Ib1.1-Ib1.126 по това, че R² означава метилсулфонил, R³ означава хлоро, R¹⁶ означава норм-бутил и R¹⁸ означава водород.

35



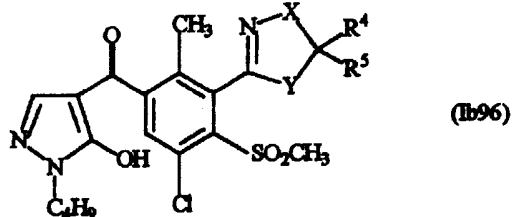
(Ib95)

40

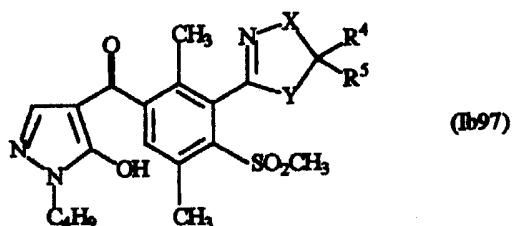
- съединения Ib96.1-Ib96.126, които се различават от съответните съединения Ib1.1-Ib1.126 по това, че R¹ означава метил, R² оз-

45

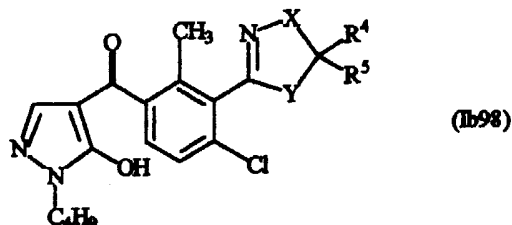
начава метилсулфонил, R^3 означава хлоро, R^{16} означава норм-бутил и R^{18} означава водород.



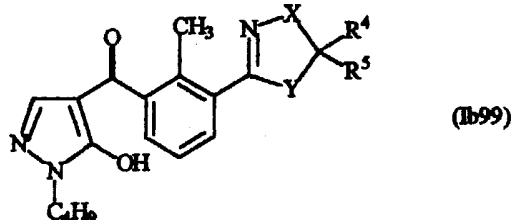
- съединения Ib97.1-Ib97.126, които се различават от съответните съединения Ib1.1-Ib1.126 по това, че R^1 означава метил, R^2 означава метилсулфонил, R^3 означава метил, R^{16} означава норм-бутил и R^{18} означава водород.



- съединения Ib98.1-Ib98.126, които се различават от съответните съединения Ib1.1-Ib1.126 по това, че R^1 означава метил, R^{16} означава норм-бутил и R^{18} означава водород.

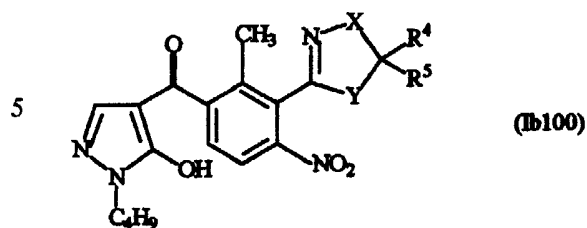


- съединения Ib99.1-Ib99.126, които се различават от съответните съединения Ib1.1-Ib1.126 по това, че R^1 означава метил, R^2 означава водород, R^{16} означава норм-бутил и R^{18} означава водород.

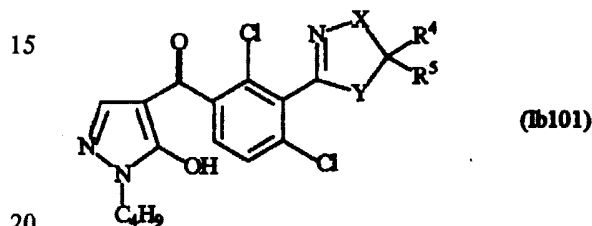


- съединения Ib100.1-Ib100.126, които се различават от съответните съединения Ib1.1-Ib1.126 по това, че R^1 означава метил, R^2 означава нитро, R^{16} означава норм-бутил и R^{18}

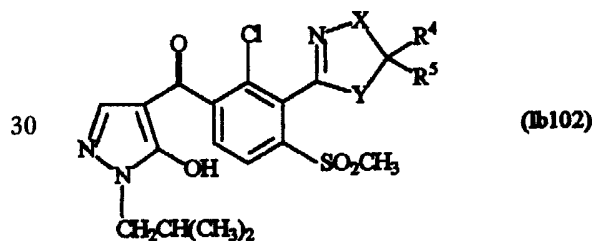
означава водород.



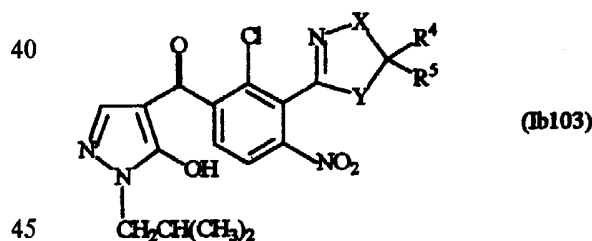
5 - съединения Ib101.1-Ib101.126, които се различават от съответните съединения Ib1.1-Ib1.126 по това, че R^{16} означава норм-бутил и R^{18} означава водород.



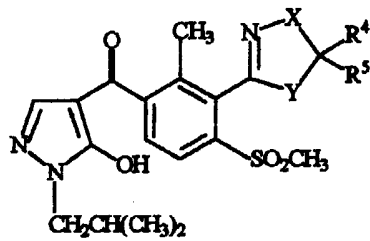
10 - съединения Ib102.1-Ib102.126, които се различават от съответните съединения Ib1.1-Ib1.126 по това, че R^2 означава метилсулфонил, R^{16} означава изобутил и R^{18} означава водород.



15 - съединения Ib103.1-Ib103.126, които се различават от съответните съединения Ib1.1-Ib1.126 по това, че R^2 означава нитро, R^{16} означава изобутил и R^{18} означава водород.

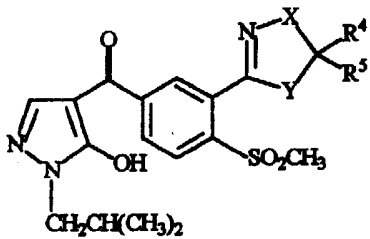


20 - съединения Ib104.1-Ib104.126, които се различават от съответните съединения Ib1.1-Ib1.126 по това, че R^1 означава метил, R^2 означава метилсулфонил, R^{16} означава изобутил и R^{18} означава водород.



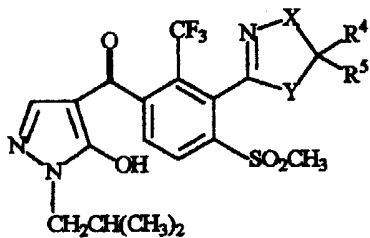
(Ib104)

- съединения Ib105.1-Ib105.126, които се различават от съответните съединения Ib1.1-Ib1.126 по това, че R¹ означава водород, R² означава метилсулфонил, R¹⁶ означава изобутил и R¹⁸ означава водород.



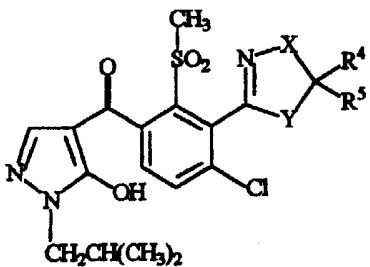
(Ib105)

- съединения Ib106.1-Ib106.126, които се различават от съответните съединения Ib1.1-Ib1.126 по това, че R¹ означава трифлуорометил, R² означава метилсулфонил, R¹⁶ означава изобутил и R¹⁸ означава водород.



(Ib106)

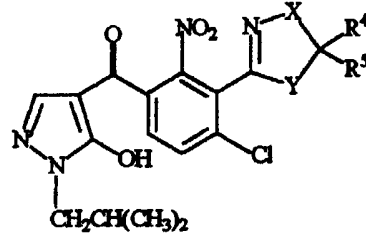
- съединения Ib107.1-Ib107.126, които се различават от съответните съединения Ib1.1-Ib1.126 по това, че R¹ означава метилсулфонил, R¹⁶ означава изобутил и R¹⁸ означава водород.



(Ib107)

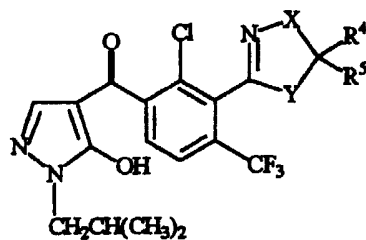
- съединения Ib108.1-Ib108.126, които се различават от съответните съединения Ib1.1-Ib1.126 по това, че R¹ означава нитро, R¹⁶ оз-

начава изобутил и R¹⁸ означава водород.



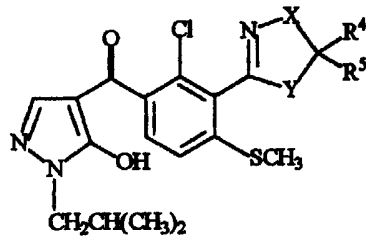
(Ib108)

- съединения Ib109.1-Ib109.126, които се различават от съответните съединения Ib1.1-Ib1.126 по това, че R² означава трифлуорометил, R¹⁶ означава изобутил и R¹⁸ означава водород.



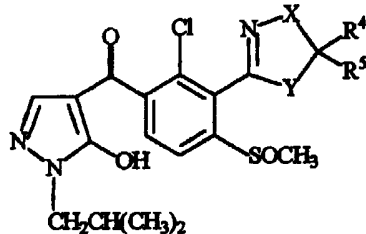
(Ib109)

- съединения Ib110.1-Ib110.126, които се различават от съответните съединения Ib1.1-Ib1.126 по това, че R² означава метилтио, R¹⁶ означава изобутил и R¹⁸ означава водород.



(Ib110)

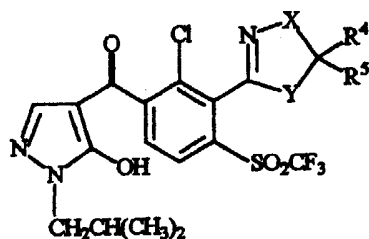
- съединения Ib111.1-Ib111.126, които се различават от съответните съединения Ib1.1-Ib1.126 по това, че R² означава метилсулфонил, R¹⁶ означава изобутил и R¹⁸ означава водород.



(Ib111)

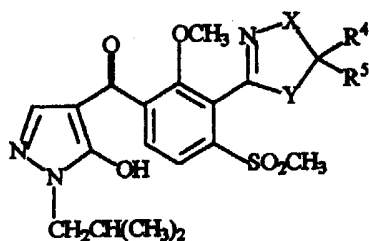
- съединения Ib112.1-Ib112.126, които се различават от съответните съединения Ib1.1-Ib1.126 по това, че R² означава трифлуороме-

тилсулфонил, R¹⁶ означава изобутил и R¹⁸ означава водород.



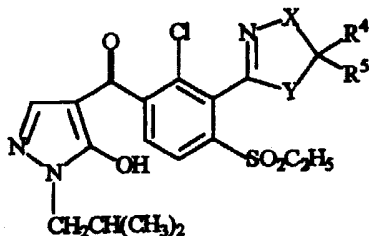
(Ib112)

- съединения Ib113.1-Ib113.126, които се различават от съответните съединения Ib1.1-Ib1.126 по това, че R¹ означава метокси, R² означава метилсулфонил, R¹⁶ означава изобутил и R¹⁸ означава водород.



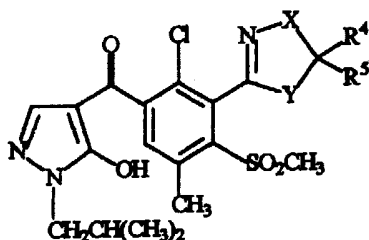
(Ib113)

- съединения Ib114.1-Ib114.126, които се различават от съответните съединения Ib1.1-Ib1.126 по това, че R² означава етилсулфонил, R¹⁶ означава изобутил и R¹⁸ означава водород.



(Ib114)

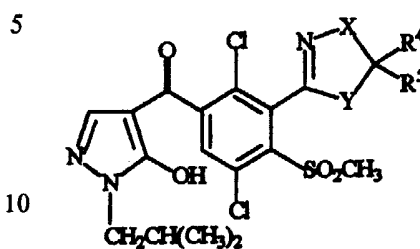
- съединения Ib115.1-Ib115.126, които се различават от съответните съединения Ib1.1-Ib1.126 по това, че R² означава метилсулфонил, R³ означава метил, R¹⁶ означава изобутил и R¹⁸ означава водород.



(Ib115)

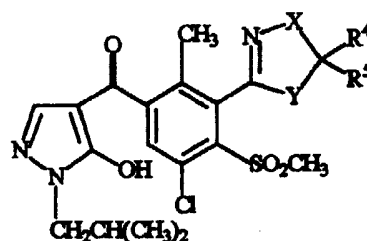
- съединения Ib116.1-Ib116.126, които се различават от съответните съединения Ib1.1-

Ib1.126 по това, че R² означава метилсулфонил, R³ означава хлоро, R¹⁶ означава изобутил и R¹⁸ означава водород.



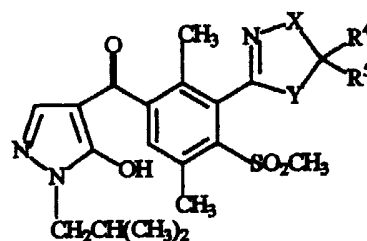
(Ib116)

- съединения Ib117.1-Ib117.126, които се различават от съответните съединения Ib1.1-Ib1.126 по това, че R¹ означава метил, R² означава метилсулфонил, R³ означава хлоро, R¹⁶ означава изобутил и R¹⁸ означава водород.



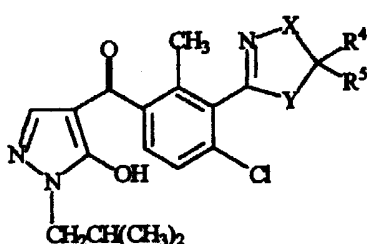
(Ib117)

- съединения Ib118.1-Ib118.126, които се различават от съответните съединения Ib1.1-Ib1.126 по това, че R¹ означава метил, R² означава метилсулфонил, R³ означава метил, R¹⁶ означава изобутил и R¹⁸ означава водород.



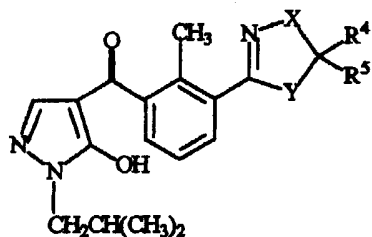
(Ib118)

- съединения Ib119.1-Ib119.126, които се различават от съответните съединения Ib1.1-Ib1.126 по това, че R¹ означава метил, R¹⁶ означава изобутил и R¹⁸ означава водород.



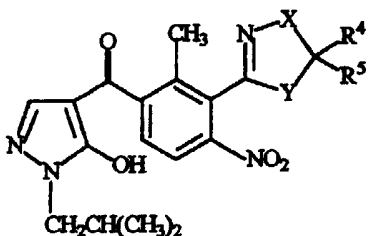
(Ib119)

- съединения Ib120.1-Ib120.126, които се различават от съответните съединения Ib1.1-Ib1.126 по това, че R¹ означава метил, R² означава водород, R¹⁶ означава изобутил и R¹⁸ означава водород.



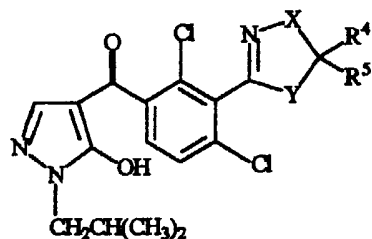
(Ib120)

- съединения Ib121.1-Ib121.126, които се различават от съответните съединения Ib1.1-Ib1.126 по това, че R¹ означава метил, R² означава нитро, R¹⁶ означава изобутил и R¹⁸ означава водород.



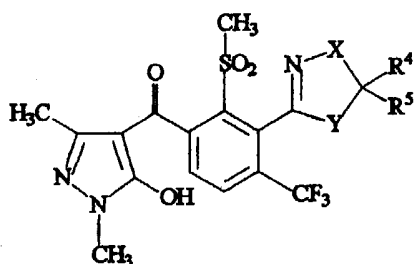
(Ib121)

- съединения Ib122.1-Ib122.126, които се различават от съответните съединения Ib1.1-Ib1.126 по това, че R¹⁶ означава изобутил и R¹⁸ означава водород.



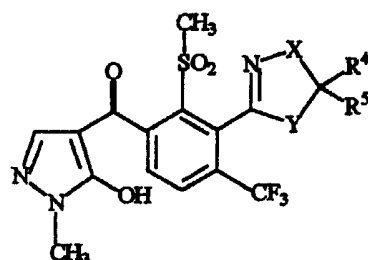
(Ib122)

- съединения Ib123.1-Ib123.126, които се различават от съответните съединения Ib1.1-Ib1.126 по това, че R¹ означава метилсулфонил и R² означава трифлуорометил.



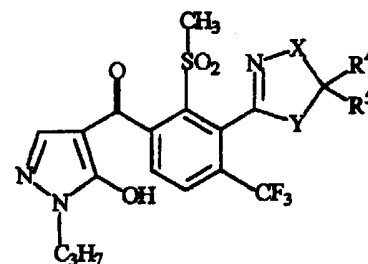
(Ib123)

- съединения Ib124.1-Ib124.126, които се различават от съответните съединения Ib1.1-Ib1.126 по това, че R¹ означава метилсулфонил и R² означава трифлуорометил и R¹⁸ означава водород.



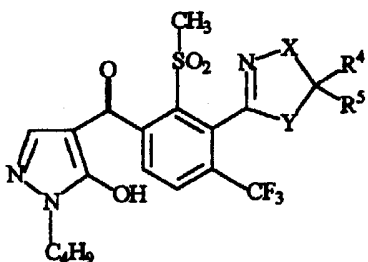
(Ib124)

- съединения Ib125.1-Ib125.126, които се различават от съответните съединения Ib1.1-Ib1.126 по това, че R¹ означава метилсулфонил и R² означава трифлуорометил, R¹⁶ означава норм-пропил и R¹⁸ означава водород.



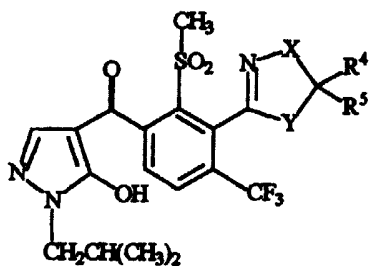
(Ib125)

- съединения Ib126.1-Ib126.126, които се различават от съответните съединения Ib1.1-Ib1.126 по това, че R¹ означава метилсулфонил и R² означава трифлуорометил, R¹⁶ означава норм-бутил и R¹⁸ означава водород.



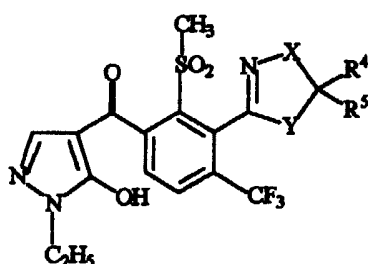
(Ib126)

- съединения Ib127.1-Ib127.126, които се различават от съответните съединения Ib1.1-Ib1.126 по това, че R¹ означава метилсулфонил и R² означава трифлуорометил, R¹⁶ означава изобутил и R¹⁸ означава водород.



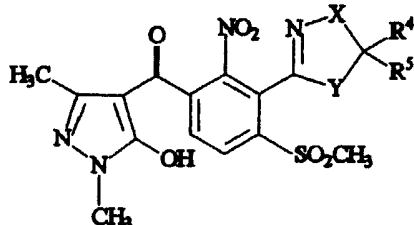
(Ib127)

- съединения Ib128.1-Ib128.126, които се различават от съответните съединения Ib1.1-Ib1.126 по това, че R¹ означава метилсулфонил и R² означава трифлуорометил, R¹⁶ означава етил и R¹⁸ означава водород.



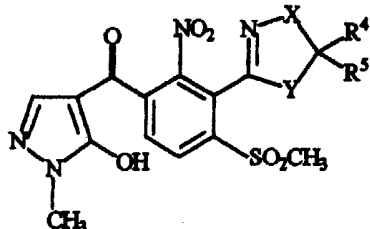
(Ib128)

- съединения Ib129.1-Ib129.126, които се различават от съответните съединения Ib1.1-Ib1.126 по това, че R¹ означава нитро и R² означава метилсулфонил.



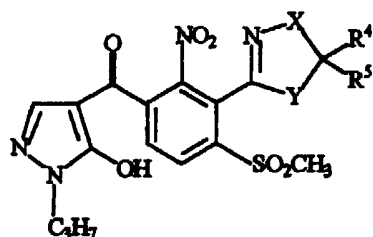
(Ib129)

- съединения Ib130.1-Ib130.126, които се различават от съответните съединения Ib1.1-Ib1.126 по това, че R¹ означава нитро, R² означава метилсулфонил и R¹⁸ означава водород.



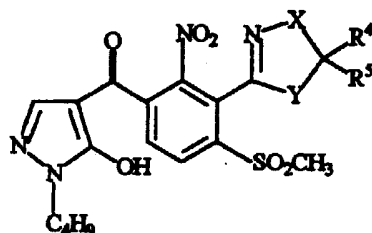
(Ib130)

- съединения Ib131.1-Ib131.126, които се различават от съответните съединения Ib1.1-Ib1.126 по това, че R¹ означава нитро, означава метилсулфонил, R¹⁶ означава норм-пропил и R¹⁸ означава водород.



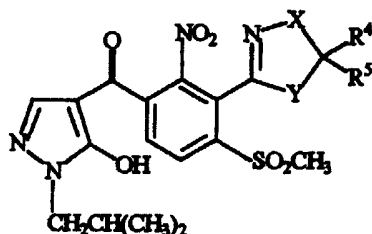
(Ib131)

- съединения Ib132.1-Ib132.126, които се различават от съответните съединения Ib1.1-Ib1.126 по това, че R¹ означава нитро, R² означава метилсулфонил, R¹⁶ означава норм-бутил и R¹⁸ означава водород.



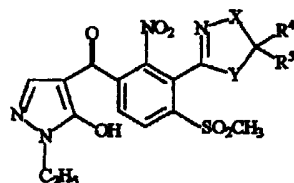
(Ib132)

- съединения Ib133.1-Ib133.126, които се различават от съответните съединения Ib1.1-Ib1.126 по това, че R¹ означава нитро, R² означава метилсулфонил, R¹⁶ означава изобутил и R¹⁸ означава водород.



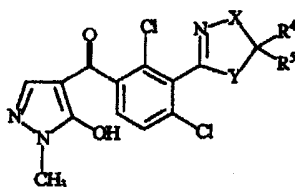
(Ib133)

- съединения Ib134.1-Ib134.126, които се различават от съответните съединения Ib1.1-Ib1.126 по това, че R¹ означава нитро, R² означава метилсулфонил, R¹⁶ означава етил и R¹⁸ означава водород.



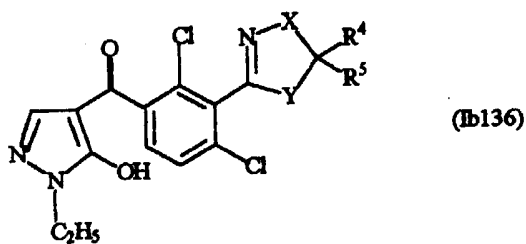
(Ib134)

- съединения Ib135.1-Ib135.126, които се различават от съответните съединения Ib1.1-Ib1.126 по това, че R¹⁸ означава водород.

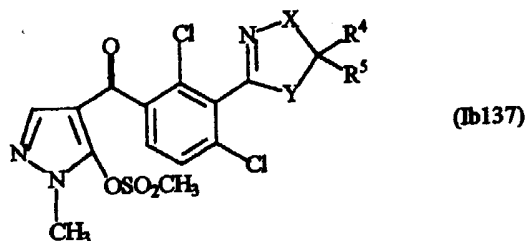


(Ib135)

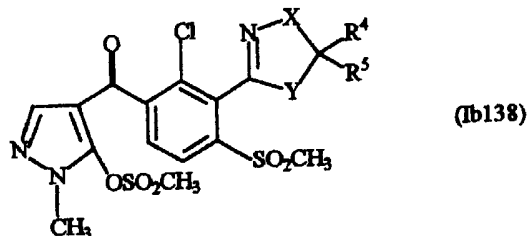
- съединения Ib136.1-Ib136.126, които се различават от съответните съединения Ib1.1-Ib1.126 по това, че R¹⁶ означава етил и R¹⁸ означава водород.



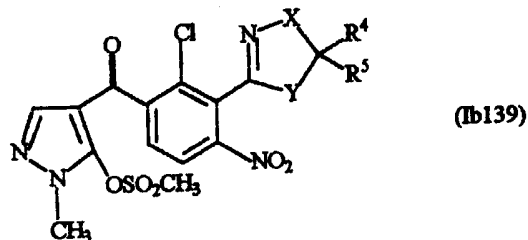
- съединения Ib137.1-Ib137.126, които се различават от съответните съединения Ib1.1-Ib1.126 по това, че Z означава метилсулфонил и R¹⁸ означава водород.



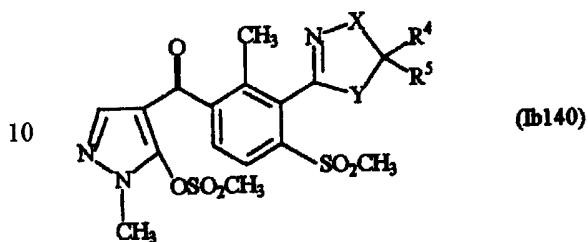
- съединения Ib138.1-Ib138.126, които се различават от съответните съединения Ib1.1-Ib1.126 по това, че R² означава метилсулфонил, Z означава метилсулфонил и R¹⁸ означава водород.



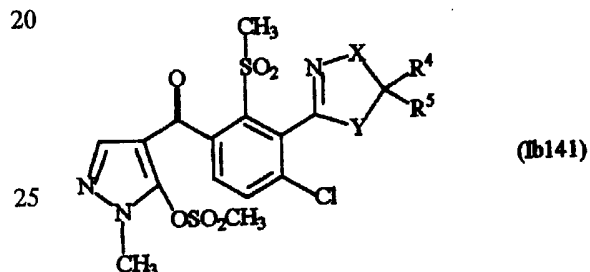
- съединения Ib139.1-Ib139.126, които се различават от съответните съединения Ib1.1-Ib1.126 по това, че R² означава нитро, Z означава метилсулфонил и R¹⁸ означава водород.



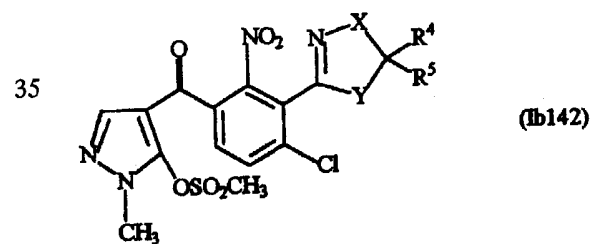
- съединения Ib140.1-Ib140.126, които се различават от съответните съединения Ib1.1-Ib1.126 по това, че R¹ означава метил, R² означава метилсулфонил, Z означава метилсулфонил и R¹⁸ означава водород.



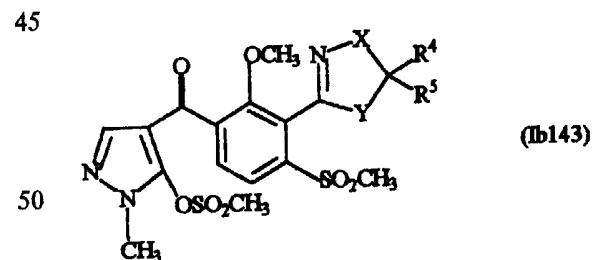
- съединения Ib141.1-Ib141.126, които се различават от съответните съединения Ib1.1-Ib1.126 по това, че R¹ означава метилсулфонил, Z означава метилсулфонил и R¹⁸ означава водород.



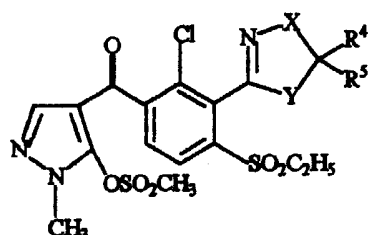
- съединения Ib142.1-Ib142.126, които се различават от съответните съединения Ib1.1-Ib1.126 по това, че R¹ означава нитро, Z означава метилсулфонил и R¹⁸ означава водород.



- съединения Ib143.1-Ib143.126, които се различават от съответните съединения Ib1.1-Ib1.126 по това, че R¹ означава метокси, R² и Z означават метилсулфонил и R¹⁸ означава водород.

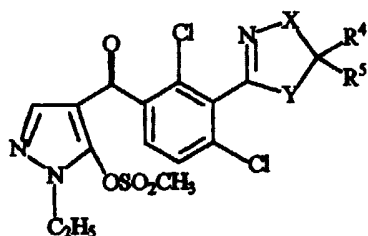


- съединения Ib144.1-Ib144.126, които се различават от съответните съединения Ib1.1-Ib1.126 по това, че R² означава етилсулфонил, Z означава метилсулфонил и R¹⁸ означава водород.



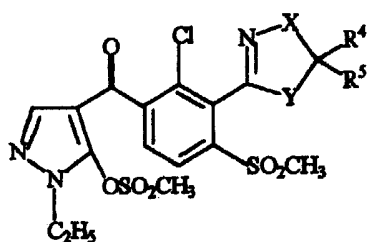
(Ib144)

- съединения Ib145.1-Ib145.126, които се различават от съответните съединения Ib1.1-Ib1.126 по това, че R¹⁶ означава етил, Z означава метилсулфонил и R¹⁸ означава водород.



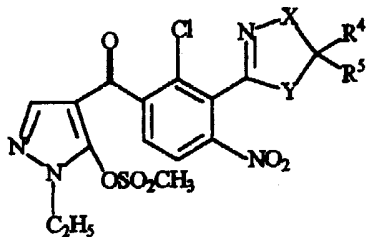
(Ib145)

- съединения Ib146.1-Ib146.126, които се различават от съответните съединения Ib1.1-Ib1.126 по това, че R² означава метилсулфонил, R¹⁶ означава етил, Z означава метилсулфонил и R¹⁸ означава водород.



(Ib146)

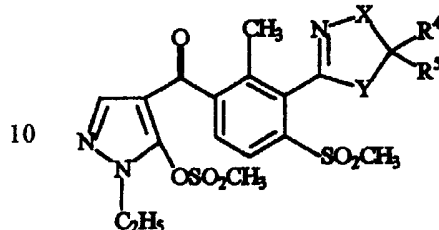
- съединения Ib147.1-Ib147.126, които се различават от съответните съединения Ib1.1-Ib1.126 по това, че R² означава нитро, R¹⁶ означава етил, Z означава метилсулфонил и R¹⁸ означава водород.



(Ib147)

- съединения Ib148.1-Ib148.126, които се различават от съответните съединения Ib1.1-Ib1.126 по това, че R¹ означава метил, R² означава метилсулфонил, R¹⁶ означава етил, Z означава метилсулфонил и R¹⁸ означава водород.

5

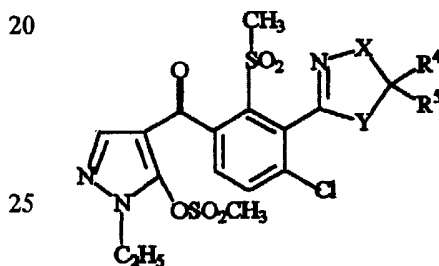


(Ib148)

10

- съединения Ib149.1-Ib149.126, които се различават от съответните съединения Ib1.1-Ib1.126 по това, че R¹ означава метилсулфонил, R¹⁶ означава етил, Z означава метилсулфонил и R¹⁸ означава водород.

15



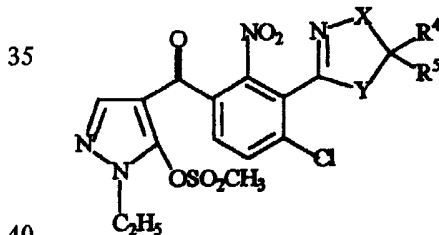
(Ib149)

20

25

- съединения Ib150.1-Ib150.126, които се различават от съответните съединения Ib1.1-Ib1.126 по това, че R¹ означава нитро, R¹⁶ означава етил, Z означава метилсулфонил и R¹⁸ означава водород.

30



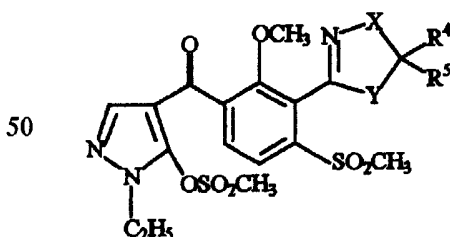
(Ib150)

35

40

- съединения Ib151.1-Ib151.126, които се различават от съответните съединения Ib1.1-Ib1.126 по това, че R¹ означава метокси, R² означава метилсулфонил, R¹⁶ означава етил, Z означава метилсулфонил и R¹⁸ означава водород.

45

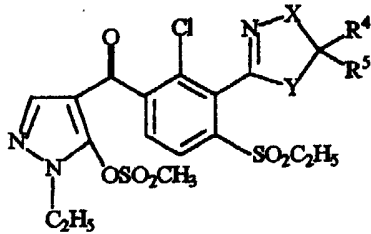


(Ib151)

50

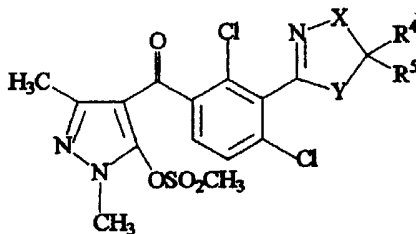
43

- съединения Ib152.1-Ib152.126, които се различават от съответните съединения Ib1.1-Ib1.126 по това, че R² означава етилсулфонил, R¹⁶ означава етил, Z означава метилсулфонил и R¹⁸ означава водород.



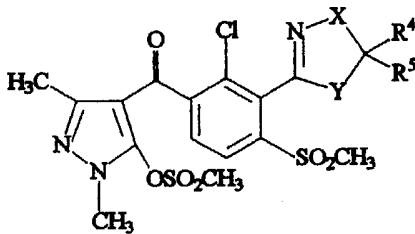
(Ib152)

- съединения Ib153.1-Ib153.126, които се различават от съответните съединения Ib1.1-Ib1.126 по това, че Z означава метилсулфонил.



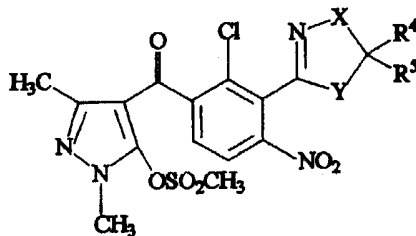
(Ib153)

- съединения Ib154.1-Ib154.126, които се различават от съответните съединения Ib1.1-Ib1.126 по това, че R² и Z означават метилсулфонил.



(Ib154)

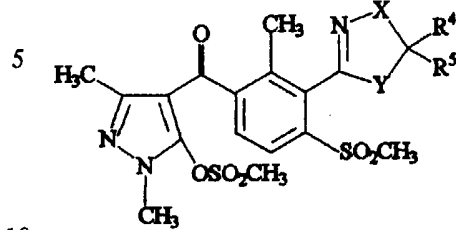
- съединения Ib155.1-Ib155.126, които се различават от съответните съединения Ib1.1-Ib1.126 по това, че R² означава нитро и Z означава метилсулфонил.



(Ib155)

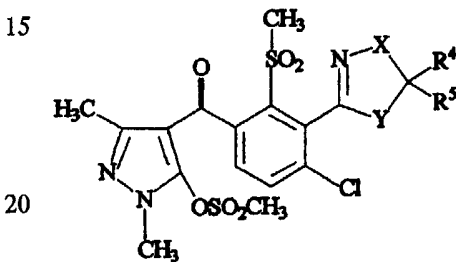
- съединения Ib156.1-Ib156.126, които се различават от съответните съединения Ib1.1-

Ib1.126 по това, че R¹ означава метил и R² и Z означават метилсулфонил.



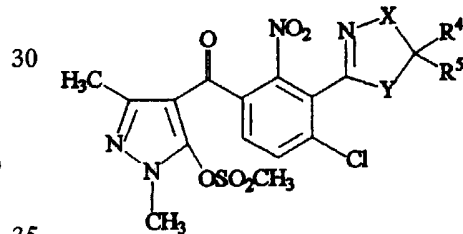
(Ib156)

- съединения Ib157.1-Ib157.126, които се различават от съответните съединения Ib1.1-Ib1.126 по това, че R и Z означават метилсулфонил.



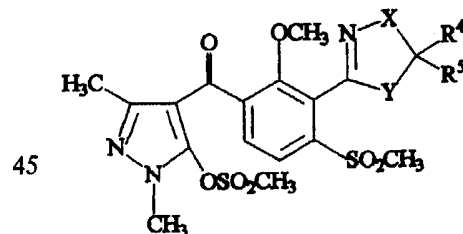
(Ib157)

- съединения Ib158.1-Ib158.126, които се различават от съответните съединения Ib1.1-Ib1.126 по това, че R¹ означава нитро и Z означава метилсулфонил.



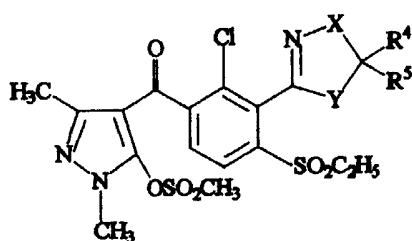
(Ib158)

- съединения Ib159.1-Ib159.126, които се различават от съответните съединения Ib1.1-Ib1.126 по това, че R¹ означава метокси, R² и Z означават метилсулфонил.



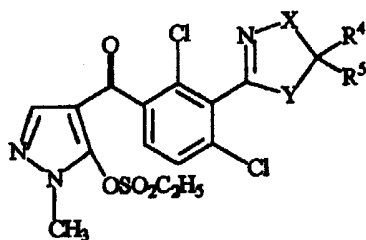
(Ib159)

- съединения Ib160.1-Ib160.126, които се различават от съответните съединения Ib1.1-Ib1.126 по това, че R² означава етилсулфонил и Z означава метилсулфонил.



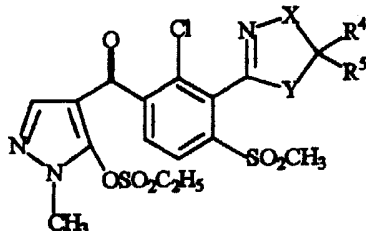
(Ib160) 5

- съединения Ib161.1-Ib161.126, които се различават от съответните съединения Ib1.1-Ib1.126 по това, че Z означава етилсулфонил и R¹⁸ означава водород.



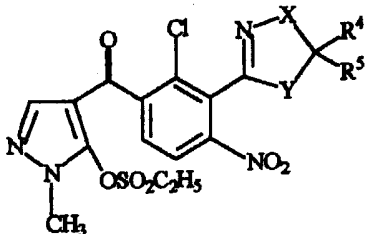
(Ib161) 15

- съединения Ib162.1-Ib162.126, които се различават от съответните съединения Ib1.1-Ib1.126 по това, че R² означава метилсулфонил, Z означава етилсулфонил и R¹⁸ означава водород.



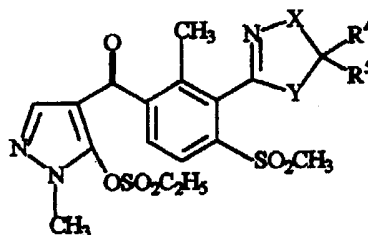
(Ib162) 20

- съединения Ib163.1-Ib163.126, които се различават от съответните съединения Ib1.1-Ib1.126 по това, че R² означава нитро, Z означава етилсулфонил и R¹⁸ означава водород.



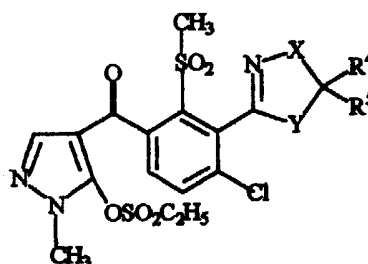
(Ib163) 25

- съединения Ib164.1-Ib164.126, които се различават от съответните съединения Ib1.1-Ib1.126 по това, че R¹ означава метил, R² означава метилсулфонил, Z означава етилсулфонил и R¹⁸ означава водород.



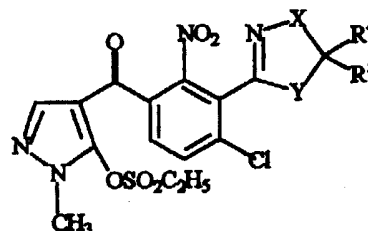
(Ib164) 30

- съединения Ib165.1-Ib165.126, които се различават от съответните съединения Ib1.1-Ib1.126 по това, че R¹ означава метилсулфонил, Z означава етилсулфонил и R¹⁸ означава водород.



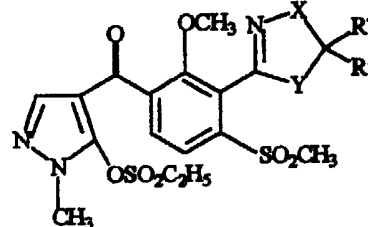
(Ib165) 35

- съединения Ib166.1-Ib166.126, които се различават от съответните съединения Ib1.1-Ib1.126 по това, че R¹ означава нитро, Z означава етилсулфонил и R¹⁸ означава водород.



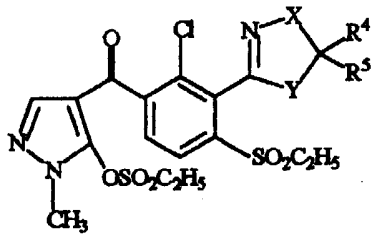
(Ib166) 40

- съединения Ib167.1-Ib167.126, които се различават от съответните съединения Ib1.1-Ib1.126 по това, че R¹ означава метокси, R² означава метилсулфонил, Z означава етилсулфонил и R¹⁸ означава водород.



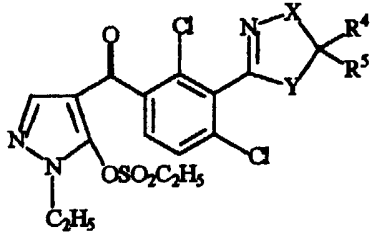
(Ib167) 45

- съединения Ib168.1-Ib168.126, които се различават от съответните съединения Ib1.1-Ib1.126 по това, че R² и Z означават етилсулфонил и R¹⁸ означава водород.



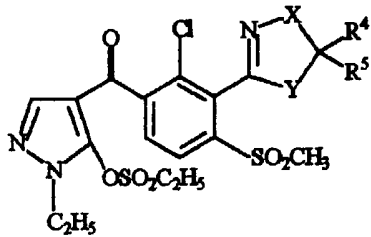
(Ib168)

- съединения Ib169.1-Ib169.126, които се различават от съответните съединения Ib1.1-Ib1.126 по това, че R¹⁶ означава етил, Z означава етилсулфонил и R¹⁸ означава водород.



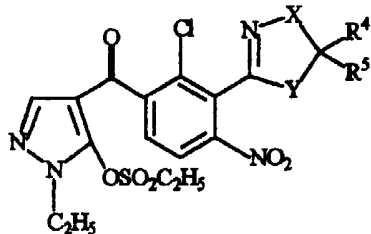
(Ib169)

- съединения Ib170.1-Ib170.126, които се различават от съответните съединения Ib1.1-Ib1.126 по това, че R² означава метилсулфонил, R¹⁶ означава етил, Z означава етилсулфонил и R¹⁸ означава водород.



(Ib170)

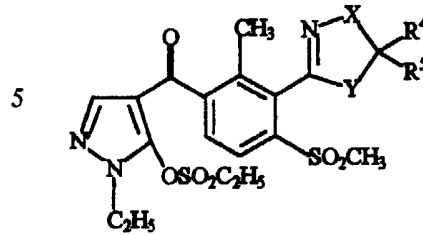
- съединения Ib171.1-Ib171.126, които се различават от съответните съединения Ib1.1-Ib1.126 по това, че R² означава нитро, R¹⁶ означава етил, Z означава етилсулфонил и R¹⁸ означава водород.



(Ib171)

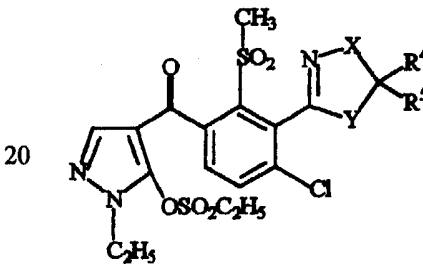
- съединения Ib172.1-Ib172.126, които се различават от съответните съединения Ib1.1-Ib1.126 по това, че R¹ означава метил, R² означава метилсулфонил, R¹⁶ означава етил, Z означава

начева етилсулфонил и R¹⁸ означава водород.



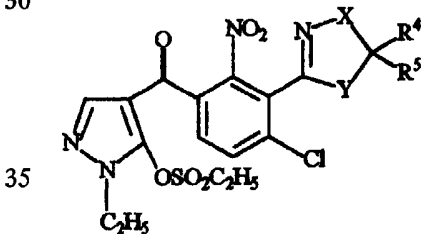
(Ib172)

- съединения Ib173.1-Ib173.126, които се различават от съответните съединения Ib1.1-Ib1.126 по това, че R¹ означава метилсулфонил, R¹⁶ означава етил, Z означава етилсулфонил и R¹⁸ означава водород.



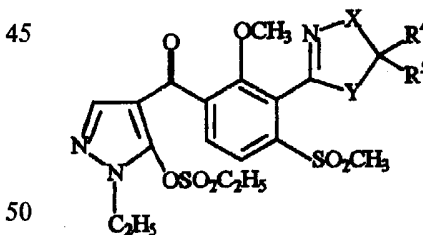
(Ib173)

- съединения Ib174.1-Ib174.126, които се различават от съответните съединения Ib1.1-Ib1.126 по това, че R¹ означава нитро, R¹⁶ означава етил, Z означава етилсулфонил и R¹⁸ означава водород.



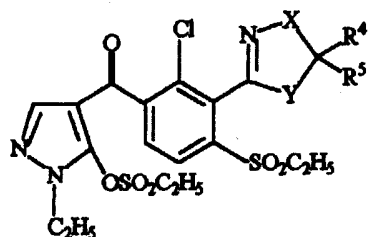
(Ib174)

- съединения Ib175.1-Ib175.126, които се различават от съответните съединения Ib1.1-Ib1.126 по това, че R¹ означава метокси, R² означава метилсулфонил, R¹⁶ означава етил, Z означава етилсулфонил и R¹⁸ означава водород.



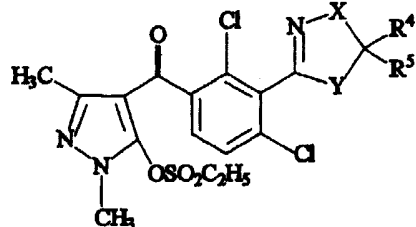
(Ib175)

- съединения Ib176.1-Ib176.126, които се различават от съответните съединения Ib1.1-Ib1.126 по това, че R² означава етилсулфонил, R¹⁶ означава етил, Z означава етилсулфонил и R¹⁸ означава водород.



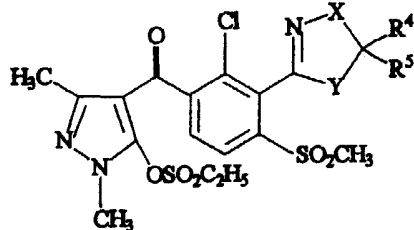
(Ib176)

- съединения Ib177.1-Ib177.126, които се различават от съответните съединения Ib1.1-Ib1.126 по това, че Z означава етилсулфонил.



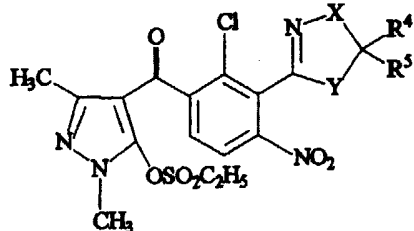
(Ib177)

- съединения Ib178.1-Ib178.126, които се различават от съответните съединения Ib1.1-Ib1.126 по това, че R² означава метилсулфонил и Z означава етилсулфонил.



(Ib178)

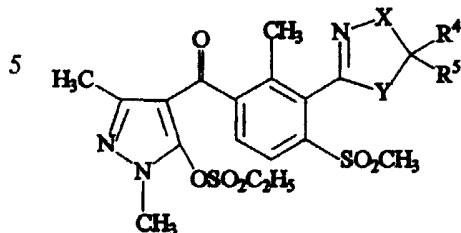
- съединения Ib179.1-Ib179.126, които се различават от съответните съединения Ib1.1-Ib1.126 по това, че R² означава нитро и Z означава етилсулфонил.



(Ib179)

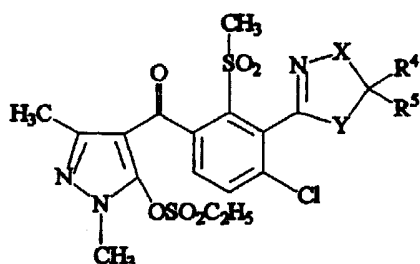
- съединения Ib180.1-Ib180.126, които се различават от съответните съединения Ib1.1-

Ib1.126 по това, че R¹ означава метил, R² означава метилсулфонил и Z означава етилсулфонил.



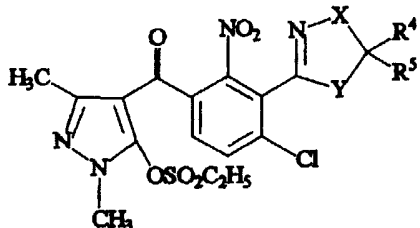
(Ib180)

- съединения Ib181.1-Ib181.126, които се различават от съответните съединения Ib1.1-Ib1.126 по това, че R¹ означава метилсулфонил и Z означава етилсулфонил.



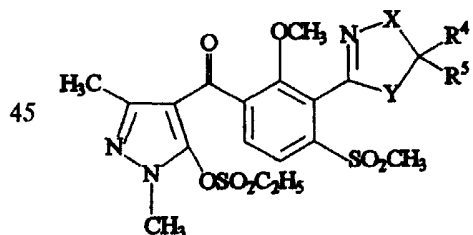
(Ib181)

- съединения Ib182.1-Ib182.126, които се различават от съответните съединения Ib1.1-Ib1.126 по това, че R¹ означава нитро и Z означава етилсулфонил.



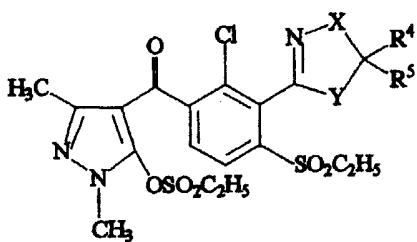
(Ib182)

- съединения Ib183.1-Ib183.126, които се различават от съответните съединения Ib1.1-Ib1.126 по това, че R¹ означава метокси, R² означава метилсулфонил и Z означава етилсулфонил.



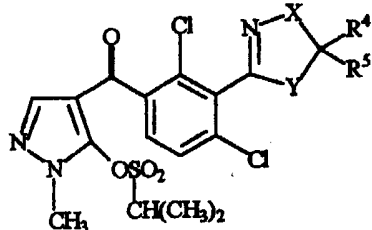
(Ib183)

- съединения Ib184.1-Ib184.126, които се различават от съответните съединения Ib1.1-Ib1.126 по това, че R² и Z означават етилсулфонил.



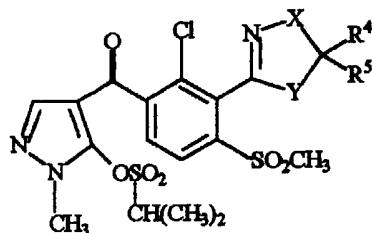
(Ib184)

- съединения Ib185.1-Ib185.126, които се различават от съответните съединения Ib1.1-Ib1.126 по това, че Z означава изопропилсулфонил и R¹⁸ означава водород.



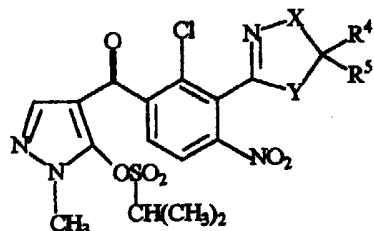
(Ib185)

- съединения Ib186.1-Ib186.126, които се различават от съответните съединения Ib1.1-Ib1.126 по това, че R² означава метилсулфонил, Z означава изопропилсулфонил и R¹⁸ означава водород.



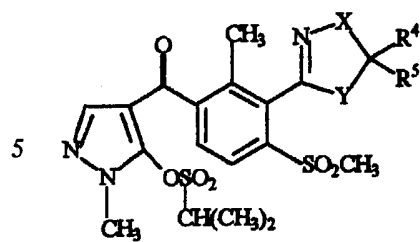
(Ib186)

- съединения Ib187.1-Ib187.126, които се различават от съответните съединения Ib1.1-Ib1.126 по това, че R² означава нитро, Z означава изопропилсулфонил и R¹⁸ означава водород.



(Ib187)

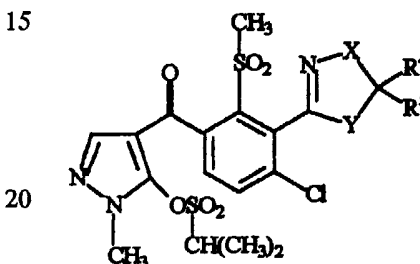
- съединения Ib188.1-Ib188.126, които се различават от съответните съединения Ib1.1-Ib1.126 по това, че R¹ означава метил, R² означава метилсулфонил, Z означава изопропилсулфонил и R¹⁸ означава водород.



(Ib184)

(Ib188)

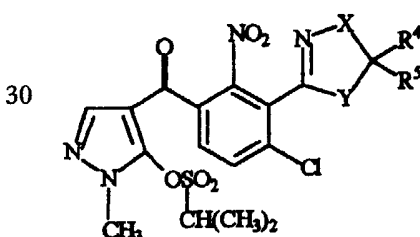
- съединения Ib189.1-Ib189.126, които се различават от съответните съединения Ib1.1-Ib1.126 по това, че R¹ означава метилсулфонил, Z означава изопропилсулфонил и R¹⁸ означава водород.



15

(Ib189)

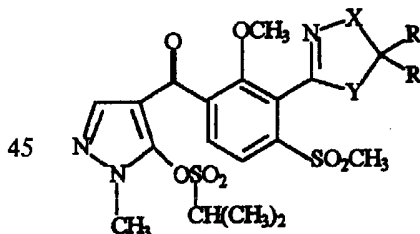
- съединения Ib190.1-Ib190.126, които се различават от съответните съединения Ib1.1-Ib1.126 по това, че R¹ означава нитро, Z означава изопропилсулфонил и R¹⁸ означава водород.



20

(Ib190)

- съединения Ib191.1-Ib191.126, които се различават от съответните съединения Ib1.1-Ib1.126 по това, че R¹ означава метокси, R² означава метилсулфонил, Z означава изопропилсулфонил и R¹⁸ означава водород.



30

(Ib191)

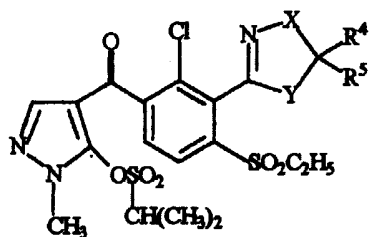
- съединения Ib192.1-Ib192.126, които се различават от съответните съединения Ib1.1-Ib1.126 по това, че R² означава етилсулфонил, Z означава изопропилсулфонил и R¹⁸ оз-

35

40

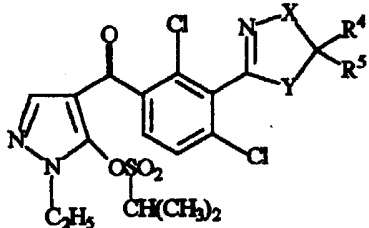
45

начава водород.



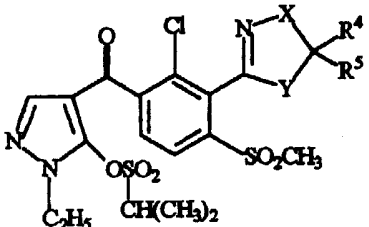
(Ib192)

- съединения Ib193.1-Ib193.126, които се различават от съответните съединения Ib1.1-Ib1.126 по това, че R¹⁶ означава етил, Z означава изопропилсулфонил и R¹⁸ означава водород.



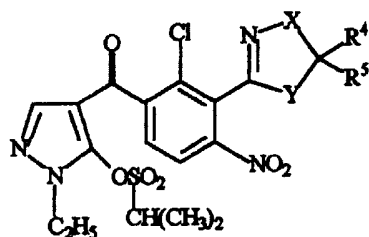
(Ib193)

- съединения Ib194.1-Ib194.126, които се различават от съответните съединения Ib1.1-Ib1.126 по това, че R² означава метилсулфонил, R¹⁶ означава етил, Z означава изопропилсулфонил и R¹⁸ означава водород.



(Ib194)

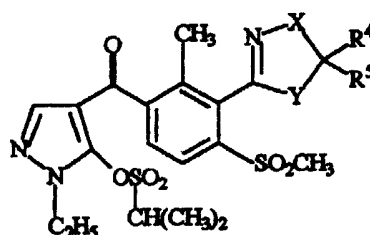
- съединения Ib195.1-Ib195.126, които се различават от съответните съединения Ib1.1-Ib1.126 по това, че R² означава нитро, R¹⁶ означава етил, Z означава изопропилсулфонил и R¹⁸ означава водород.



(Ib195)

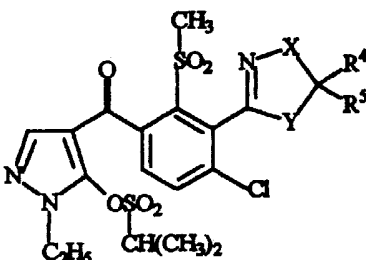
- съединения Ib196.1-Ib196.126, които се различават от съответните съединения Ib1.1-Ib1.126 по това, че R¹ означава метил, R² оз-

начава метилсулфонил, Z означава изопропилсулфонил, R¹⁶ означава етил и R¹⁸ означава водород.



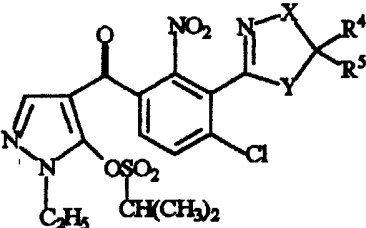
(Ib196)

- съединения Ib197.1-Ib197.126, които се различават от съответните съединения Ib1.1-Ib1.126 по това, че R¹ означава метилсулфонил, R¹⁶ означава етил, Z означава изопропилсулфонил, и R¹⁸ означава водород.



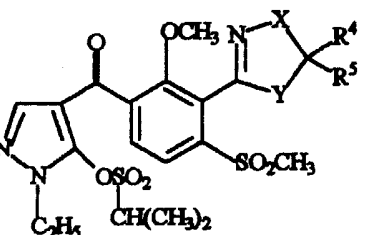
(Ib197)

- съединения Ib198.1-Ib198.126, които се различават от съответните съединения Ib1.1-Ib1.126 по това, че R¹ означава нитро, R¹⁶ означава етил, Z означава изопропилсулфонил, и R¹⁸ означава водород.



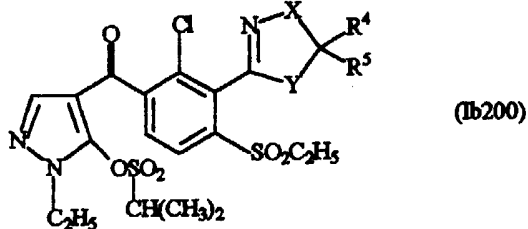
(Ib198)

- съединения Ib199.1-Ib199.126, които се различават от съответните съединения Ib1.1-Ib1.126 по това, че R¹ означава метокси, R² означава метилсулфонил, R¹⁶ означава етил, Z означава изопропилсулфонил и R¹⁸ означава водород.

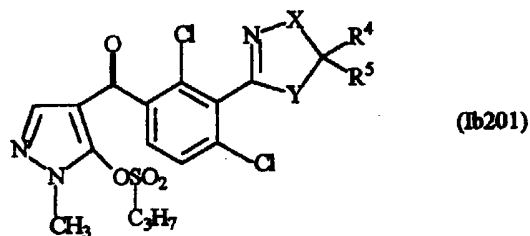


(Ib199)

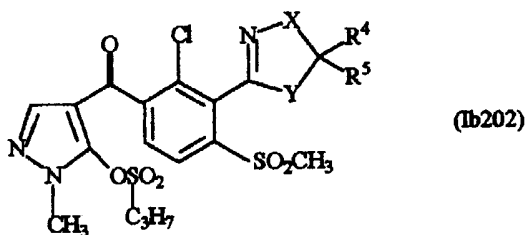
- съединения Ib200.1-Ib200.126, които се различават от съответните съединения Ib1.1-Ib1.126 по това, че R² означава етилсулфонил, R¹⁶ означава етил, Z означава изопропилсулфонил и R¹⁸ означава водород.



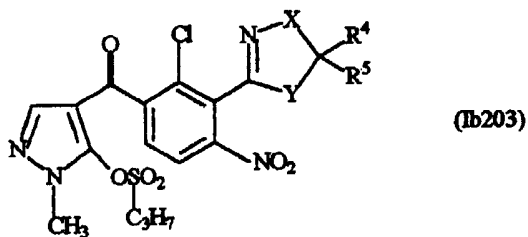
- съединения Ib201.1-Ib201.126, които се различават от съответните съединения Ib1.1-Ib1.126 по това, че Z означава норм-пропилсулфонил и R¹⁸ означава водород.



- съединения Ib202.1-Ib202.126, които се различават от съответните съединения Ib1.1-Ib1.126 по това, че R² означава метилсулфонил, Z означава норм-пропилсулфонил и R¹⁸ означава водород.

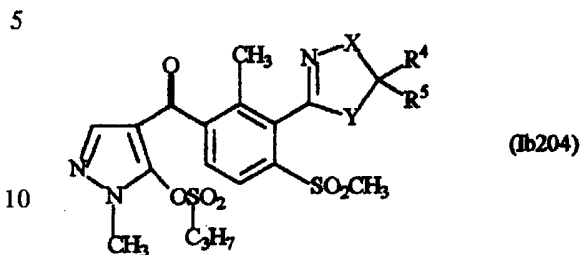


- съединения Ib203.1-Ib203.126, които се различават от съответните съединения Ib1.1-Ib1.126 по това, че R² означава нитро, Z означава норм-пропилсулфонил и R¹⁸ означава водород.

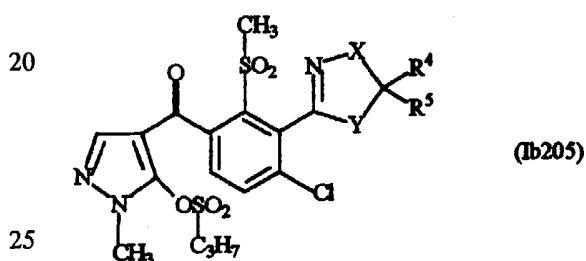


- съединения Ib204.1-Ib204.126, които се

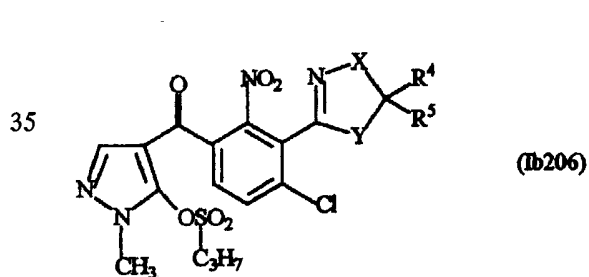
различават от съответните съединения Ib1.1-Ib1.126 по това, че R¹ означава метил, R² означава метилсулфонил, Z означава норм-пропилсулфонил, и R¹⁸ означава водород.



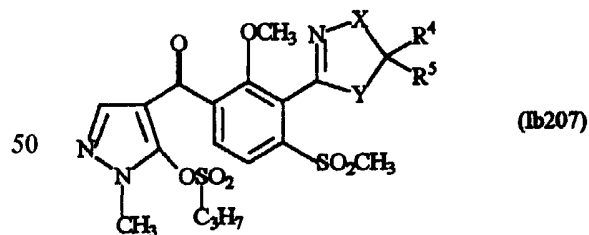
- съединения Ib205.1-Ib205.126, които се различават от съответните съединения Ib1.1-Ib1.126 по това, че R¹ означава метилсулфонил, Z означава норм-пропилсулфонил и R¹⁸ означава водород.



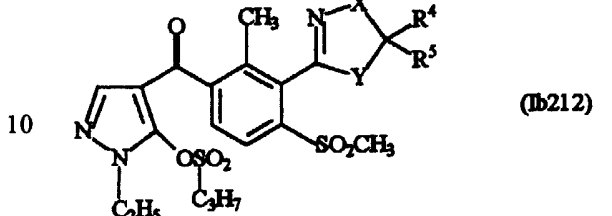
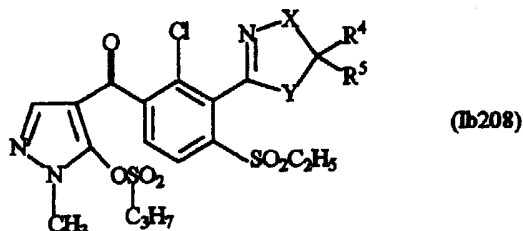
- съединения Ib206.1-Ib206.126, които се различават от съответните съединения Ib1.1-Ib1.126 по това, че R¹ означава нитро, Z означава норм-пропилсулфонил и R¹⁸ означава водород.



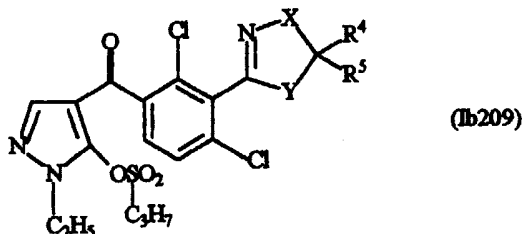
- съединения Ib207.1-Ib207.126, които се различават от съответните съединения Ib1.1-Ib1.126 по това, че R¹ означава метокси, R² означава метилсулфонил, Z означава норм-пропилсулфонил и R¹⁸ означава водород.



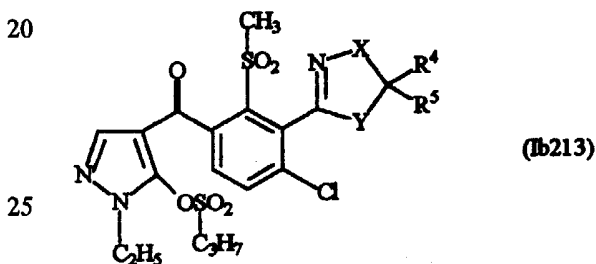
- съединения Ib208.1-Ib208.126, които се различават от съответните съединения Ib1.1-Ib1.126 по това, че R² означава етилсулфонил, Z означава норм-пропилсулфонил и R¹⁸ означава водород.



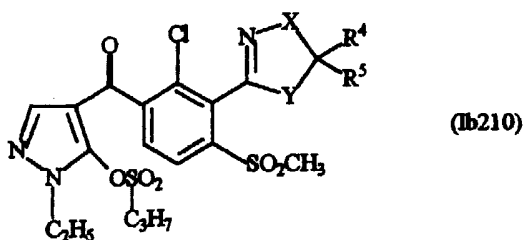
- съединения Ib209.1-Ib209.126, които се различават от съответните съединения Ib1.1-Ib1.126 по това, че R¹⁶ означава етил, Z означава норм-пропилсулфонил и R¹⁸ означава водород.



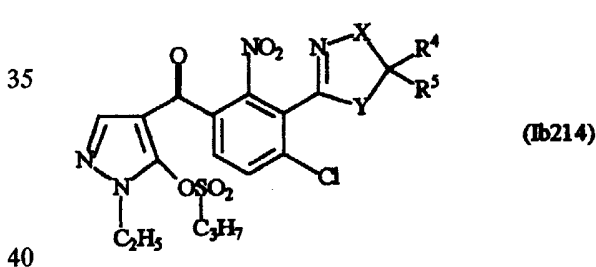
15 - съединения Ib213.1-Ib213.126, които се различават от съответните съединения Ib1.1-Ib1.126 по това, че R¹ означава метилсулфонил, R¹⁶ означава етил, Z означава норм-пропилсулфонил и R¹⁸ означава водород.



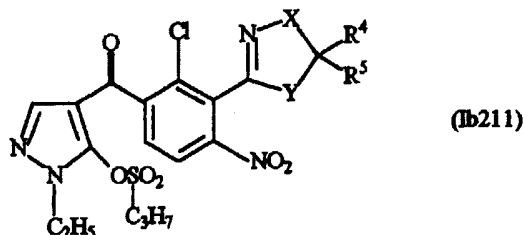
- съединения Ib210.1-Ib210.126, които се различават от съответните съединения Ib1.1-Ib1.126 по това, че R² означава метилсулфонил, R¹⁶ означава етил, Z означава норм-пропилсулфонил и R¹⁸ означава водород.



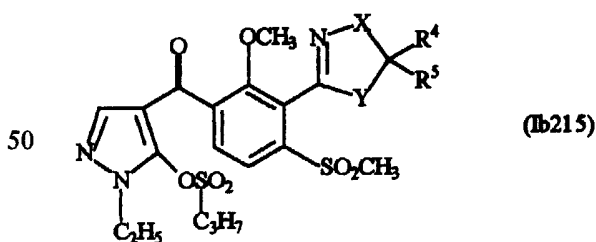
30 - съединения Ib211.1-Ib211.126, които се различават от съответните съединения Ib1.1-Ib1.126 по това, че R² означава нитро, R¹⁶ означава етил, Z означава норм-пропилсулфонил и R¹⁸ означава водород.



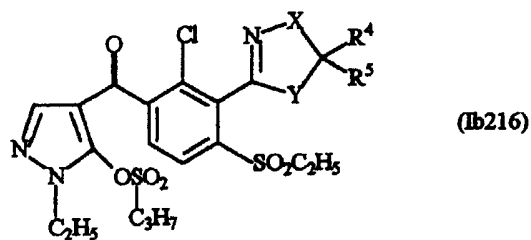
- съединения Ib211.1-Ib211.126, които се различават от съответните съединения Ib1.1-Ib1.126 по това, че R² означава нитро, R¹⁶ означава етил, Z означава норм-пропилсулфонил и R¹⁸ означава водород.



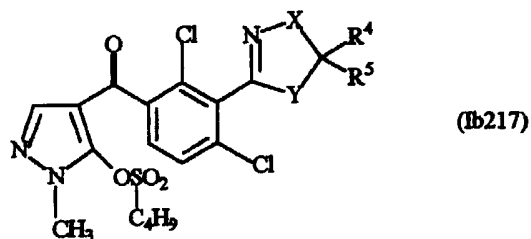
45 - съединения Ib215.1-Ib215.126, които се различават от съответните съединения Ib1.1-Ib1.126 по това, че R означава метокси, R² означава метилсулфонил, Z означава норм-пропилсулфонил и R¹⁸ означава водород.



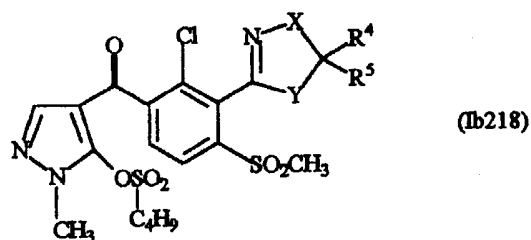
- съединения Ib216.1-Ib216.126, които се различават от съответните съединения Ib1.1-Ib1.126 по това, че R² означава етилсулфонил, R¹⁶ означава етил, Z означава норм-пропилсулфонил и R¹⁸ означава водород.



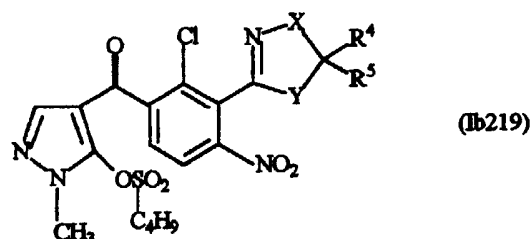
- съединения Ib217.1-Ib217.126, които се различават от съответните съединения Ib1.1-Ib1.126 по това, че Z означава норм-бутилсулфонил и R¹⁸ означава водород.



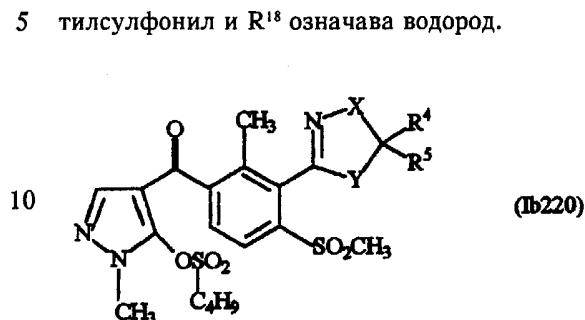
- съединения Ib218.1-Ib218.126, които се различават от съответните съединения Ib1.1-Ib1.126 по това, че R² означава метилсулфонил, Z означава норм-бутилсулфонил и R¹⁸ означава водород.



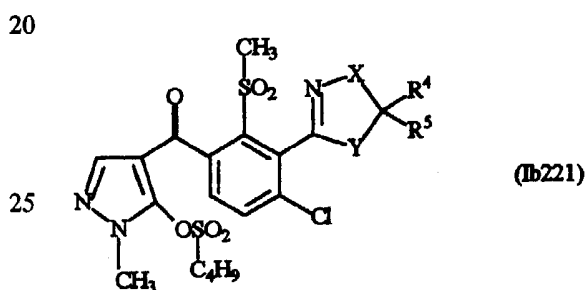
- съединения Ib219.1-Ib219.126, които се различават от съответните съединения Ib1.1-Ib1.126 по това, че R² означава нитро, Z означава норм-бутилсулфонил и R¹⁸ означава водород.



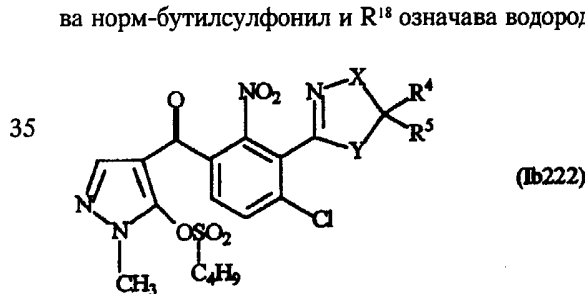
- съединения Ib220.1-Ib220.126, които се различават от съответните съединения Ib1.1-Ib1.126 по това, че R¹ означава метил, R² означава метилсулфонил, Z означава норм-бутилсулфонил и R¹⁸ означава водород.



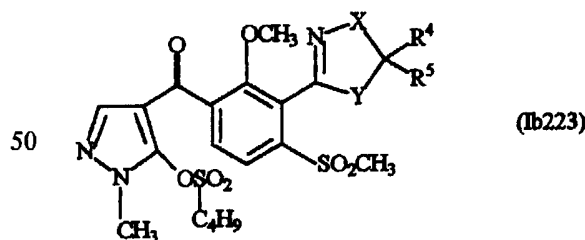
- съединения Ib221.1-Ib221.126, които се различават от съответните съединения Ib1.1-Ib1.126 по това, че R¹ означава метилсулфонил, Z означава норм-бутилсулфонил и R¹⁸ означава водород.



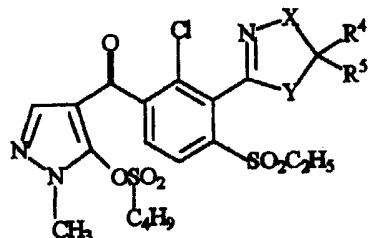
- съединения Ib222.1-Ib222.126, които се различават от съответните съединения Ib1.1-Ib1.126 по това, че R¹ означава нитро, Z означава норм-бутилсулфонил и R¹⁸ означава водород.



- съединения Ib223.1-Ib223.126, които се различават от съответните съединения Ib1.1-Ib1.126 по това, че R¹ означава метокси, R² означава метилсулфонил, Z означава норм-бутилсулфонил и R¹⁸ означава водород.

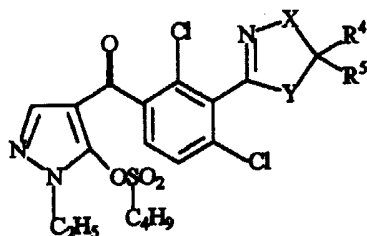


- съединения Ib224.1-Ib224.126, които се различават от съответните съединения Ib1.1-Ib1.126 по това, че R² означава етилсулфонил, Z означава норм-бутилсулфонил и R¹⁸ означава водород.



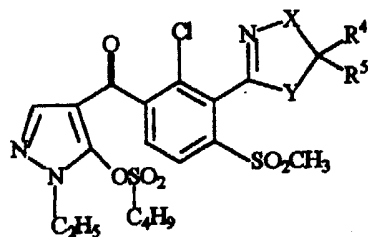
(Ib224)

- съединения Ib225.1-Ib225.126, които се различават от съответните съединения Ib1.1-Ib1.126 по това, че R¹⁶ означава етил, Z означава норм-бутилсулфонил и R¹⁸ означава водород.



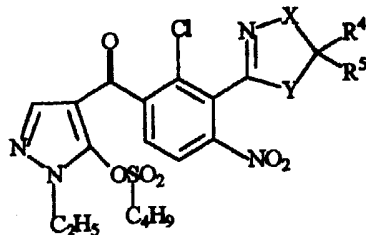
(Ib225)

- съединения Ib226.1-Ib226.126, които се различават от съответните съединения Ib1.1-Ib1.126 по това, че R² означава метилсулфонил, R¹⁶ означава етил, Z означава норм-бутилсулфонил и R¹⁸ означава водород.



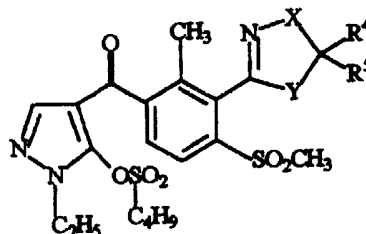
(Ib226)

- съединения Ib227.1-Ib227.126, които се различават от съответните съединения Ib1.1-Ib1.126 по това, че R² означава нитро, R¹⁶ означава етил, Z означава норм-бутилсулфонил и R¹⁸ означава водород.



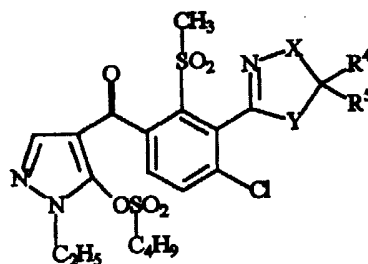
(Ib227)

- съединения Ib228.1-Ib228.126, които се различават от съответните съединения Ib1.1-Ib1.126 по това, че R¹ означава метил, R² означава метилсулфонил, R¹⁶ означава етил, Z означава норм-бутилсулфонил и R¹⁸ означава водород.



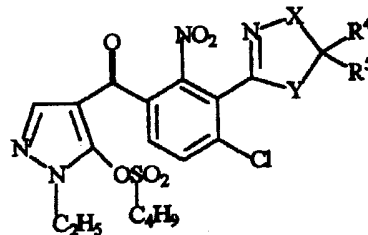
(Ib228)

- съединения Ib229.1-Ib229.126, които се различават от съответните съединения Ib1.1-Ib1.126 по това, че R¹ означава метилсулфонил, R¹⁶ означава етил, Z означава норм-бутилсулфонил и R¹⁸ означава водород.



(Ib229)

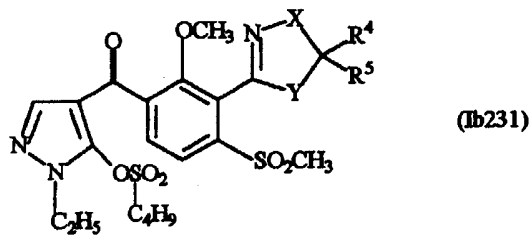
- съединения Ib230.1-Ib230.126, които се различават от съответните съединения Ib1.1-Ib1.126 по това, че R¹ означава нитро, R¹⁶ означава етил, Z означава норм-бутилсулфонил и R¹⁸ означава водород.



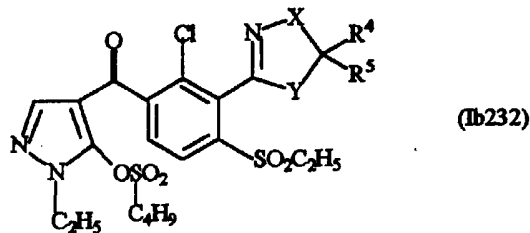
(Ib230)

- съединения Ib231.1-Ib231.126, които се различават от съответните съединения Ib1.1-Ib1.126 по това, че R¹ означава метокси, R¹⁶ означава етил, Z означава норм-бутилсулфонил и R¹⁸ означава водород.

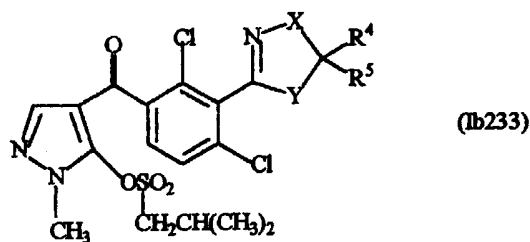
50



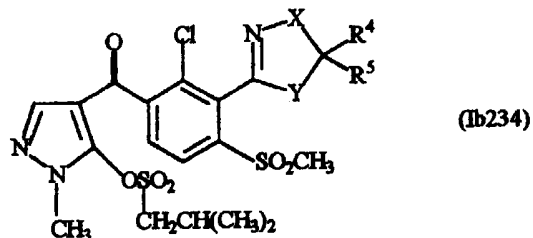
- съединения Ib232.1-Ib232.126, които се различават от съответните съединения Ib1.1-Ib1.126 по това, че R² означава етилсулфонил, R¹⁶ означава етил, Z означава норм-бутилсулфонил и R¹⁸ означава водород.



- съединения Ib233.1-Ib233.126, които се различават от съответните съединения Ib1.1-Ib1.126 по това, че Z означава изобутилсулфонил и R¹⁸ означава водород.

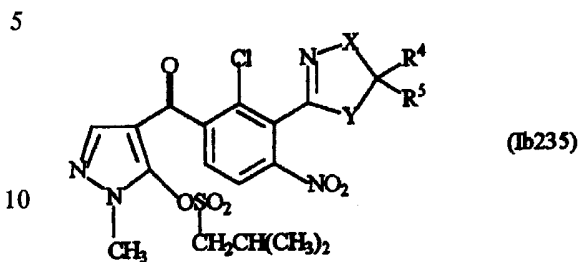


- съединения Ib234.1-Ib234.126, които се различават от съответните съединения Ib1.1-Ib1.126 по това, че R² означава метилсулфонил, Z означава изобутилсулфонил и R¹⁸ означава водород.

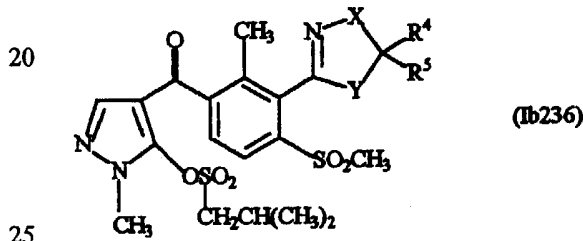


- съединения Ib235.1-Ib235.126, които се различават от съответните съединения Ib1.1-

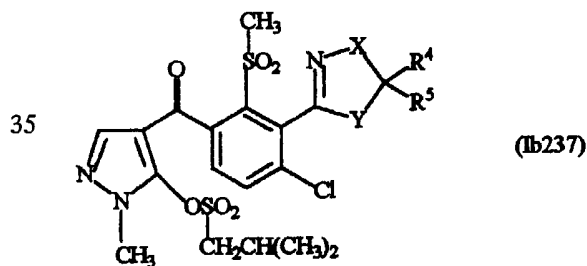
Ib1.126 по това, че R² означава нитро, Z означава изобутилсулфонил и R¹⁸ означава водород.



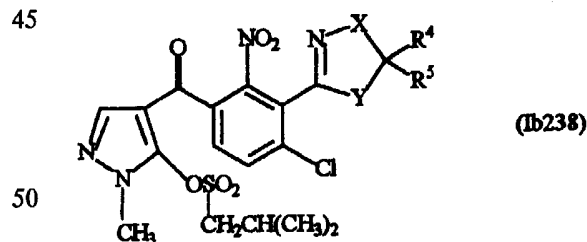
- съединения Ib236.1-Ib236.126, които се различават от съответните съединения Ib1.1-Ib1.126 по това, че R¹ означава метил, R² метилсулфонил, Z означава изобутилсулфонил и R¹⁸ означава водород.



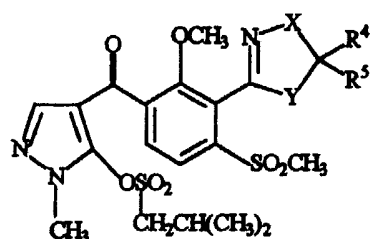
- съединения Ib237.1-Ib237.126, които се различават от съответните съединения Ib1.1-Ib1.126 по това, че R¹ означава метилсулфонил, Z означава изобутилсулфонил и R¹⁸ означава водород.



- съединения Ib238.1-Ib238.126, които се различават от съответните съединения Ib1.1-Ib1.126 по това, че R¹ означава нитро, Z означава изобутилсулфонил и R¹⁸ означава водород.

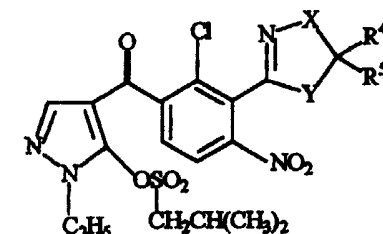


- съединения Ib239.1-Ib239.126, които се различават от съответните съединения Ib1.1-Ib1.126 по това, че R¹ означава метокси, R² означава метилсулфонил, Z означава изобутилсулфонил и R¹⁸ означава водород.



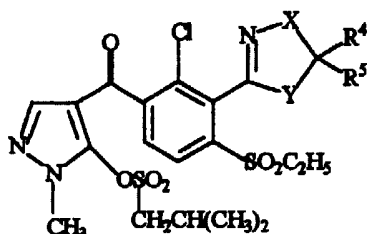
(Ib239)

10



(Ib243)

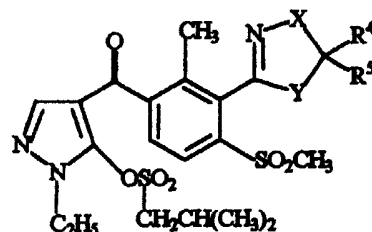
- съединения Ib240.1-Ib240.126, които се различават от съответните съединения Ib1.1-Ib1.126 по това, че R² означава етилсулфонил, Z означава изобутилсулфонил и R¹⁸ означава водород.



(Ib240)

15

- съединения Ib244.1-Ib244.126, които се различават от съответните съединения Ib1.1-Ib1.126 по това, че R¹ означава метил, R² означава метилсулфонил, R¹⁶ означава етил, Z означава изобутилсулфонил и R¹⁸ означава водород.

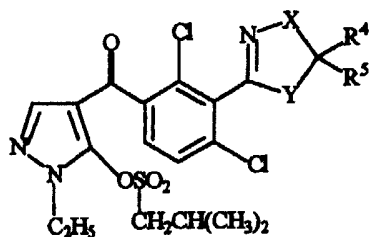


(Ib244)

20

25

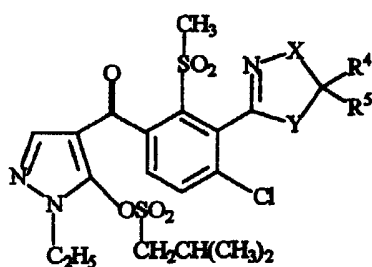
- съединения Ib241.1-Ib241.126, които се различават от съответните съединения Ib1.1-Ib1.126 по това, че R¹⁶ означава етил, Z означава изобутилсулфонил и R¹⁸ означава водород.



(Ib241)

30

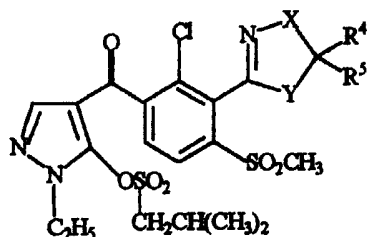
- съединения Ib245.1-Ib245.126, които се различават от съответните съединения Ib1.1-Ib1.126 по това, че R¹ означава метилсулфонил, R¹⁶ означава етил, Z означава изобутилсулфонил и R¹⁸ означава водород.



(Ib245)

35

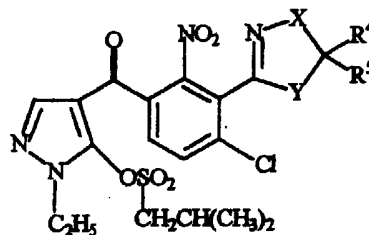
- съединения Ib242.1-Ib242.126, които се различават от съответните съединения Ib1.1-Ib1.126 по това, че R² означава метилсулфонил, R¹⁶ означава етил, Z означава изобутилсулфонил и R¹⁸ означава водород.



(Ib242)

40

- съединения Ib246.1-Ib246.126, които се различават от съответните съединения Ib1.1-Ib1.126 по това, че R¹ означава нитро, R¹⁶ означава етил, Z означава изобутилсулфонил и R¹⁸ означава водород.



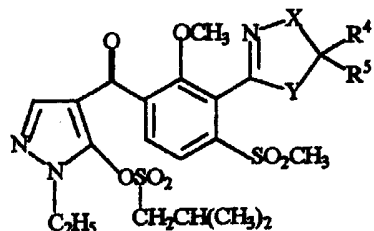
(Ib246)

45

50

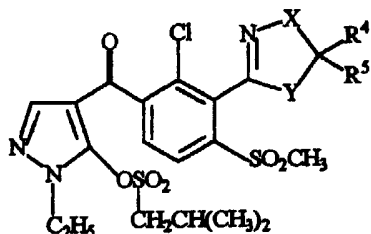
55

- съединения Ib247.1-Ib247.126, които се различават от съответните съединения Ib1.1-Ib1.126 по това, че R¹ означава метокси, R² означава метилсулфонил, R¹⁶ означава етил, Z означава изобутилсулфонил и R¹⁸ означава водород.



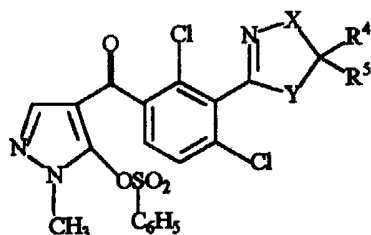
(Ib247)

- съединения Ib248.1-Ib248.126, които се различават от съответните съединения Ib1.1-Ib1.126 по това, че R² означава метилсулфонил, R¹⁶ означава етил, Z означава изобутилсулфонил и R¹⁸ означава водород.



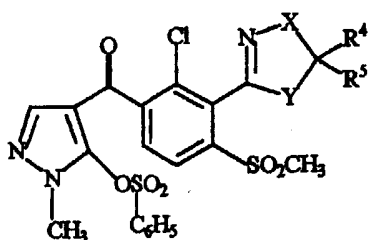
(Ib248)

- съединения Ib249.1-Ib249.126, които се различават от съответните съединения Ib1.1-Ib1.126 по това, че Z означава фенилсулфонил и R¹⁸ означава водород.



(Ib249)

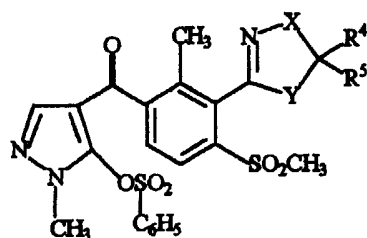
- съединения Ib250.1-Ib250.126, които се различават от съответните съединения Ib1.1-Ib1.126 по това, че R² означава метилсулфонил, Z означава фенилсулфонил и R¹⁸ означава водород.



(Ib250)

- съединения Ib251.1-Ib251.126, които се различават от съответните съединения Ib1.1-Ib1.126 по това, че R¹ означава метил, R² означава метилсулфонил, Z означава фенилсулфонил и R¹⁸ означава водород.

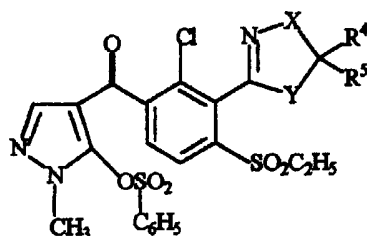
5



(Ib251)

- съединения Ib252.1-Ib252.126, които се различават от съответните съединения Ib1.1-Ib1.126 по това, че R² означава етилсулфонил, Z означава фенилсулфонил и R¹⁸ означава водород.

10

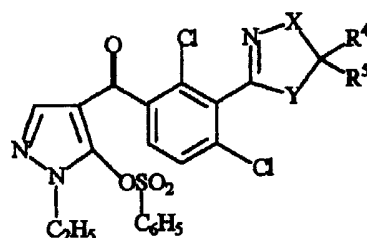


(Ib252)

15

- съединения Ib253.1-Ib253.126, които се различават от съответните съединения Ib1.1-Ib1.126 по това, че R¹⁶ означава етил, Z означава фенилсулфонил и R¹⁸ означава водород.

20

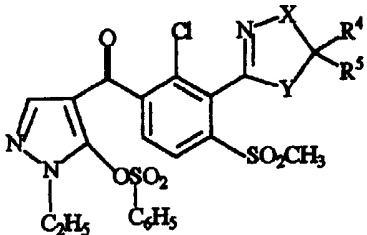


(Ib253)

25

- съединения Ib254.1-Ib254.126, които се различават от съответните съединения Ib1.1-Ib1.126 по това, че R² означава метилсулфонил, R¹⁶ означава етил, Z означава фенилсулфонил и R¹⁸ означава водород.

30



(Ib254)

35

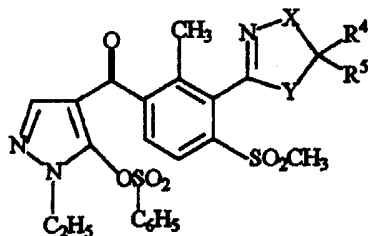
40

45

50

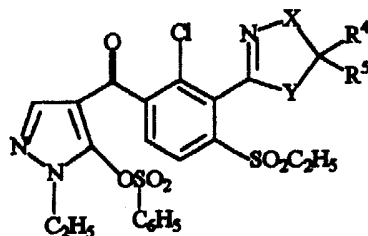
56

- съединения Ib255.1-Ib255.126, които се различават от съответните съединения Ib1.1-Ib1.126 по това, че R¹ означава метил, R² означава метилсулфонил, R¹⁶ означава етил, Z означава фенилсулфонил и R¹⁸ означава водород.



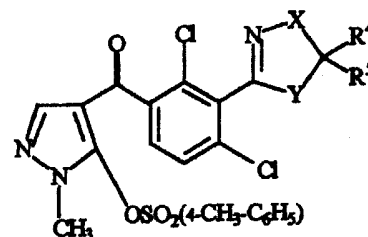
(Ib255)

- съединения Ib256.1-Ib256.126, които се различават от съответните съединения Ib1.1-Ib1.126 по това, че R² означава етилсулфонил, R¹⁶ означава етил, Z означава фенилсулфонил и R¹⁸ означава водород.



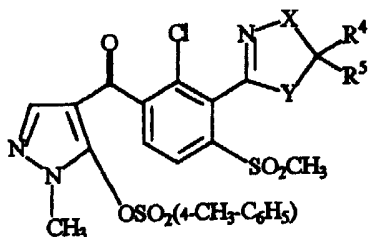
(Ib256)

- съединения Ib257.1-Ib257.126, които се различават от съответните съединения Ib1.1-Ib1.126 по това, че Z означава p-толуенсулфонил и R¹⁸ означава водород.



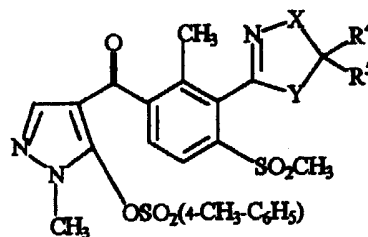
(Ib257)

- съединения Ib258.1-Ib258.126, които се различават от съответните съединения Ib1.1-Ib1.126 по това, че R² означава метилсулфонил, Z означава p-толуенсулфонил и R¹⁸ означава водород.



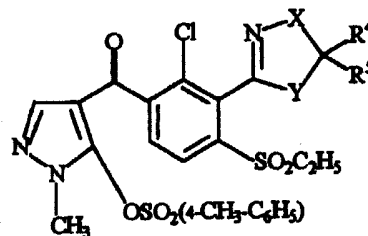
(Ib258)

- съединения Ib259.1-Ib259.126, които се различават от съответните съединения Ib1.1-Ib1.126 по това, че R¹ означава метил, R² означава метилсулфонил, Z означава p-толуенсулфонил и R¹⁸ означава водород.



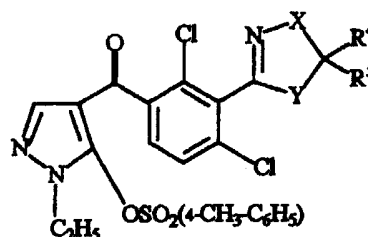
(Ib259)

- съединения Ib260.1-Ib260.126, които се различават от съответните съединения Ib1.1-Ib1.126 по това, че R² означава етилсулфонил, Z означава p-толуенсулфонил и R¹⁸ означава водород.



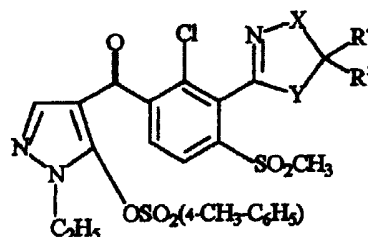
(Ib260)

- съединения Ib261.1-Ib261.126, които се различават от съответните съединения Ib1.1-Ib1.126 по това, че R¹⁶ означава етил, Z означава p-толуенсулфонил и R¹⁸ означава водород.



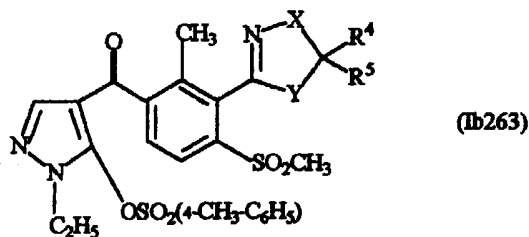
(Ib261)

- съединения Ib262.1-Ib262.126, които се различават от съответните съединения Ib1.1-Ib1.126 по това, че R² означава метилсулфонил, R¹⁶ означава етил, Z означава p-толуенсулфонил и R¹⁸ означава водород.

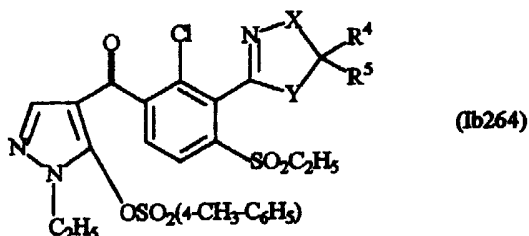


(Ib262)

- съединения Ib263.1-Ib263.126, които се различават от съответните съединения Ib1.1-Ib1.126 по това, че R¹ означава метил, R² означава метилсулфонил, R¹⁶ означава етил, Z означава p-толуенсулфонил и R¹⁸ означава водород.



- съединения Ib264.1-Ib264.126, които се различават от съответните съединения Ib1.1-Ib1.126 по това, че R² означава етилсулфонил, R¹⁶ означава етил, Z означава p-толуенсулфонил и R¹⁸ означава водород.



Също така особено предпочитани са 3-хетероциклил-заместени бензоилови производни с формула (I), в която заместителите имат следните значения:

R¹ означава халоген, C₁-C₆ алкил, C₁-C₆ алкилтио или C₁-C₆ алкилсулфонил;

особено хлоро, метил, метилтио или метилсулфонил;

R² означава водород, нитро, халоген, C₁-C₆ алкилтио, C₁-C₆ алкилсулфинил или C₁-C₆ алкилсулфонил;

по-специално водород, нитро, хлоро, метилтио, метилсулфинил, метилсулфонил, етилсулфонил или пропилсулфонил;

R³ означава водород;

R⁴, R⁵ означават водород, халоген, C₁-C₄ алкил, C₁-C₄ халогеналкил, C₁-C₄ алкокси, C₁-C₄ алкилтио или COR⁶;

по-специално водород, флуоро, метил, етил, пропил, трифлуорометил, хлорометил, 1-хлоро-ет-1-ил, метокси, етокси, етилтио или еток-

сикарбонил;

или

R⁴ и R⁵ заедно образуват C₂-C₆ алкандилова верига, която може да бъде моно- до многократно заместена с C₁-C₄ алкил и/или да бъде прекъсната с кислород или азот, в даден случай заместен с C₁-C₄ алкил;

R⁶ означава C₁-C₄ алкокси; особено етил;

X означава O или CR¹⁰R¹¹;

Y означава O, S или CR¹³R¹⁴;

R¹⁰, R¹¹, R¹³, R¹⁴ означават водород, C₁-C₄ алкил или C₁-C₄ халогеналкил; особено водород, метил или хлорометил;

или

R⁵ и R¹³ заедно образуват C₂-C₆ алкандилова верига, която може да бъде моно- до многократно заместена с C₁-C₄ алкил и/или да бъде прекъсната с кислород или азот, в даден случай заместен с C₁-C₄ алкил; особено 1,3-пропдиил;

R¹⁶ означава C₁-C₆ алкил; особено метил, етил, пропил, 2-метилпропил или бутил;

Z означава H или SO₂R¹⁷

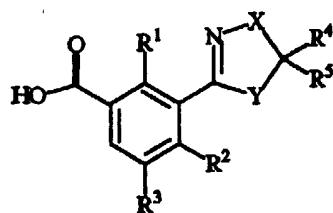
R¹⁷ означава C₁-C₄ алкил; особено метил, етил, пропил или 2-метилпропил;

с изключение на 4-[2-хлоро-3-(4,5-дихидроизоксазол-3-ил)-4-метилсулфонилбензоил]-1-етил-5-хидрокси-1H-пиразол, 4-[2-хлоро-3-(4,5-дихидроизоксазол-3-ил)-4-метилсулфонилбензоил]-1,3-диметил-5-хидрокси-1H-пиразол, 4-[2-хлоро-3-(5-циано-4,5-дихидроизоксазол-3-ил)-4-метилсулфонилбензоил]-1,3-диметил-5-хидрокси-1H-пиразол и 4-[2-хлоро-3-(4,5-дихидроизоксазол-2-ил)-4-метилсулфонилбензоил]-1,3-диметил-5-хидрокси-1H-пиразол; както и техните приемливи в земеделието соли; по-специално соли с алкални метали и амониеви соли.

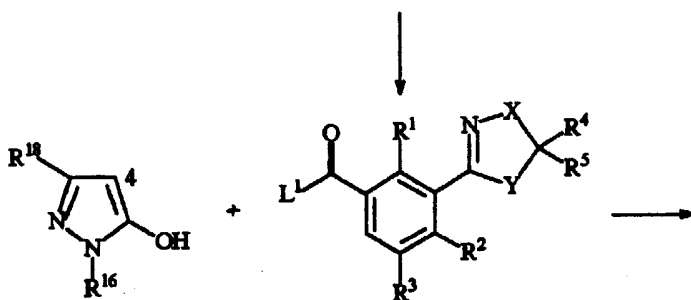
3-хетероциклилзаместените бензоилови производни с формула (I) се получават по различни методи, например съгласно следващия метод:

Метод А

Взаимодействие на пиразоли с формула (II) (като Z=H) с активирана бензоена киселина (IIIα) или бензоена киселина (IIIβ), която за предпочитане се активира *in situ*, до продукта на ацилиране и последващо прегрупиране.

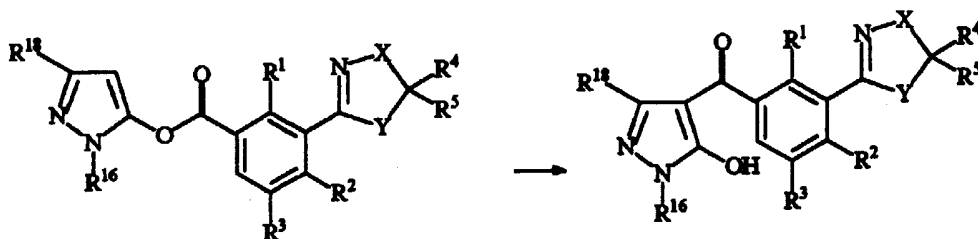


(IIIβ)



(II) (където Z=H)

(IIIα)



(IV)

(I) (където Z=H)

L¹ означава нуклеофилно измествана напускаща група, като халоген, напр. бром, хлор, хетарил напр. имидазол, пиридил, карбоксилат напр. ацетат, трифлуороацетат и т.н.

Активирани бензоени киселини могат да се прибавят директно, както в случая с бензоилхалогениди, или да се получат *in situ* напр. с дициклохексилкарбодимид, трифенилфосфин/естер на азодикарбоксилна киселина, 2-пиридиндисулфид/трифенилфосфин, карбонилдиимидазол и пр.

В даден случай може да бъде предимство реакцията на ацилиране да се проведе в присъствието на основа. В такъв случай целесъобразно е реагиращите вещества и помощната основа да се прибавят в еквимоларни количества. Минимален излишък от помощната основа напр. 1,2 до 1,5 молекулвалента спрямо (II) може да бъде благоприятно.

Като помощни основи са подходящи третични алкамини, пиридин или алкалномета-

ли и карбонати. Като разтворители могат да се използват напр. хлорирани въглеводороди, като метиленхлорид, 1,2-дихлороетан, ароматни въглеводороди като толуен, ксилен, хлоробензен, етери, като диетилов етер, метил-третбутилетер, тетраhydroфуран, диоксан, полярни апротни разтворители като ацетонитрил, диметилформаид, диметилсулфоксид или естери като етилацетат или смеси от тях.

Ако се използват като активирани компоненти на карбоксилна киселина бензоилхалогениди, то може да бъде целесъобразно, при прибавянето на този участник в реакцията реакционната смес да се охлажда до 0-10°C. След това се разбърква при 20-100°C, за предпочитане при 25-50°C, докато се извърши пълно взаимодействие. По-нататъшната преработка се осъществява по обичаен начин, напр. реакционната смес се излива във вода, желаният продукт се екстрахира. Като разтворители са подходящи за целта особено метиленхлорид, диетилов етер и етилацетат. След сушене на

органичната фаза и отстраняване на разтворителя, суровият естер може да се използва за прегрупиране без по-нататъшно пречистване.

Прегрупирането на естера в съединенията с формула (I) се осъществява целесъобразно при температури от 20 до 40°C в разтворител и в присъствието на основа, както и в даден случай с помощта на цианово съединение като катализатор.

Като разтворители могат да се използват напр. ацетонитрил, метиленхлорид, 1,2-дихлороетан, диоксан, етилацетат, толуен или смеси от тях. За предпочитане разтворителите са ацетонитрил и диоксан.

Подходящи основи са третичните амини като триетиламин, пиридин или алкалнометални карбонати като натриев карбонат, калиев карбонат, които се прибавят за предпочитане в еквимоларни количества или до четирикратен излишък спрямо естера. За предпочитане се използват триетиламин или алкалнометални карбонати, за предпочитане в двойно еквимоларни съотношения спрямо естера.

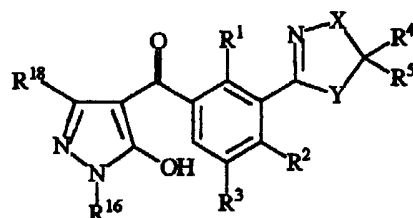
Като цианосъединения се имат предвид неорганични цианиди като натриев цианид, калиев цианид и органични цианосъединения ка-

то ацетонцианохидрин, триметилсилилцианид. Те се прибавят в количество от 1 до 50% мол. спрямо естера. За предпочитане се използват ацетонцианохидрин или триметилсилилцианид напр. в количество от 5 до 15, за предпочитане 10% мол. спрямо естера.

Дообработката може да се извърши по известен начин. Реакционната смес напр. се подкислява с разредена минерална киселина като 5%-на солна киселина или сярна киселина, екстрахира се с органичен разтворител напр. метиленхлорид, етилацетат. Органичният екстракт може да се екстрахира с 5-10%-ен разтвор на алкален карбонат напр. разтвор на натриев или калиев карбонат. Водната фаза се подкислява и образувалата се утайка се филтрира на Нуч филтър и/или се екстрахира с метиленхлорид или етилацетат, суши се и се концентрира. (Примери за получаването на естери на хидроксипиразоли и за прегрупирането на естерите са дадени напр. в EP-A 282 944 и US 4 643 757).

Метод В:

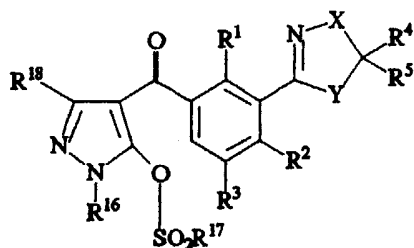
Взаимодействие на 3-хетероциклизаместени бензоилови производни с формула (I) (където Z = H) със съединение с формула (V) (където Z = SO₂R¹⁷):



(I) (където Z=H)



(V)



(I) (където Z=SO₂R¹⁷)

L² означава нуклеофилно измествана напускаща група, като халоген, напр. бром, хетарил напр. имидазол, пиридил, сулфонат напр. OSO₂R¹⁷.

Съединенията с формула (V) могат да се използват директно както напр. в случай на халогениди на сулфонови киселини, анхидриди на сулфонови киселини или да се получат *in situ* напр. активирани сулфонови киселини (посредством сулфонова киселина и дихлороксилкарбонилдиимид, карбонилдиимидазол и пр.).

Изходните съединения се прибавят по правило в еквимоларно съотношение. Може обаче да бъде изгодно едните или другите компоненти да се прибавят в излишък.

В даден случай може да бъде изгодно взаимодействието да се проведе в присъствието на основа. Взаимодействащите вещества и помощната основа при това е целесъобразно да се прибавят в еквимоларни количества. Излишък от помощната основа напр. 1,5 до 3 молеквивалента спрямо (II) може да бъде благоприятен.

Като помощни основи са подходящи тре-

тични алкиламини като триетиламин, пиридин, алкалометални карбонати напр. натриев карбонат, калиев карбонат и алкалометални хидриди напр. натриев хидрид. За предпочитане се прибавят триетиламин и пиридин.

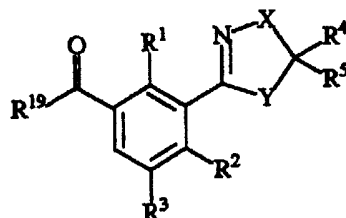
Като разтворители се имат предвид напр. хлорирани въглеводороди като метиленхлорид, 1,2-дихлороетан, ароматни въглеводороди напр. толуен, ксилен, хлоробензен, етери като диетилов етер, метил-трет-бутил етер, тетраhydroфуран, диоксан, полярни апротни разтворители като ацетонитрил, диметилформамид, диметилсулфоксид или естери като етилацетат или техни смеси.

По правило, температурата на реакцията е в обхвата от 0°C до температурата на кипене на реакционната смес.

Дообработката до продукта може да се осъществи по известен начин.

Използваните като изходни вещества пиразоли с формула (II) (където Z = H) са известни или могат да се получат по известни методи (напр. EP-A 240 001 и J. Prakt. Chem. 315, 383 (1973)).

3-хетероциклизаместените производни на бензоената киселина с формула (III) са нови



(III)

при което заместителите имат следните значения:

R¹, R² означават водород, нитро, халоген, циано, C₁-C₆ алкил, C₁-C₆ халогеналкил, C₁-C₆ алкокси, C₁-C₆ халогеналкокси, C₁-C₆ алкилтио, C₁-C₆ халогеналкилтио, C₁-C₆ алкилсулфинил, C₁-C₆ халогеналкилсулфинил, C₁-C₆ алкилсулфонил или C₁-C₆ халогеналкилсулфонил;

R³ означава водород, халоген или C₁-C₆ алкил;

R⁴, R⁵ означават водород, халоген, циано, нитро, C₁-C₄ алкил, C₁-C₆ алкокси-C₁-C₄ алкил, ди-(C₁-C₄-алкокси)-C₁-C₄ алкил, ди-(C₁-C₄-алкил)амино-C₁-C₄ алкил, [2,2-ди-(C₁-C₄-алкил)-хидразино-1]-C₁-C₄ алкил, C₁-C₆-алкилиминоокси-C₁-C₄ алкил, C₁-C₄-алкоксикарбонил-C₁-C₄ алкил, C₁-C₄ алкилтио-C₁-C₄ алкил, C₁-C₄ ха-

логеналкил, C₁-C₄ цианоалкил, C₃-C₆ циклоалкил, C₁-C₄ алкокси, C₁-C₄-алкокси-C₂-C₄ алкокси, C₁-C₄ халогеналкокси, хидрокси, C₁-C₄ алкилкарбонилокси, C₁-C₄ алкилтио, C₁-C₄ халогеналкилтио, ди-(C₁-C₄-алкил)амино, COR⁶, фенол или бензил, при което двата последно споменати заместители могат да бъдат частично или напълно халогенирани и/или могат да носят от една до три от следните групи: нитро, пиано, C₁-C₄ алкил, C₁-C₄ халогеналкил, C₁-C₄ алкокси или C₁-C₄ халогеналкокси;

или

R⁴ и R⁵ заедно образуват C₂-C₆ алкандилова верига, която може да бъде заместена еднократно до четирикратно с C₁-C₄ алкил и/

или може да бъде прекъсната с кислород или азот, в даден случай заместен с C_1-C_4 алкил;
или

R^4 и R^5 заедно с прилежащия им въглероден атом образуват карбонилна или тиокарбонилна група;

R^6 означава водород, C_1-C_4 алкил, C_1-C_4 халогеналкил, C_1-C_4 алкокси, C_1-C_4 -алкокси- C_2-C_4 алкокси, C_1-C_4 халогеналкокси, C_3-C_6 алкенилокси, C_3-C_6 алкинилокси или NR^7R^8 ;

R^7 означава водород или C_1-C_4 алкил;

R^8 означава C_1-C_4 алкил;

X означава O, S, NR^9 , CO или $CR^{10}R^{11}$;

Y означава O, S, NR^{12} , CO или $CR^{13}R^{14}$;

R^9 , R^{12} означават водород или C_1-C_4 алкил;

R^{10} , R^{11} , R^{13} , R^{14} означават водород, C_1-C_4 алкил, C_1-C_4 халогеналкил, C_1-C_4 алкоксикарбонил, C_1-C_4 халогеналкокси-карбонил или $CONR^7R^8$; или

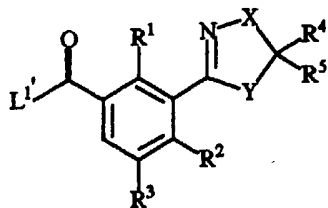
R^4 и R^9 , или R^4 и R^{10} , или R^5 и R^{12} , или R^5 и R^{13} заедно образуват C_2-C_6 алкандиолова верига, която може да бъде заместена еднократно до четирикратно с C_1-C_4 алкил и/или може да бъде прекъсната с кислород или азот, в даден случай заместен с C_1-C_4 алкил;

R^{19} означава хидрокси или остатък, който може да бъде хидролизиран;

с изключение на метилов 2-хлоро-3-(4,5-дихидроизоксазол-3-ил)-4-метилсулфонилбензоат, метилов 2-хлоро-3-(4,5-дихидрооксазол-2-ил)-4-метилсулфонилбензоат и метилов 2,4-дихлоро-3-(5-метилкарбонилокси-4,5-дихидроизоксазол-3-ил)бензоат.

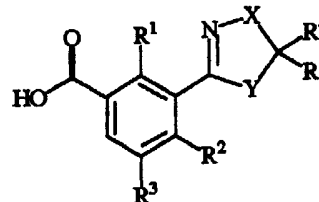
Примери за остатъци, които могат да се хидролизират, са остатъците алкокси, фенокси, алкилтио, фенилтио, които в даден случай могат да бъдат заместени, халогениди, хетарилови остатъци, които са свързани чрез азотен атом, аминоксиди, имино-остатъци, които в даден случай могат да бъдат заместени и т.н.

Предпочитани са 3-хетероциклизаместени халогениди на бензоени киселини с формула (III α'), с L^1 = халоген (= III с R^{19} = халоген)

(III α')

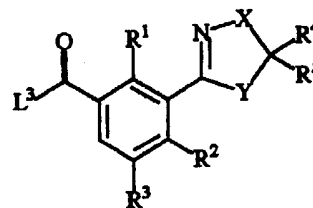
при което заместителите R^1 до R^5 , X и Y имат значенията, дадени при формула (III) и L^1 означава халоген, по-специално хлоро или бром.

Също предпочитани са 3-хетероциклизаместени бензоени киселини с формула (III β) (= III с R^{19} = хидрокси)

(III β)

в която заместителите R^1 до R^5 , X и Y имат значенията, дадени при формула (III).

Предпочитани са също естери на 3-хетероциклизаместени бензоени киселини с формула (III γ) (= III с R^{19} = C_1-C_6 алкокси),

(III γ)

където заместителите R^1 до R^5 , X и Y имат значенията, дадени при формула (III) и L^3 означава C_1-C_6 алкокси.

Особено предпочитаните форми на изпълнение на 3-хетероциклизаместени производни на бензоена киселина с формула (III) по отношение на заместителите R^1 до R^5 , X и Y отговарят на тези на 3-хетероциклизаместените безоилови производни с формула (I).

Предпочитани са също 3-хетероциклизаместени производни на бензоена киселина с формула (III), където заместителите имат следните значения:

R^1 означава халоген, C_1-C_6 алкил, C_1-C_6 алкилтио или C_1-C_6 алкилсулфонил; по-специално хлоро, метил, метилтио или метилсулфонил;

особено за предпочитане хлоро;

R^2 означава водород, нитро, халоген, C_1-C_6 алкилтио, C_1-C_6 алкилсулфинил или C_1-C_6 алкилсулфонил;

по-специално водород, нитро, хлоро, метилтио, метилсулфинил, метилсулфонил, етилсулфонил или пропилсулфонил;

особено за предпочитане водород, хлоро, метилтио, метилсулфонил, етилсулфонил или пропилсулфонил;

R^3 означава водород;

R^4 , R^5 означава водород, халоген, C_1-C_4 алкил, C_1-C_4 халогеналкил, C_1-C_4 алкокси, хидрокси, C_1-C_4 алкилкарбонилокси, C_1-C_4 алкилтио или COR^6 ;

по-специално водород, флуоро, метил, етил, пропил, трифлуорометил, хлорометил, 2-хлороет-1-ил, метокси, етокси, 2-метилпроп-1-окси, хидрокси, метилкарбонилокси, етилтио, формил, метилкарбонил, метоксикарбонил или етоксикарбонил;

особено за предпочитане водород, флуоро, метил, етил, трифлуорометил, хлорометил, 2-хлороет-1-ил, метокси, етокси, 2-метилпроп-1-окси, хидрокси, метилкарбонилокси, етилтио, формил, метилкарбонил, метоксикарбонил или етоксикарбонил;

или

R^4 и R^5 заедно образуват C_2-C_4 алкандилова верига, която може да бъде еднократно до многократно заместена с C_1-C_4 алкил и/или може да бъде прекъсната с кислород или азот, в даден случай заместен с C_1-C_4 алкил;

по-специално 1,4-бутдиил, 2-оксо-1,5-пентдиил;

или

R^4 и R^5 заедно с прилежащия им въглероден атом образуват карбонилна група;

R^6 означава водород, C_1-C_4 алкил или C_1-C_4 алкокси;

по-специално водород, метил, метокси

или етокси;

X означава O, S, CO, $CR^{10}R^{11}$;

Y означава O, S, $CR^{13}R^{14}$;

R^{10} , R^{11} , R^{13} , R^{14} означават водород, C_1-C_4 алкил, C_1-C_4 халогеналкил или C_1-C_4 алкоксикарбонил;

по-специално водород, метил, хлорометил или метоксикарбонил;

или

R^5 и R^{13} заедно образуват C_2-C_6 алкандилова верига, която може да бъде еднократно до многократно заместена с C_1-C_4 алкил и/или може да бъде прекъсната с кислород, или в даден случай азот заместен с C_1-C_4 -алкил;

по-специално 1,3-пропдиил;

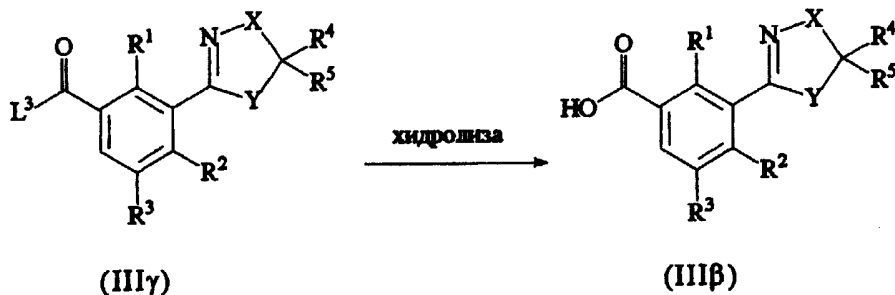
R^{19} означава хидрокси, халоген или C_1-C_6 алкокси;

по-специално хидрокси, хлоро, метокси или етокси;

с изключение на метилов 2-хлоро-3-(4,5-дихидроизоксазол-3-ил)-4-метилсулфонилбензоат, метилов 2-хлоро-3-(4,5-дихидрооксазол-2-ил)-4-метилсулфонилбензоат и метилов 2,4-дихлоро-3-(5-метилкарбонилокси-4,5-дихидроизоксазол-3-ил)бензоат.

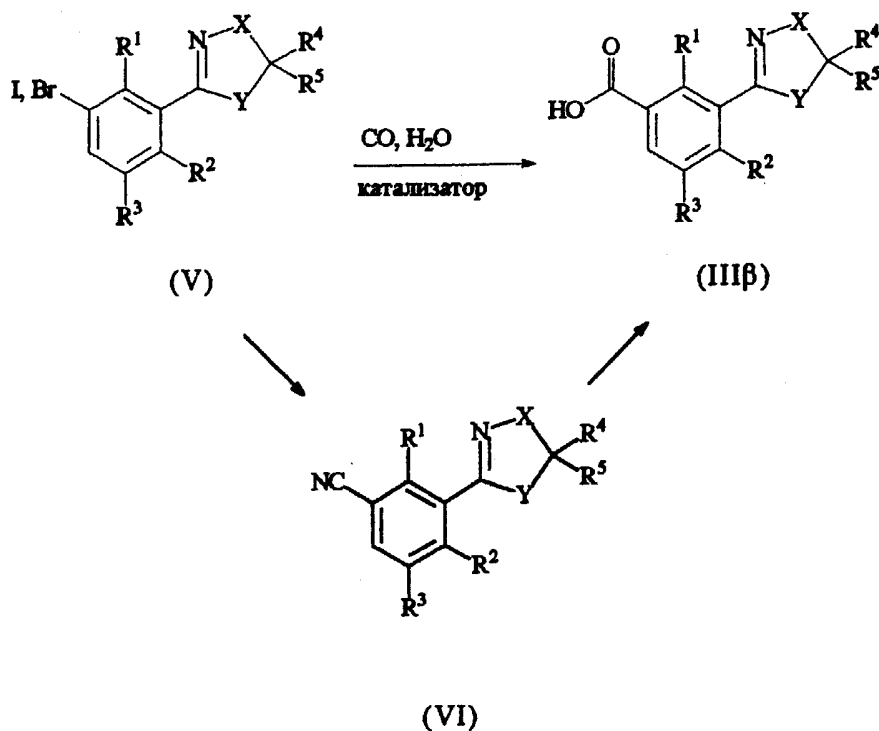
Бензоилхалогенидите с формула (III α') (където $L^{1'}$ = Cl, Br) могат да се получат по известен начин, чрез взаимодействие на бензоени киселини с формула (III β) с реактиви за халогениране като тионилхлорид, тионилбромид, фосген, дифосген, трифосген, оксалилхлорид, оксалилбромид.

Бензоена киселина с формула (III β) може да се получи по известен начин чрез киселинна или алкална хидролиза от съответните естери с формула (III γ) ($L^3C_1-C_6$ алкокси).



Бензоени киселини с формула (IIIβ) могат да се получат също чрез взаимодействие на съответните бром- или йодо-заместени съ-

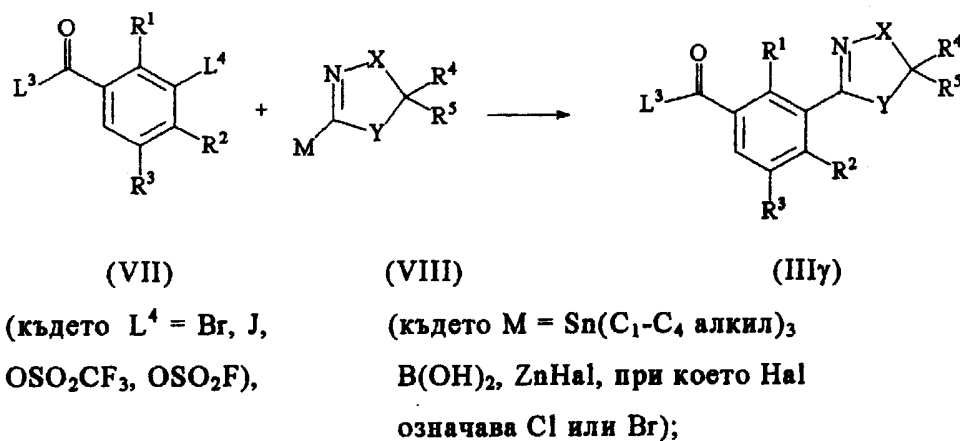
единения с формула (V), в присъствието на катализатори преходни метали паладий, никел, кобалт или родий и основа с въглероден монооксид и вода при повишено налягане.



Освен това е възможно, чрез реакция на Rosemund von Braun, съединения с формула (V) да се превърнат в съответните нитрили с формула (VI) (сравни напр. Org.Synth.Bd III, 212 (1955) и последните да се превърнат чрез последващо осапунване, в съединенията с формула (III).

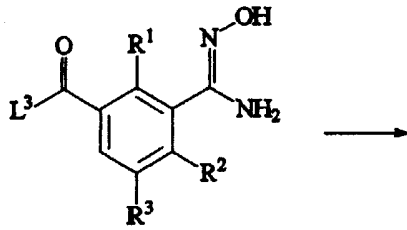
Естерите с формула (III α) могат да се получат чрез взаимодействие на арилхалогенни съединения с формула (VII), където L⁴ означава напускаща група като бром, йодо, триф-

лат, флуорсулфонилокси и т.н. с хетероцик-
лилстанати (свързване по Stille), хетероцик-
лилборни съединения (свързване по Suzuki)
или хетероциклилцинкови съединения (реак-
ция на Negishi) (VIII) където М означава съ-
ответно Sn(C₁-C₄ алкил)₃, B(OH)₂, ZnHal (къ-
дето Hal = хлорид, бромид) и т.н., по известен
начин (виж напр. Tetrahedron Lett. 27, 5269
(1986), в присъствието на катализатор пре-
ходни метали като паладий или никел и в да-
дена случай основа.



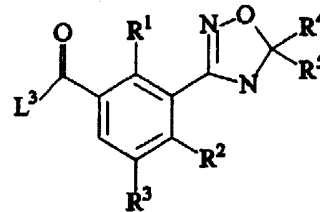
Възможно е също естери с формула (III γ) да се получат чрез изграждане на свързания в положение 3 хетероцикъл.

Например от амидооксими с формула IX,

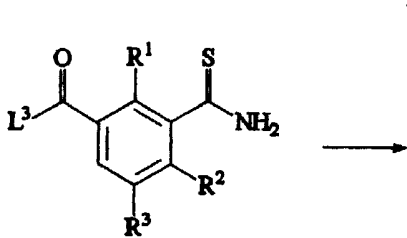


(IX)

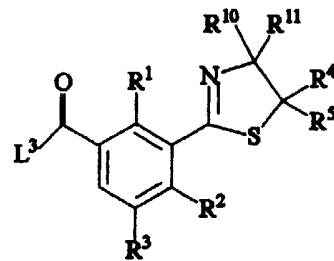
чрез кондензация с алдехиди или кетони могат да се получат производни на 1,2,4-оксадиазолин-3-ил (III γ с X=O, Y=NH) (сравни напр. Arch. Phar. 326, 383-389 (1993))

(III γ) (където X=O, Y=NH)

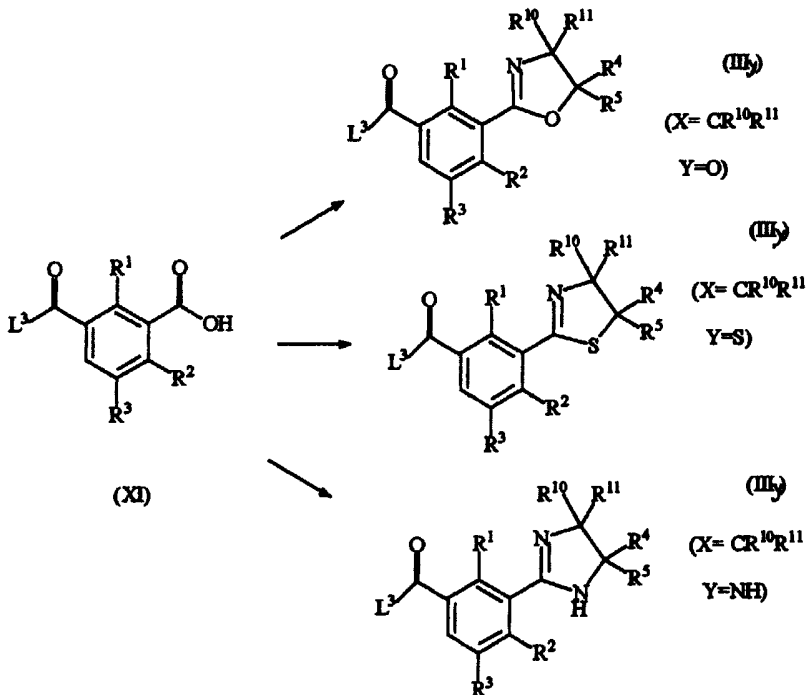
Тиоамидите с формула X са подходящи изходни продукти за производни на 2-тиазолинил I (където X = CR¹⁰R¹¹, Y=S) (сравни напр. Tetrahedron 42, 1449-1460 (1986)).



(X)

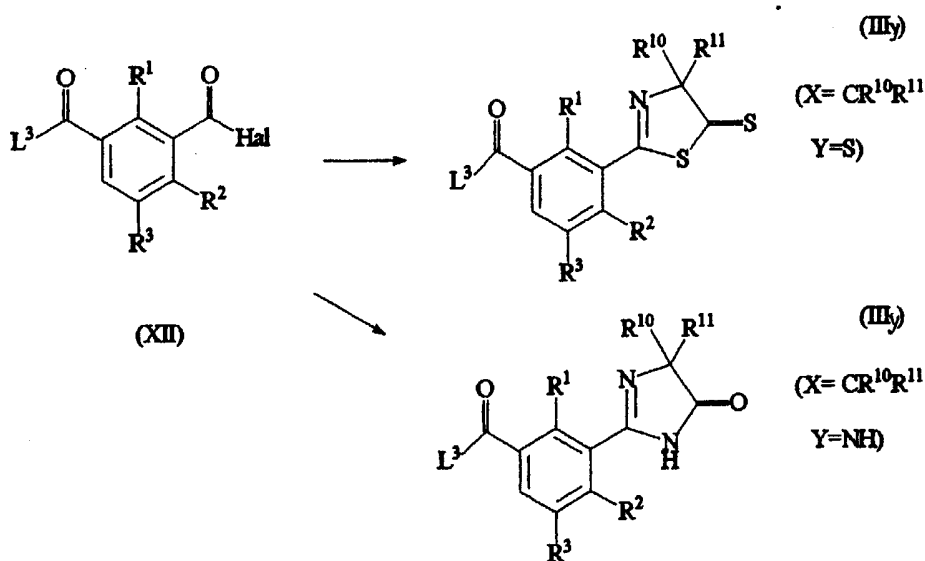
(III γ) (където X=CR¹⁰R¹¹, Y=S)

От карбоксилните киселини с формула (XI) могат да се получат производни на 2-оксазолинил, 2-тиазолинил и 2-имидазолинил (III γ , където X = CR¹⁰R¹¹, Y=O съотв. Y=S съотв. Y=NH) (сравни напр. Tetrahedron Lett. 22, 4471-4474 (1981)).



По известни в литературата методи, от халогениди на карбоксилни киселини с формула (XII), където Hal означава халоген, по-специално от хлориди на карбоксилни киселини,

могат да се получат производни на 1,3-тиазол-5(4H)-тион-2-ил (виж напр. *Helv. Chim. Acta*, 69, 374-388 (1986) и на 5-оксо-2-имидазолин-2-ил (виж напр. *Heterocycles*, 29 1185-1189 (1989) 5 (III), където $X = CR^{10}R^{11}$, $Y=S$ съотв. $Y=NH$).

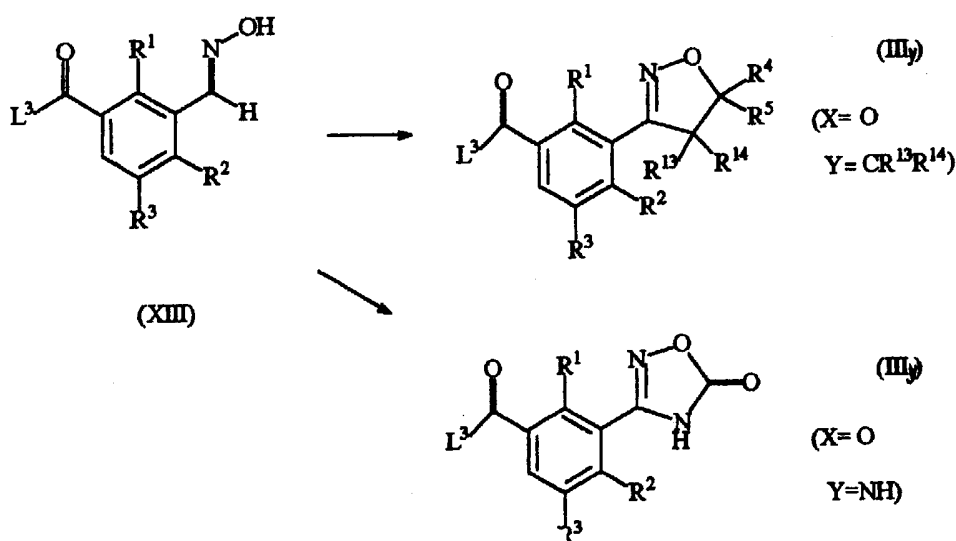


Превръщането на оксими с формула (XIII) в производни на 4,5-дихидроизоксазол-3-ил (с III_γ, където $X=O$, $Y = CR^{13}R^{14}$) може да се осъществи по известен начин през междинен етап на хлориди на хидроксамови киселини (XIV). От последните се получават *in situ* нит-

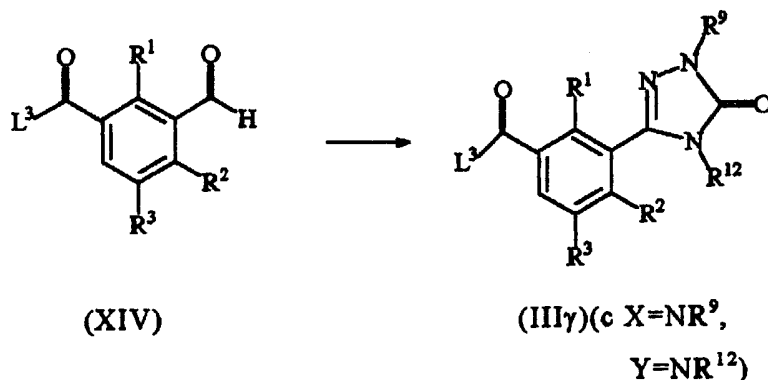
25

рилоксиди, които реагират с алкени до желаните продукти (виж напр. *Chem. Ber.* 106, 3258-3274 (1973). 1,3-диполярни циклоприсъединителни съединения на хлоросулфонилозианат към нитрилоксиди водят до производни на 1,2,4-оксадиазолин-5-он-3-ил (III_γ с $X=O$, $Y=NH$) (виж напр. *Heterocycles* 27, 683-685 (1988).

30

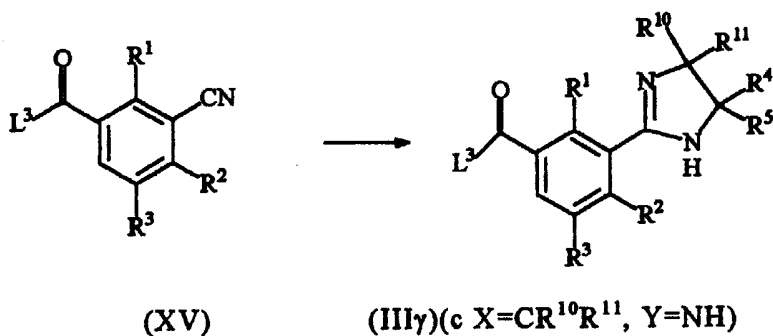


Алдеhidите с формула (XIV) могат да се превърнат в производни на 2,4-дихидро-1,2,4-триазол-3-он-5-ил (III с $X = NR^9$, $Y = NR^{12}$) през междинен етап на семикарбазон (виж напр. J.Heterocyclic Chem. 23, 881-883 (1986).

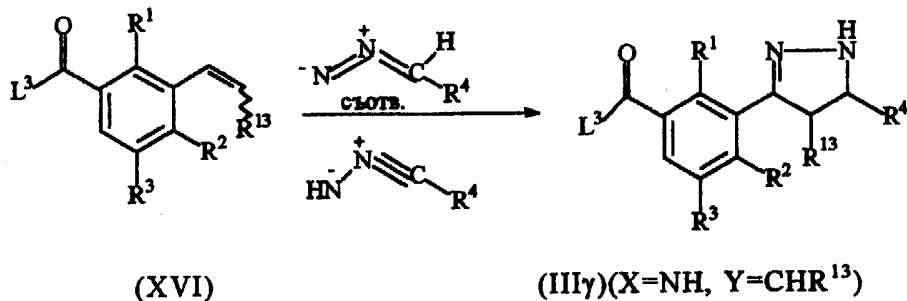


2-имидазолинилните производни (III γ с $X = CR^{10}R^{11}$, $Y = NH$) могат да се получат също от бензонитрили с формула (XV) по известни методи (виж напр. J.Org.Chem. 52, 1017-1021 (1987).

20



Посредством 1,3-диполярни циклоприсъединителни съединения на диазоалкани съотв. нитрилимини с ариалкени с формула (XVI) могат да се получат производни на 3-пиразолинил (III γ) (с $X = NH$, $Y = CHR^{13}$).



50

67

Използваните като изходни съединения бромозаместени или йодозаместени съединения с формула (V) могат да се получат по аналогия на известни в литературата методи напр. чрез реакция на Sandmeyer от съответни анилини, които от своя страна се синтезират чрез редукция на подходящи нитросъединения. Бромозаместените съединения с формула (V) освен това могат да се получат чрез директно бромиране на подходящи изходни съединения (виж напр. *Monatsh. Chem.* 99, 815-822 (1968)).

Нитрилите с формула (VI) могат да се получат, както е описано по-горе. Също така е възможно те да се получат от съответните анилини с помощта на реакция на Sandmeyer.

Изходните съединения с формула VII са известни (виж напр. *Coll. Czech. Chem. Commun.* 40, 3009-3019 (1975)) или могат лесно да се получат чрез подходяща комбинация на познати синтези.

Например сулфонатите (VII) ($L^4 = \text{OSO}_2\text{CF}_3, \text{OSO}_3, \text{OSO}_2\text{F}$) се получават от съответните феноли, които от своя страна са известни (виж напр. EP-A 195 247) или могат да се получат по известни методи (виж напр. *Synthesis* 1993, 735-762).

Халогенните съединения (VII) ($L^4 = \text{Cl}, \text{Br}$ или J) могат да се получат например чрез реакция на Sandmeyer от съответните анилини с формула (XIX).

Амидооксимите с формула (IX), тиаамидите с формула (X) и карбоксилните киселини с формули (XI) могат да се получат по известен метод от нитрили с формула (XV).

Освен това е възможно, карбоксилните кисе-

лини с формула XI се получават от алдехиди с формула (XIV) по познати методи (виж напр. (1985)).

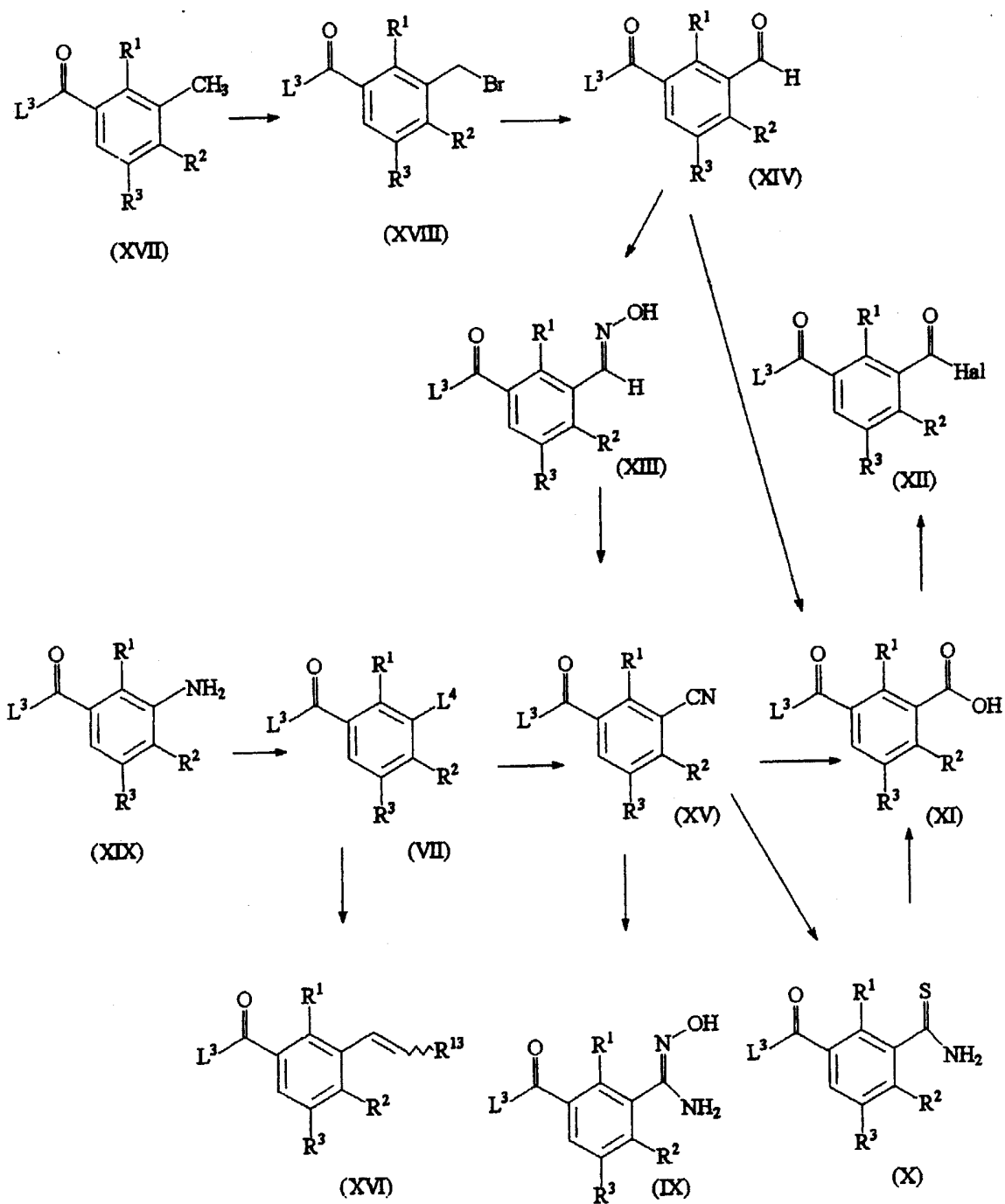
Халогенидите на карбоксилни киселини с формула (XII) могат да се получат по аналогия на стандартни методи от съответните карбоксилни киселини с формула (XI).

Оксимите с формула (XIII) се получават изгодно, като алдехиди с формула (XIV) взаимодействат по известен начин с хидроксиламин (виж напр. J. March, *Advanced Organic Chemistry*, 3 Aufl., S. 805-806, Wiley-Interscience Publication (1985)).

Алдехидите с формула (XIV) са познати или могат да се получат по аналогия на познати методи. Така например те могат да се получат от метилови съединения с формула (XVII) чрез бромиране, например с N-бромосукцинимид или 1,3-дибромо-5,5-диметилхидантоин и последващо окисление (виж *Synth. Commun.* 22, 1967-1971 (1992)).

Превръщането на оксимите с формула (XIII) в нитрили с формула (XV) може да се осъществи също така по познати методи (виж напр. J. March, *Advanced Organic Chemistry*, 3 Aufl., S. 931-932, Wiley-Interscience Publication (1985)).

Като се излиза от халогенни съединения или сулфонати с формула (VII) ($L^4 = \text{Br}, \text{Cl}, \text{OSO}_2\text{CF}_2\text{CF}_3, \text{OSO}_2\text{F}$) могат да се получат между другото, чрез реакция на Heck с олефини в присъствието на палладиев катализатор, арилалкени с формула (XVI) (виж напр. Heck, *Palladium Reagents in Organic Synthesis*, Academic Press, London 1985; *Synthesis* 1993, 735-762).



Примери за изпълнение на изобретението

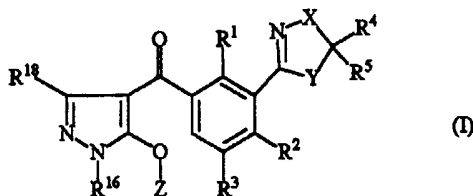
4-[2-хлоро-3-(4,5-дихидроизоксазол-3-ил)-4-метилсулфонилбензоил]-5-хидрокси-1-метил-1Н-пиразол (съединение 3.35)

Към разтвор от 12,74 g (0,13 mol) 5-хидрокси-1-метил-пиразол и 300 ml безводен диоксан, под атмосфера от защитен газ, при стайна температура, се прибавят едновременно, на капки, 43,60 g (0,13 mol) 2-хлоро-3-(4,5-дихидроизоксазол-3-ил)-4-метилсулфонилбензоилхлорид в 375 ml безводен диоксан и 13,56 g (0,134 mol) триетиламин в 375 ml безводен диоксан. След 2 h разбъркване при стайна температура реакционната смес се филтрира през кизелгел и се промива с диоксан. Елюатът се концентрира под вакуум до около 500 ml и се смесва с 17,94 g (0,13 mol) сушен, фино пулверизиран калиев карбонат. След 6 h

нагриване под обратен хладник разтворителят се отдестилира под вакуум и остатъкът се смесва с около 700 ml вода. Неразтворимата част се филтрира и рН-стойността на филтратата се довежда до рН=2-3 чрез бавно прибавяне на 10%-на солна киселина. Образувалата се утайка се филтрира. Получават се 46,16 g (92% от теор.) 4-[2-хлоро-3-(4,5-дихидроизоксазол-3-ил)-4-метилсулфонилбензоил]-5-хидрокси-1-метил-1Н-пиразол. (Т. т. > 250°C).

В таблица 3 са включени освен горното съединение още и други 3-хетероциклизаместени безоилови производни с формула (I), които са получени или могат да се получат по аналогичен начин (в случай, че крайният продукт не се утаи при подкисляването с 10 %-на солна киселина, той се екстрахира с етилацетат или дихлороометан; след това органичната фаза се суши и се концентрира под вакуум):

ТАБЛИЦА 3



№	R ¹	R ²	R ³	X	R ⁴	R ⁵	Y	R ¹⁶	Z	R ¹⁸	Физични данни Т.т.(°C) ¹ H-NMR [δ ppm]
3.1	Cl	Cl	H	O	H	H	CH ₂	n-C ₄ H ₉	H	H	116-117
3.2	Cl	Cl	H	O	H	H	CH ₂	изоC ₄ H ₉	H	H	148-151
3.3	Cl	Cl	H	O	H	H	CH ₂	n-C ₄ H ₉	C ₂ H ₅ SO ₂	H	0,95(t); 1,32(m); 1,62(t); 1,92(q); 3,30(t); 3,78(q); 4,17(t); 4,61(t); 7,42(d); 7,48(m).
3.4	Cl	Cl	H	O	H	H	CH ₂	изо-C ₄ H ₉	изоC ₄ H ₉ SO ₂	H	0,96(d); 1,21(d); 2,33(m); 2,48(m); 3,30(t); 3,67(d); 3,97(d); 4,58(t); 7,42(d); 7,50(m).

№	R ¹	R ²	R ³	X	R ⁴	R ⁵	Y	R ¹⁶	Z	R ¹⁸	Физични данни	
											Т.т.(°C)	¹ H-NMR [δ ppm]
3.5	Cl	Cl	H	O	H	H	CH ₂	n-C ₄ H ₉	нзоС ₄ Н ₉ SO ₂	H	0,97(t); 1,20(d); 1,96(m); 2,49(m); 3,30(t); 3,68(d); 4,12(t); 4,59(t); 7,42(d); 7,49(d); 7,52(s).	
3.6	Cl	Cl	H	O	H	H	CH ₂	n-C ₄ H ₉	С ₂ Н ₅ SO ₂	H	0,97(t); 1,12(d); 1,63(t); 1,94(m); 3,29(t); 3,76(q); 4,14(t); 4,60(t); 7,42(d); 7,48(d); 7,15(s).	
3.7	Cl	SO ₂ CH ₃	H	O	COOC ₂ H ₅	H	CH ₂	CH ₃	H	H	70-75	
3.8	Cl	SO ₂ CH ₃	H	O	COOC ₂ H ₅	H	CH ₂	С ₂ Н ₅	H	H	65-70	
3.9	Cl	SO ₂ CH ₃	H	O	CH ₃	H	CH ₂	CH ₃	H	H	230-235	
3.10	Cl	SO ₂ CH ₃	H	O	CH ₃	H	CH ₂	С ₂ Н ₅	H	H	210-215	
3.11	Cl	SO ₂ CH ₃	H	O	CH ₃	H	CH ₂	n-C ₃ H ₇	H	H	95-100	
3.12	Cl	SO ₂ CH ₃	H	O	CH ₃	H	CH ₂	CH ₃	С ₂ Н ₅ SO ₂	H	70-75	

№	R ¹	R ²	R ³	X	R ⁴	R ⁵	Y	R ¹⁶	Z	R ¹⁸	Физични данни Т.т.(°С) ¹ H-NMR [δ ppm]
3.13	Cl	SO ₂ CH ₃	H	O	CH ₃	H	CH ₂	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅ SO ₂	H	78-83
3.14	Cl	SO ₂ CH ₃	H	O	CH ₃	H	CH ₂	C ₂ H ₅	изоC ₄ H ₉ SO ₂	H	1,24(2d); 1,53(t); 2,52(m); 3,05(dd); 3,29(s); 3,52(dd); 3,73(d); 4,24(q); 5,05(m); 7,49(s); 7,66(d); 8,18(d).
3.15	Cl	SO ₂ CH ₃	H	O	CH ₃	H	CH ₂	n-C ₃ H ₇	C ₂ H ₅ SO ₂	H	0,96(t); 1,53(d); 1,68(t); 1,95(sext); 3,07(dd); 3,32(s); 3,58(dd); 3,86(q); 4,15(t); 5,03(m); 7,46(d); 7,64(d); 8,18(d).
3.16	Cl	SO ₂ CH ₃	H	O	CH ₃	CH ₃	CH ₂	CH ₃	H	H	220-225
3.17	Cl	SO ₂ CH ₃	H	O	CH ₃	CH ₃	CH ₂	C ₂ H ₅	H	H	82-86
3.18	Cl	SO ₂ CH ₃	H	O	CH ₃	CH ₃	CH ₂	n-C ₃ H ₇	H	H	70-75
3.19	Cl	SO ₂ CH ₃	H	O	CH ₃	CH ₃	CH ₂	n-C ₄ H ₉	H	H	68-73

№	R ¹	R ²	R ³	X	R ⁴	R ⁵	Y	R ¹⁶	Z	R ¹⁸	Фізичні дані Т.т.(°С) ¹ H-NMR [δ ppm]
3.20	Cl	SO ₂ CH ₃	H	O	CH ₃	CH ₃	CH ₂	изоC ₄ H ₉	H	H	45-50
3.21	Cl	SO ₂ CH ₃	H	O	C ₂ H ₅	H	CH ₂	CH ₃	H	H	220-225
3.22	Cl	SO ₂ CH ₃	H	O	C ₂ H ₅	H	CH ₂	C ₂ H ₅	H	H	170-175
3.23	Cl	SO ₂ CH ₃	H	O	H	H	CH ₂	н-C ₃ H ₇	H	H	65-70
3.24	Cl	SO ₂ CH ₃	H	O	H	H	CH ₂	н-C ₄ H ₉	H	H	55-60
3.25	Cl	SO ₂ CH ₃	H	O	H	H	CH ₂	изоC ₄ H ₉	H	H	58-63
3.26	Cl	SO ₂ CH ₃	H	O	H	H	CH ₂	н-C ₄ H ₉	C ₂ H ₅ SO ₂	H	78-83
3.27	Cl	SO ₂ CH ₃	H	O	H	H	CH ₂	н-C ₄ H ₉	изоC ₄ H ₉ SO ₂	H	0,94(t); 1,19(d); 1,22(t); 1,38(m); 1,74(br); 1,91(m); 2,53(m); 3,26(s); 4,45(t); 3,76(d); 4,18(t); 4,62(t); 7,45(s); 7,64(d); 8,16(d).

№	R ¹	R ²	R ³	X	R ⁴	R ⁵	Y	R ¹⁶	Z	R ¹⁸	Физични данни	
											Т.т.(°С)	¹ H-NMR [δ ppm]
3.28	Cl	SO ₂ CH ₃	H	O	H	H	CH ₂	изоС ₄ H ₉	изоС ₄ H ₉ SO ₂	H	0,96(d); 1,21(d); 2,33(m); 2,51(m); 3,28(s); 3,44(t); 3,75(d); 3,99(d); 4,61(t); 7,45(s); 7,66(d); 8,17(d).	
3.29	Cl	SO ₂ CH ₃	H	O	H	H	CH ₂	изоС ₄ H ₉	С ₂ H ₅ SO ₂	H	0,97(d); 1,66(t); 2,36(m); 3,29(s); 3,43(t); 3,82(q); 3,99(d); 4,60(t); 7,47(s); 7,68(d); 8,18(d).	
3.30	Cl	SO ₂ CH ₃	H	O	H	H	CH ₂	CH ₃	С ₂ H ₅ SO ₂	H	1,68(t); 3,29(s); 3,43(t); 3,78(q); 3,92(s); 3,63(t); 7,46(s); 7,62(d); 8,17(d).	

№	R ¹	R ²	R ³	X	R ⁴	R ⁵	Y	R ¹⁶	Z	R ¹⁸	Физични данни Т.т.(°С) ¹ H-NMR [δ ppm]
3.31	Cl	SO ₂ CH ₃	H	O	H	H	CH ₂	CH ₃	изоC ₄ H ₉ SO ₂	H	1,23(d); 2,53(m); 3,28(s); 3,43(t); 3,70(d); 3,91(s); 4,61(t); 7,48(s); 7,66(d); 8,18(d).
3.32	Cl	Cl	H	O	H	H	CH ₂	H-C ₃ H ₇	H	H	119-121
3.33	Cl	Cl	H	O	H	H	CH ₂	CH ₃	H	CH ₃	115-117
3.34	Cl	NO ₂	H	O	H	H	CH ₂	C ₂ H ₅	H	H	217-218
3.35	Cl	SO ₂ CH ₃	H	O	H	H	CH ₂	CH ₃	H	H	> 250
3.36	Cl	Cl	H	O	H	H	CH ₂	C ₂ H ₅	H	H	125-128
3.37	Cl	SO ₂ CH ₃	H	O	H	H	CH ₂	C ₂ H ₅	H-C ₃ H ₇ SO ₂	H	78-83
3.38	Cl	SO ₂ CH ₃	H	O	H	H	CH ₂	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅ SO ₂	H	1,52(t); 1,68(t); 3,29(s); 3,43(t); 3,82(q); 4,24(q); 4,63(t); 7,48(s); 7,65(d); 8,07(d).

№	R ¹	R ²	R ³	X	R ⁴	R ⁵	Y	R ¹⁶	Z	R ¹⁸	Физични данни Т.т.(°С) ¹ H-NMR [δ ppm]
3.39	Cl	SO ₂ C ₂ H ₅	H	O	CH ₃	CH ₃	CH ₂	CH ₃	H	H	> 200
3.40	Cl	SO ₂ C ₂ H ₅	H	O	CH ₃	H	CH ₂	CH ₃	H	H	220-223
3.41	Cl	SO ₂ C ₂ H ₅	H	O	CH ₃	H	CH ₂	C ₂ H ₅	H	H	> 230
3.42	Cl	SO ₂ - н-C ₃ H ₇	H	O	CH ₃	H	CH ₂	CH ₃	H	H	1,12(t); 1,53(d); 1,76(q); 3,18(dd); 3,38(t); 3,55(dd); 3,73(s); 5,04(m); 5,55(s, br); 7,37(s); 7,68(d); 8,13(d).
3.43	Cl	SO ₂ - н-C ₃ H ₇	H	O	CH ₃	H	CH ₂	C ₂ H ₅	H	H	1,07(t); 1,50(m); 1,78(q); 3,07(dd); 3,39(t); 3,55(dd); 4,12(t); 5,08(m); 7,38(s); 7,69(d); 8,11(d).
3.44	Cl	SO ₂ CH ₃	H	CH ₂	H	H	O	CH ₃	H	H	

№	R ¹	R ²	R ³	X	R ⁴	R ⁵	Y	R ¹⁶	Z	R ¹⁸	Физични данни Т.т.(°С) ¹ H-NMR [δ ppm]
3.45 а)	Cl	SO ₂ CH ₃	H	C(CH ₂) ₂	H	H	O	CH ₃	H	H	1,33(s); 3,40(s); 4,17(s); 7,43(s); 7,79(d); 8,04(d).
3.46	Cl	SO ₂ CH ₃	H	O	H	H	CH ₂	C ₂ H ₅	Na ⁺	H	218-220
3.47	Cl	SO ₂ CH ₃	H	O	H	H	CH ₂	C ₂ H ₅	K ⁺	H	193
3.48	Cl	SO ₂ CH ₃	H	O	H	H	CH ₂	C ₂ H ₅	Li ⁺	H	> 230
3.49	Cl	SO ₂ CH ₃	H	O	H	H	CH ₂	C ₂ H ₅	NH ₄ ⁺	H	170-175
3.50	Cl	SO ₂ CH ₃	H	O	H	H	CH ₂	CH ₃	Na ⁺	H	> 240
3.51	Cl	SO ₂ CH ₃	H	O	H	H	CH ₂	CH ₃	K ⁺	H	206-214
3.52	Cl	SO ₂ CH ₃	H	O	H	H	CH ₂	CH ₃	Li ⁺	H	> 240
3.53	Cl	SO ₂ CH ₃	H	O	H	H	CH ₂	CH ₃	NH ₄ ⁺	H	
3.54 а)	Cl	SO ₂ CH ₃	H	C(CH ₃) ₂	H	H	O	C ₂ H ₅	H	H	1,27(t); 1,36(s); 3,41(q); 4,01(q); 4,18(s); 7,47(s); 7,83(d); 8,07(d).

№	R ¹	R ²	R ³	X	R ⁴	R ⁵	Y	R ¹⁶	Z	R ¹⁸	Физични данни	
											Т.т.(°C)	¹ H-NMR [δ ppm]
3.55	Cl	SO ₂ CH ₃	H	O	H	-(CH ₂) ₃ CH-		C ₂ H ₅	H	H	99-104	
3.56	Cl	SO ₂ CH ₃	H	O	H	-(CH ₂) ₃ CH-		CH ₃	H	H	95-100	
3.57	Cl	SO ₂ CH ₃	H	O	-(CH ₂) ₄ -	CH ₂		CH ₃	H	H	230-235	
3.58	Cl	SO ₂ CH ₃	H	O	-(CH ₂) ₄ -	CH ₂		C ₂ H ₅	H	H	190-195	
3.59	Cl	SO ₂ CH ₃	H	O	-(CH ₂ O(CH ₂) ₂) ₂ -	CH ₂		C ₂ H ₅	H	H	95-100	
3.60	Cl	SO ₂ C ₂ H ₅	H	O	CH ₃	CH ₂		CH ₃	H	H	> 230	
3.61	Cl	SO ₂ C ₂ H ₅	H	O	CH ₃	CH ₂		C ₂ H ₅	H	H	198-200	
3.62	Cl	SO ₂ C ₂ H ₅	H	O	H	CH ₂		CH ₃	H	H	215-218	
3.63	Cl	SO ₂ C ₂ H ₅	H	O	H	CH ₂		C ₂ H ₅	H	H	213-215	
3.64	Cl	SO ₂ H-C ₃ H ₇	H	O	H	CH ₂		CH ₃	H	H	186-190	
3.65	Cl	SO ₂ H-C ₃ H ₇	H	O	H	CH ₂		C ₂ H ₅	H	H	84-86	
3.66	Cl	SO ₂ CH ₃	H	O	-(CH ₂ O(CH ₂) ₂) ₂ -	CH ₂		CH ₃	H	H	90-95	
3.67	Cl	SO ₂ CH ₃	H	O	C ₂ H ₅	CH ₂		CH ₃	H	H	70-75	

№	R ¹	R ²	R ₃	X	R ⁴	R ⁵	Y	R ¹⁶	Z	R ¹⁸	Физични данни	
											T.t.(°C)	¹ H-NMR [δ ppm]
3.68	Cl	SO ₂ CH ₃	H	O	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	CH ₂	C ₂ H ₅	H	H	50-55	
3.69	Cl	SO ₂ CH ₃	H	O	OCH ₃	H	CH ₂	CH ₃	H	H	3,18-3,99(1H); 5,78(1H); 7,50(1H); 7,81(1H); 8,09(1H).	
3.70	Cl	SO ₂ CH ₃	H	O	CH ₃	H	CHCH ₂ Cl	CH ₃	H	H	1,52(3H); 3,30- 4,12(8H); 4,36(1H); 4,93(1H); 7,49(1H); 7,81(1H); 8,09(1H).	
3.71	Cl	SO ₂ CH ₃	H	O	CH ₃	H	CHCH ₂ Cl	C ₂ H ₅	H	H	1,27(3H); 1,55(3H); 3,28-4,02(7H); 4,37(1H); 4,92(1H); 7,48(1H); 7,80(1H); 8,07(1H).	
3.72	Cl	SO ₂ CH ₃	H	C(CH ₃) ₂	H	H	O	CH ₃	H	H	132-135	
3.73	Cl	SO ₂ CH ₃	H	O	OC ₂ H ₅	H	CH ₂	CH ₃	H	H	95-100	

№	R ¹	R ²	R ³	X	R ⁴	R ⁵	Y	R ¹⁶	Z	R ¹⁸	Физични данни	
											Т.т.(°C)	¹ H-NMR [δ ppm]
3.74	Cl	SO ₂ CH ₃	H	O	OC ₂ H ₅	H	CH ₂	C ₂ H ₅	H	H	1,16(3H); 1,27(3H); 3,20-4,00(9H); 5,89(1H); 7,50(1H); 7,82(1H); 8,07(1H).	
3.75	Cl	SO ₂ CH ₃	H	O	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	CH ₂	C ₂ H ₅	K ⁺	H	200-205	
3.76	Cl	SO ₂ C ₂ H ₅	H	C(CH ₃) ₂	H	H	O	CH ₃	H	H	120-123	
3.77	Cl	SO ₂ H-C ₃ H ₇	H	O	CH ₃	CH ₃	CH ₂	C ₂ H ₅	H	H	152-158	
3.78	Cl	SO ₂ H-C ₃ H ₇	H	O	CH ₃	CH ₃	CH ₂	CH ₃	H	H	172-176	
3.79	Cl	SO ₂ H-C ₃ H ₇	H	O	CH ₃	H	CH ₂	CH ₃	H	H	188-205	
3.80	Cl	SCH ₃	H	O	H	H	CH ₂	C ₂ H ₅	H	H	1,29(t); 2,56(s); 3,28(t); 3,93(q); 4,49(t); 7,40(s); 7,43(d); 7,55(d).	
3.81		SO ₂ CH ₃	H	O	CH ₂ Cl	H	CH ₂	C ₂ H ₅	H	H	78-82	

№	R ¹	R ²	R ³	X	R ⁴	R ⁵	Y	R ⁶	Z	R ¹⁸	Физични данни Т.т.(°C) ¹ H-NMR [δ ppm]
3.82	CH ₃	H	H	CH ₂	H	H	S	C ₂ H ₅	H	H	1,44(t); 2,50(s); 3,49(t); 4,09(q); 4,53(t); 7,35(m); 7,48(d); 7,62(d).
3.83	Cl	SO ₂ CH ₃	H	O	CH ₂ Cl	H	CH ₂	CH ₃	H	H	81-85
3.84	Cl	SCH ₃	H	O	H	H	CH ₂	CH ₃	H	H	151-153
3.85	Cl	SOCH ₃	H	O	H	H	CH ₂	C ₂ H ₅	H	H	1,28(t); 2,82(s); 3,40(m); 3,92(m); 4,52(t); 7,45(s); 7,82(d); 8,10(d).
3.86	CH ₃	SO ₂ CH ₃	H	O	H	H	CH ₂	CH ₃	H	H	205-210
3.87	Cl	Cl	H	CH ₂	H	H	S	C ₂ H ₅	H	H	173-179
3.88	Cl	SCH ₃	H	CH ₂	H	H	S	C ₂ H ₅	H	H	1,43(t); 2,51(s); 3,59(t); 4,08(q); 4,51(t); 7,22(d); 7,41(s); 7,50(d).

№	R ¹	R ²	R ³	X	R ⁴	R ⁵	Y	R ¹⁶	Z	R ¹⁸	Физични данни Т.т.(°C) ¹ H-NMR [δ ppm]
3.89	Cl	SO ₂ CH ₃	H	CH ₂	H	H	S	C ₂ H ₅	H	H	1,50(t); 3,28(s); 3,62(t); 4,10(q); 4,49(t); 7,36(s); 7,68(d); 8,19(d).
3.90	CH ₃	SO ₂ CH ₃	H	O	H	H	CH ₂	C ₂ H ₅	H	H	174-180
3.91	Cl	SO ₂ CH ₃	H	O	CH ₂ Cl	H	CH ₂	CH ₃	H	H	77-83
3.92	Cl	SO ₂ CH ₃	H	O	F	H	CH ₂	CH ₃	H	H	
3.93	Cl	SO ₂ CH ₃	H	O	F	H	CH ₂	C ₂ H ₅	H	H	
3.94	Cl	SO ₂ CH ₃	H	O	F	F	CH ₂	CH ₃	H	H	
3.95	Cl	SO ₂ CH ₃	H	O	F	F	CH ₂	C ₂ H ₅	H	H	
3.96	Cl	SO ₂ CH ₃	H	O	CH ₃	H	CHCH ₃	C ₂ H ₅	H	H	183-184
3.97	Cl	SO ₂ CH ₃	H	O	CF ₃	H	CH ₂	CH ₃	H	H	223-225

№	R ¹	R ²	R ³	X	R ⁴	R ⁵	Y	R ¹⁶	Z	R ¹⁸	ФИЗИЧНИ ДАННИ Т.т.(°C) ¹ H-NMR [δ ppm]
3.98	Cl	SO ₂ CH ₃	H	O	CF ₃	H	CH ₂	C ₂ H ₅	H	H	183-184
3.99	Cl	SO ₂ CH ₃	H	O	SC ₂ H ₅	H	CH ₂	CH ₃	H	H	195-196
3.100	Cl	SO ₂ CH ₃	H	O	SC ₂ H ₅	H	CH ₂	C ₂ H ₅	H	H	199-200
3.101	Cl	SO ₂ CH ₃	H	O	CH ₃	H	CHCH ₃	CH ₃	H	H	230-233
3.102	Cl	SO ₂ CH ₃	H	O	CHCl(CH ₃)	H	CH ₂	C ₂ H ₅	H	H	102-107
3.103	Cl	SO ₂ CH ₃	H	O	CHCl(CH ₃)	H	CH ₂	CH ₃	H	H	80-85
3.104	Cl	SO ₂ CH ₃	H	O	n-C ₃ H ₇	H	CH ₂	CH ₃	H	H	
3.105	Cl	SO ₂ CH ₃	H	O	n-C ₃ H ₇	H	CH ₂	C ₂ H ₅	H	H	
3.106	Cl	SO ₂ CH ₃	H	O	H	H	CH ₂	CH ₃	¹³ NH ₂ (CH ₃) ₂	H	200
3.107	Cl	SO ₂ CH ₃	H	O	H	H	CH ₂	CH ₃	¹³ NH ₂ (CH ₂ CH ₂ OH)	H	187

№	R ¹	R ²	R ³	X	R ⁴	R ⁵	Y	R ¹⁶	Z	R ¹⁸	Физични данни Т.т.(°C) ¹ H-NMR [δ ppm]
3.108	Cl	SO ₂ CH ₃	H	O	H	H	CH ₂	CH ₃	¹ NH ₃ (CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₂ OH)	H	180
3.109	SCH ₃	SCH ₃	H	O	H	H	CH ₂	CH ₃	H	H	2,33(s);2,51(s); 3,40(t);3,70(s); 4,58(t);5,15(bfs); 7,21(s);7,31(d); 7,42(d).
3.110	SCH ₃	SCH ₃	H	O	H	H	CH ₂	C ₂ H ₅	H	H	1,38(t);2,33(s); 2,49(s);3,41(t); 4,10(q);4,58(t); 7,25(s);7,32(d); 7,41(d); 7,82(bfs).
3.111	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃	H	O	H	H	CH ₂	CH ₃	H	H	масло
3.112	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃	H	O	H	H	CH ₂	C ₂ H ₅	H	H	масло

а) Получен от 2-хлоро-3-(1'-хлоро-2',2'-диметилетиламинокарбонил)-4-метилсулфонил-бензоилхлорид с 2 еквивалента калиев карбонат

По-нататък са приведени синтезите на някои изходни вещества:

2-хлоро-3-(4,5-дихидроизоксазол-3-ил)-4-метилсулфонил-бензоилхлорид (съединение 4.5)

Етап а) 2-хлоро-3-метил-4-метилтиоацетофенон 5

Към суспензия от 286 g (2,14 mol) алуминиев трихлорид в 420 ml 1,2-дихлороетан се прибавя на капки, при 15-20°C, разтвор от 157 g (2 mol) ацетилхлорид в 420 ml 1,2-дихлороетан. 10 След това се прибавя на капки разтвор от 346 g (2 mol) 2-хлоро-6-метилтиотолуен в 1 L 1,2-дихлороетан. След 12 h разбъркване, реакционната смес се излива в смес от 3 L лед и 1 L конц. HCl. Екстрахира се с метиленхлорид, органичната фаза се промива с вода, суши се над натриев сулфат и се концентрира. Остатъкът се дестилира под вакуум. Получават се 256 g (60 % от теорет.) 2-хлоро-3-метил-4-метилтиоацетофенон. (Т.т.: 46°C).

Етап б) 2-хлоро-3-метил-4-метилсулфонилацетофенон 15

В 1,5 L ледена оцетна киселина се разтварят 163,0 g (0,76 mol) 2-хлоро-3-метил-4-метилтио-ацетофенон, смесват се с 18,6 g натриев волфрамат и се прибавя на капки, при охлаждане, 173,3 g 30 %-ен разтвор на водороден пероксид. След това се разбърква 2 дни и се разрежда с вода. Отделеното твърдо вещество се филтрира на Нуч филтър, промива се с вода и се суши. Получават се 164,0 g (88 % от теорет.) 2-хлоро-3-метил-4-метилсулфонилацетофенон. (Т.т.: 110-111°C).

Етап в) 2-хлоро-3-метил-4-метилсулфонилбензоена киселина 20

В 700 ml диоксан се разтварят 82 g (0,33 mol) 2-хлоро-3-метил-4-метилсулфонил-ацетофенон и се смесват при стайна температура с 1 L 12,5 %-ен разтвор на натриев хипохлорит. След това се разбърква 1 h при 80°C. След охлаждане се образуват две фази, от които долната се разрежда с вода и се подкислява слабо. Отделеното твърдо вещество се филтрира на Нуч филтър, промива се с вода и се суши. Получават се 60 g (73 % от теорет.) 2-хлоро-3-метил-4-метилсулфонилбензоена киселина. (Т.т.: 230-231°C).

Етап г) Метил 2-хлоро-3-метил-4-метилсулфонил-бензоат 25

В 1 L метанол се разтварят 100 g (0,4 mol) 2-хлоро-3-метил-4-метилсулфонилбензоена киселина и при температурата на кипене под обратен хладник се насища с газ хлороводород в

продължение на 5 h с. След това се концентрира. Получават се 88,5 g (84 % от теор.) метил 2-хлоро-3-метил-4-метилсулфонил-бензоат. (Т.т.: 107-108°C).

Етап д) Метил 3-бромометил-2-хлоро-4-метилсулфонилбензоат 30

В 2 L тетрахлорометан се разтварят 82 g (0,31 mol) метил 2-хлоро-3-метил-4-метилсулфонилбензоат и се смесват на части, при осветяване, с 56 g (0,31 mol) N-бромосукцинимид. Реакционната смес се филтрира, филтратът се концентрира и остатъкът се разбърква в 200 ml метил-трет-бутилов етер. Разтворът се смесва с петролев етер, отделеното твърдо вещество се филтрира на Нуч филтър и се суши. Получават се 74,5 g (70 % от теор.) метил 3-бромометил-2-хлоро-4-метилсулфонилбензоат.

Етап е) Метил 2-хлоро-3-формил-4-метилсулфонил-бензоат 35

Разтвор от 41,0 g (0,12 mol) метил 3-бромометил-2-хлоро-4-метилсулфонилбензоат в 250 ml ацетонитрил се смесва с 42,1 g (0,36 mol) N-метилморфолин-N-оксид. Сместа се разбърква 12 h при стайна температура, след това се концентрира и остатъкът се разбърква в етилацетат. Разтворът се екстрахира с вода, суши се с натриев сулфат и се концентрира. Получават се 31,2 g (94 % от теор.) метил 2-хлоро-3-формил-4-метилсулфонилбензоат (Т.т.: 98-105°C).

Етап ж) 2-хлоро-3-хидроксиминометил-4-метилсулфонилбензоена киселина 40

В 300 ml метанол се разтварят 15,00 g (54 mmol) метил 2-хлоро-3-формил-4-метилсулфонилбензоат и 4,20 g (60 mmol) хидроксиламин хидрохлорид и се прибавя на капки разтвор от 3,18 g (30 mmol) натриев карбонат в 80 ml вода. След 12 h разбъркване при стайна температура, метанолът се отдестилира, остатъкът се разрежда с вода и се екстрахира с диетилов етер. След сушене на органичната фаза, разтворителят се отстранява. Получават се 14,40 g (91 % от теор.) метил 2-хлоро-3-хидроксиминометил-4-метилсулфонилбензоат. (Т.т.: 126-128°C).

Етап з) метил 2-хлоро-3-(4,5-дихидроизоксазол-3-ил)-4-метилсулфонилбензоат (съединение 4.3) 45

В разтвор от 158,0 g (0,54 mol) метил 2-хлоро-3-хидроксиминометил-4-метилсулфонилбензоат и 1 L дихлорометан се прибавя етилен при 15-20°C, в продължение на 30 min.

След прибавяне на 1,6 g натриев ацетат, се прибавят на капки 454 ml разтвор на натриев хидрохлорид при 10°C, при едновременно прибавяне на етилен. След това се прибавя още етилен в продължение на 15 min при 10°C. След 12 h разбъркване, фазите се разделят, органичната фаза се промива с вода, суши се и се сгъстява. Получават се 156,5 g (90 % от теор.) метилов 2-хлоро-(4,5-дихидроизоксазол-3-ил)-4-метилсулфонилбензоат.

(¹H-NMR (δ в ppm): 3,24 (s); 3,42 (t); 3,99 (s); 4,60 (t); 7,96 (d); 8,10 (d).

Етап i) 2-хлоро-3-(4,5-дихидроизоксазол-3-ил)-4-метилсулфонилбензоена киселина (съединение 4.4)

Към смес от 170,0 g (0,54 mol) метилов 2-хлоро-3-(4,5-дихидроизоксазол-3-ил)-4-метилсулфонилбензоат и 1 L метанол се прибавя на капки, бавно, при 40-45°C, разтвор от 32,8 g натриев хидроксид разтворен в 330 ml метанол. Суспензията се разбърква 5 h при 50°C. След отдестилиране на разтворителя, остатъкът се разтваря в 1,5 L вода и водната фаза се екстрахира трикратно с етилацетат. Водната фаза се подкислява със солна киселина и се екстрахира трикратно с етилацетат. След това обединените органични фази се промиват до неутрална реакция с вода, сушат се и се концентрират. Получават се 148,8 g (91 % от теор.) 2-хлоро-3-(4,5-дихидроизоксазол-3-ил)-4-метилсулфонилбензоена киселина.

(¹H-NMR (δ в ppm): 3,26 (s), 3,45 (t), 4,63 (t), 8,15 (s), 8,53 (s,br)).

Етап j) 2-хлоро-3-(4,5-дихидроизоксазол-3-ил)-4-метилсулфонилбензоилхлорид (съединение 4.5)

Към разтвор от 139,0 g 2-хлоро-3-(4,5-дихидроизоксазол-3-ил)-4-метилсулфонилбензоена киселина, 1 ml диметилформамид и 1 L сух толуен се прибавят на капки, при 50°C, 74,8 g (0,63 mol) тионилхлорид в 50 ml толуен. След 6 h нагряване при 110°C разтворителят се одестилира. Получава се 2-хлоро-3-(4,5-дихидроизоксазол-3-ил)-4-метилсулфонил-бензоилхлорид в количествен добив.

(¹H-NMR (δ в ppm): 3,25 (s), 3,46 (t), 4,62 (t), 8,21 (dd)).

2-хлоро-3-(5-метил-4,5-дихидроизоксазол-3-ил)-4-метилсулфонилбензоилхлорид (съединение 4.39)

Етап а) метилов 2-хлоро-3-(5-метил-4,5-

дихидроизоксазол-3-ил)-4-метилсулфонилбензоат (съединение 4.25)

В разтвор на 15,0 g (52 mmol) метилов 2-хлоро-3-хидроксииминометил-4-метилсулфонилбензоат и 200 ml дихлорометан се прибавя пропен при стайна температура, в продължение на 30 min. След прибавяне на 1,6 g натриев ацетат, се прибавя на капки 42,8 ml разтвор на натриев хидрохлорид, при стайна температура при едновременно прибавяне на пропен. След още 15 min се прибавя пропен при стайна температура. След 3 h нагряване под обратен хладник, се разбърква 12 h при стайна температура, отново се прибавя пропен 5 h под обратен хладник и отново се разбърква 12 h при стайна температура. След разделяне на фазите, органичната фаза се промива с вода, суши се и се концентрира. Получават се 15,5 g (89 % от теор.) метилов 2-хлоро-(5-метил-4,5-дихидроизоксазол-3-ил)-4-метилсулфонилбензоат (Т.т.: 130-135°C).

Етап b) 2-хлоро-3-(5-метил-4,5-дихидроизоксазол-3-ил)-4-метилсулфонилбензоена киселина (съединение 4.26)

Към смес от 15,00 g (45 mmol) метилов 2-хлоро-3-(5-метил-4,5-дихидроизоксазол-3-ил)-4-метилсулфонилбензоат и 200 ml метанол се прибавя бавно, на капки, разтвор от 3,52 g (88 mmol) натриев хидроксид разтворен в 100 ml метанол. Суспензията се разбърква 48 h при стайна температура. След одестилиране на разтворителя, остатъкът се разбърква с вода и водната фаза се промива трикратно с етилацетат. Водната фаза се подкислява със солна киселина и се екстрахира трикратно с етилацетат. Обединените органични фази след това се промиват до неутрална реакция с вода, сушат се и се концентрират. Получават се 13,20 g (92 % от теор.) 2-хлоро-3-(5-метил-4,5-дихидроизоксазол-3-ил)-4-метилсулфонилбензоена киселина. (Т.т.: 173-178°C).

Етап с) 2-хлоро-3-(5-метил-4,5-дихидроизоксазол-3-ил)-4-метилсулфонилбензоилхлорид (съединение 4.39)

Към разтвор от 13,0 g (41 mmol) 2-хлоро-3-(5-метил-4,5-дихидроизоксазол-3-ил)-4-метилсулфонилбензоена киселина, 1 ml диметилформамид и 250 ml сух толуен се прибавя на капки, при стайна температура 5,7 g (51 mmol) тионилхлорид. След това се нагрява под обратен хладник до пълно взаимодействие. След охлаждане разтворителят се одестили-

ра. Получават се 14,2 g 2-хлоро-3-(5-метил-4,5-дихидроизоксазол-3-ил)-4-метилбензоилхлорид в количествен добив.

2-хлоро-3-(1'-хлор-2',2'-диметилетиламинокарбонил)-4-метилсулфонилбензоилхлорид 5

Етап а) метилов 2-хлоро-3-хидроксикарбонил-4-метилсулфонилбензоат

Към разтвор от 115,3 g (0,42 mol) метилов 2-хлоро-3-формил-4-метилсулфонилбензоат и 2000 ml ацетонитрил се прибавят при 5°C, 10 едно след друго 13,8 g (0,11 mol) натриев хидрогенфосфат монохидрат в 170 ml вода, 49,3 g (0,43 mol) 30 %-ен разтвор на водороден пероксид и 66,2 g (0,59 mol) 80 %-ен воден разтвор на натриев хлорит. Реакционният разтвор след това се разбърква 1 h при 5°C и 12 h при стайна температура. След това с 10 %-на солна киселина се довежда до pH=1 и се прибавят 1500 ml воден 40 %-ен разтвор на натриев хидрогенсулфит. След 1 h разбъркване при стайна температура, водната фаза се екстрахира трикратно с етилацетат. Обединените органични фази се промиват с разтвор на натриев хидрогенсулфит и се сушат. След отдестилиране на разтворителя се получават 102,0 g метилов 2-хлоро-3-хидроксикарбонил-4-метилсулфонилбензоат. 25

(¹H-NMR (δ в ppm): 3,34 (s), 3,93 (s), 8,08 (s), 14,50 (s,br)).

Етап б) метилов 2-хлоро-3-хлорокарбонил-4-метилсулфонилбензоат 30

Към разтвор на 6,0 g (0,021 mol) метилов 2-хлоро-3-хидроксикарбонил-4-метилсулфонилбензоат и 50 ml сух толуен се прибавят 2 капки диметилформаид и 11,9 g (0,1 mol) тионилхлорид. Разтворът се нагрива 4 h под обратен хладник. След отстраняване на разтворителя под вакуум, се получават 6,2 g метилов 2-хлоро-3-хлорокарбонил-4-метилсулфонилбензоат. 35

(¹H-NMR (δ в ppm): 3,21 (s), 4,02 (s), 8,02 (d), 8,07 (d)).

Етап с) метилов 2-хлоро-3-(1'-хидрокси-2',2'-диметилетиламинокарбонил)-4-метилсулфонилбензоат

Към разтвор от 4,54 g (50 mmol) 2,2-диметилетаноламин в 40 ml дихлорометан се прибавя на капки, при 0-5°C, разтвор на 7,80 g (25 mmol) метилов 2-хлоро-3-хлорокарбонил-4-метилсулфонилбензоат. След 6 h разбъркване при стайна температура, реакционният разтвор се екстрахира трикратно с вода, суши се и се концентрира. Получават се 8,20 g (80 % от теор.) метилов 2-хлоро-3-(1'-хидрокси-2',2'-диметиле-

тиламино-карбонил)-4-метилсулфонилбензоат. (Т.т.: 70-72°C).

Етап d) метилов 2-хлоро-3-(1'-хлоро-2',2'-диметилетиламинокарбонил)-4-метилсулфонилбензоат

Смес от 6,9 g (20 mmol) метилов 2-хлоро-3-(1'-хидрокси-2',2'-диметилетиламинокарбонил)-4-метилсулфонил-бензоат и 5 ml тионилхлорид се разбърква 6 h при стайна температура. Разтворът се разрежда с 50 ml дихлорометан и след това се концентрира. Остатъкът се разтваря в 20 ml дихлорометан. Чрез прибавяне на циклохексан се образува кристална утайка, която се филтрира на Нуч филтър и се суши. Получават се 6,4 g (88 % от теор.) метилов 2-хлоро-3-(1'-хлоро-2',2'-диметилетиламинокарбонил)-4-метилсулфонилбензоат.

Етап е) 2-хлоро-3-(4',4'-диметил-4',5'-дихидрооксазол-2-ил)-4-метилсулфонилбензоена киселина (съединение 4.38)

Разтвор от 5,82 g (15 mmol) метилов 2-хлоро-3-(1'-хлоро-2',2'-диметилетиламинокарбонил)-4-метилсулфонил-бензоат и 0,81 g (20 mmol) натриев хидроксид в 80 ml метанол се разбърква 8 h при стайна температура. След отдестилиране на разтворителя, остатъкът се разтваря във вода и се промива трикратно с етилацетат. Водната фаза се подкислява със солна киселина и се екстрахира трикратно с етилацетат. След сушене на органичната фаза, разтворителят се отстранява под вакуум. Получават се 3,10 g (56 % от теор.) 2-хлоро-3-(4',4'-диметил-4',5'-дихидрооксазол-2-ил)-4-метилсулфонилбензоена киселина

(¹H-NMR (δ в ppm): 1,34 (s), 3,40 (s), 4,13 (s), 8,07 (s), 13,95 (s,br)).

Етап f) 2-хлоро-3-(1'-хлоро-2',2'-диметилетиламино-карбонил)-4-метилсулфонилбензоилхлорид

Разтвор от 3,00 g (9 mmol) 2-хлоро-3-(4',4'-диметил-4',5'-дихидрооксазол-2-ил)-4-метилсулфонилбензоена киселина, 1,43 g тионилхлорид и 1 капка диметилформаид в 80 ml сух толуен се нагрива 3 h под обратен хладник. След охлаждане разтворителят се отдестилира под вакуум. Получават се 3,43 g (86 % от теор.) 2-хлоро-3-(1'-хлоро-2',2'-диметилетиламинокарбонил)-4-метилсулфонилбензоилхлорид.

Метилов 2-хлоро-3-(1,3,4-оксазазолин-2-он-5-ил)-4-метилсулфонилбензоат (съединение 4.22)

Етап а) метилов 3-аминокарбонил-2-хлоро-4-метилсулфонилбензоат

В разтвор от 15,0 g (48 mmol) 2-хлоро-3-хлорокарбонил-4-метилсулфонилбензоена киселина и 300 ml сух диоксан се прибавя в продължение на 2 h амоняк. Образувалата се утайка се филтрира на Нуч филтър и филтратът се концентрира. Получават се 15,2 g метилов 3-аминокарбонил-2-хлоро-4-метилсулфонилбензоат в количествен добив.

Етап b) Метилов 2-хлоро-3-(1,3,4-оксатиазолин-2-он-5-ил)-4-метилсулфонилбензоат

Към разтвор от 4,37 g (15 mmol) метилов 3-аминокарбонил-2-хлоро-4-метилсулфонилбензоат в 150 ml сух толуен се прибавят на капки 9,80 g (75 mmol) хлорокарбонилсулфенилхлорид. След 48 h разбъркване под обратен хладник, разтворителят се отстранява под вакуум и остатъкът се хроматографира върху кизелгел (елуент:

етилацетат/циклохексан = 1/1). Получават се 3,70 g (70% от теор.) метилов 2-хлоро-3-(1,3,4-оксатиазолин-2-он-5-ил)-4-метилсулфонилбензоат.

Метилов 2-хлоро-4-метилсулфонил-3-(4,5-дихидрооксазол-2-ил)бензоат (съединение 4.41)

Към 26,6 g (0,13 mol) 1-амино-2-брометан-хидробромид в 500 ml толуен се прибавят на капки, при стайна температура, 41,8 g (0,41 mol) триетиламин и след това 31,1 g (0,10 mol) метилов 2-хлоро-3-хлорокарбонил-4-метилсулфонилбензоат в 150 ml толуен. След 5 h нагряване под обратен хладник и 12 h разбъркване при стайна температура се прибавят отново 5,0 g (0,02 mol) 1-амино-2-брометан-хидробромид и се нагрява 7,5 h под обратен хладник. След охлаждане реакционната смес се разрежда с етилацетат, промива се с вода, суши се и се концентрира. След това остатъкът се прекристализира из метил-трет-бутилтер/етилацетат. Получават се 14,5 (46% от теор.) метилов 2-хлоро-4-метилсулфонил-3-(4,5-дихидрооксазол-2-ил)бензоат.

2-хлоро-3-(5-метокси-5-метил-4,5-дихидроизоксазол-3-ил)-4-метилсулфонилбензоена киселина (съединение 4.60)

Етап a) метилов 2-хлоро-3-(5-метокси-5-метил-4,5-дихидроизоксазол-3-ил)-4-метилсулфонилбензоат

Към 10,0 g (34 mmol) метилов 2-хлоро-3-(хидроксиминометил)-4-метилсулфонилбензоат в 200 ml метиленхлорид се прибавят едно след друго 7,3 g (102 mmol) 2-метокси-1-пропей, 28 ml разтвор на натриев хипохлорит

(12,5 %-ен) и на върха на шпатулата натриев ацетат. След 12 h разбъркване при стайна температура разтворителят се отстранява, остатъкът се разтваря в етилацетат, промива се с вода суши се и се концентрира. Остатъкът се хроматографира върху кизелгел (елуент: циклохексан:етилацетат = 3:2). Получават се 5,8 g (47% от теор.) метилов 2-хлоро-3-(5-метокси-5-метил-4,5-дихидро-изоксазол-3-ил)-4-метилсулфонилбензоат (Т.т.: 100-105°C).

Етап b) 2-хлоро-3-(5-метокси-5-метил-4,5-дихидроизоксазол-3-ил)-4-метилсулфонилбензоена киселина

Към 5,0 g (37,5 mmol) литиев йодид в 200 ml пиридин се прибавят на капки, при температура на кипене под обратен хладник, 5,5 g (15,0 mmol) метилов 2-хлоро-3-(5-метокси-5-метил-4,5-дихидроизоксазол-3-ил)-4-метилсулфонилбензоат в 100 ml пиридин. След 4 h разбъркване при тази температура, сместа се охлажда, разтворителят се отдестилира, остатъкът се разтваря в толуен и отново се концентрира. След това се смесва с вода, промива се с метиленхлорид и се довежда до рН-стойност 1 със солна киселина. След екстракция на водната фаза с метиленхлорид, получената органична фаза се суши и се концентрира. Получават се 4,7 g (90% от теор.) 2-хлоро-(5-метокси-5-метил-4,5-дихидроизоксазол-3-ил)-4-метилсулфонил-бензоена киселина. (Т.т.: 40-45°C).

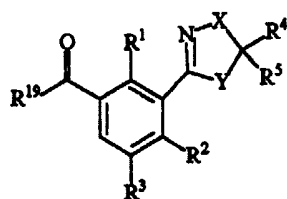
Метилов 2-хлоро-3-(2-метил-2Н-1,3,4-диоксазол-5-ил)-4-метилсулфонилбензоат (съединение 4.44)

Към 8,0 g (27,4 mmol) метилов 2-хлоро-3-(хидроксиминометил)-4-метилсулфонилбензоат в 150 ml метиленхлорид се прибавят на капки 16,0 g (27,4 mmol) 12,5 %-ен разтвор на натриев хипохлорит и се прибавя натриев ацетат на върха на шпатулата. След 1 h, в рамките на 36 h се прибавят на части 34,4 g (0,74 mol) ацеталдехид и се нагрява бавно до около 55°C. След това се разбърква 48 h при стайна температура, промива се с вода, суши се и се концентрира. След това остатъкът се разтваря в метиленхлорид, прибавят се 10,0 g (0,23 mol) ацеталдехид и на върха на шпатулата натриев ацетат и се нагрява 8 h под обратен хладник. След 72 h се прибавят още веднъж 10,0 g (0,23 mol) ацеталдехид и се разбърква при стайна температура. След това се промива с вода, суши се и се концентрира. Остатъкът се хроматографира върху кизелгел

(елуент: изопропанол:

циклохексан=1:9). Получават се 5,0 g (55 % от теор.) метилов 2-хлоро-3-(2-метил-2Н-1,3,4-диоксазол-5-ил)-4-метилсулфонил-бензоат.

ТАБЛИЦА 4



(III)

№	R ¹	R ²	R ³	X	R ⁴	R ⁵	Y	R ¹⁹	Физични данни Т.т.(°С) ¹ H-NMR [δ ppm]
4.1	Cl	Cl	H	O	H	H	CH ₂	OCH ₃	3,29(t); 3,91(s); 4,58(t); 7,46(d); 7,83(d).
4.2	Cl	Cl	H	O	H	H	CH ₂	OH	3,28(t); 4,60(t); 7,02(brs); 7,46(d); 7,98(d).
4.3	Cl	SO ₂ CH ₃	H	O	H	H	CH ₂	OCH ₃	3,24(s); 3,42(t); 3,99(s); 4,60(t); 7,96(d); 8,10(d).
4.4	Cl	SO ₂ CH ₃	H	O	H	H	CH ₂	OH	3,26(s); 3,45(t); 4,63(t); 8,15(s); 8,53(s,br).
4.5	Cl	SO ₂ CH ₃	H	O	H	H	CH ₂	Cl	3,25(s); 3,46(t); 4,62(t); 8,21(dd).

№	R ¹	R ²	R ³	X	R ⁴	R ⁵	Y	R ¹⁹	Физични данни Т.т.(°C) ¹ H-NMR [δ ppm]
4.6	Cl	Cl	H	C(CH ₂) ₂	H	H	O	OH	1,31(s); 4,16(s); 7,69(d); 7,90(d); 13,8(s,br).
4.7	Cl	SO ₂ C ₂ H ₅	H	O	CH ₃	CH ₃	CH ₂	OCH ₃	1,25(t); 1,57(s); 3,21(s); 3,42(q); 3,99(s); 7,94(d); 8,07(d).
4.8	Cl	SO ₂ C ₂ H ₅	H	O	CH ₃	CH ₃	CH ₂	OH	1,13(t); 1,47(s); 3,15(s); 3,43(q); 8,06(s); 13,8(s,br).
4.9	Cl	SO ₂ C ₂ H ₅	H	O	H	H	CH ₂	OCH ₃	1,28(t); 3,41(m); 4,02(s); 4,62(t); 7,95(d); 8,06(d).
4.10	Cl	SO ₂ C ₂ H ₅	H	O	H	H	CH ₂	OH	137-140
4.11	Cl	SO ₂ C ₂ H ₅	H	O	CH ₃	H	CH ₂	OCH ₃	1,26(t); 1,53(d); 3,06(dd); 3,42(q); 3,49(dd); 5,05(m); 7,95(d); 8,07(d).
4.12	Cl	SO ₂ C ₂ H ₅	H	O	CH ₃	H	CH ₂	OH	140-143
4.13	Cl	SO ₂ CH ₃	H	CH ₂	H	H	O	OCH ₃	3,30(s); 3,98(s); 4,11(t); 4,55(t); 7,97(d); 8,08(d).
4.14	Cl	SO ₂ CH ₃	H	CH ₂	H	H	O	OH	3,38(s); 4,00(t); 4,46(t); 8,08(s).

№	R ¹	R ²	R ³	X	R ⁴	R ⁵	Y	R ¹⁹	Физични данни Т.г.(°C) ¹ H-NMR [δ ppm]
4.15	Cl	SO ₂ CH ₃	H	O	H	H	CH ₂	OH	3,30(s); 3,35(t); 4,15(s,br); 4,50(t); 8,05(s).
4.16	Cl	SO ₂ H-C ₃ H ₇	H	O	CH ₃	CH ₃	CH ₂	OCH ₃	0,95(t); 1,47(s); 1,58(q); 3,12(s); 3,31(s); 3,43(t); 3,93(s); 8,09(dd).
4.17	Cl	SO ₂ H-C ₃ H ₇	H	O	CH ₃	CH ₃	CH ₂	OH	0,93(t); 1,47(s); 1,58(q); 3,15(s); 3,42(t); 8,05(s).
4.18	Cl	SO ₂ H-C ₃ H ₇	H	O	H	H	CH ₂	OCH ₃	0,92(t); 1,55(q); 3,39(m); 3,93(s); 4,50(t); 8,08(dd).
4.19	Cl	SO ₂ H-C ₃ H ₇	H	O	H	H	CH ₂	OH	148-150
4.20	Cl	SO ₂ H-C ₃ H ₇	H	O	CH ₃	H	CH ₂	OCH ₃	0,93(t); 1,49(d); 1,58(q); 2,94(dd); 3,42(m); 3,93(s); 4,97(m); 8,10(dd).
4.21	Cl	SO ₂ H-C ₃ H ₇	H	O	CH ₃	H	CH ₂	OH	0,94(t); 1,39(d); 1,58(q); 2,96(dd); 3,50(m); 4,95(m); 8,05(s).
4.22	Cl	SO ₂ CH ₃	H	S	=O		O	OCH ₃	3,24(s); 4,02(s); 8,14(dd).
4.23	Cl	SO ₂ CH ₃	H	O	COOC ₂ H ₅	H	CH ₂	OCH ₃	118-121

№	R ¹	R ²	R ³	X	R ⁴	R ⁵	Y	R ¹⁹	ФИЗИЧНИ ДАНИИ Т.Т.(°C) ¹ H-NMR [δ ppm]
4.24	Cl	SO ₂ CH ₃	H	O	COOC ₂ H ₅	H	CH ₂	OH	
4.25	Cl	SO ₂ CH ₃	H	O	CH ₃	H	CH ₂	OCH ₃	130-135
4.26	Cl	SO ₂ CH ₃	H	O	CH ₃	H	CH ₂	OH	173-178
4.27	Cl	SO ₂ CH ₃	H	O	CH ₃	CH ₃	CH ₂	OCH ₃	1,57(s); 3,18(s); 3,27(s); 4,01(s); 7,97(d); 8,12(d).
4.28	Cl	SO ₂ CH ₃	H	O	CH ₃	CH ₃	CH ₂	OH	1,48(s); 3,15(s); 3,34(s); 8,08(dd).
4.29	Cl	SO ₂ CH ₃	H	O	C ₂ H ₅	H	CH ₂	OCH ₃	0,97(t); 1,72(m); 3,10(dd); 3,32(s); 3,37(dd); 4,72(m); 8,08(dd).
4.30	Cl	SO ₂ CH ₃	H	O	H	-(CH ₂) ₃ CH-		OCH ₃	1,57(m); 1,81(m); 2,21(m); 3,20(s); 4,02(s); 4,32(t); 5,35(dd); 7,92(d); 8,18(d).

№	R ¹	R ²	R ³	X	R ⁴	R ⁵	Y	R ¹⁹	Физични данни Т.т.(°C) ¹ H-NMR [δ ppm]
4.31	Cl	SO ₂ CH ₃	H	O	H	-(CH ₂) ₃ CH-		OH	1,72(m); 2,01(m); 3,27(s); 4,24(t); 5,23(dd); 8,05(d); 8,15(d); 13,8(s,br).
4.32	Cl	SO ₂ CH ₃	H	O	-(CH ₂) ₂ O(CH ₂) ₂ -	CH ₂		OCH ₃	2,00(m); 3,23(s); 3,27(s); 3,72(m); 4,00(s); 7,96(d); 8,04(d).
4.33	Cl	SO ₂ CH ₃	H	O	-(CH ₂) ₂ O(CH ₂) ₂ -	CH ₂		OH	78-83
4.34	Cl	SO ₂ CH ₃	H	O	-(CH ₂) ₄ -	CH ₂		OCH ₃	1,78(m); 2,24(m); 3,27,s); 3,36(s); 3,98(s); 7,94(d); 8,12(d).
4.35	Cl	SO ₂ CH ₃	H	O	-(CH ₂) ₄ -	CH ₂		OH	1,76(m); 2,05(m); 3,30(s); 3,33(s); 8,09(dd).
4.36	Cl	SO ₂ CH ₃	H	O	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	CH ₂	OCH ₃	1,00(t); 1,85(m); 3,13(s); 3,27(s); 3,98(s); 7,94(d); 8,11(d).
4.37	Cl	SO ₂ CH ₃	H	O	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	CH ₂	OH	0,91(t); 1,76(m); 3,12(s); 3,33(s); 8,07(dd); 13,75(s,br).
4.38	Cl	SO ₂ CH ₃	H	C(CH ₃) ₂	H	H	CH ₂	OH	1,34(s); 3,40(s); 4,13(s); 8,07(s); 13,95(s,br).

№	R ¹	R ²	R ³	X	R ⁴	R ⁵	Y	R ¹⁹	Физични данни Т.т.(°C) ¹ H-NMR [δ ppm]
4.39	Cl	SO ₂ CH ₃	H	O	CH ₃	H	CH ₂	Cl	
4.40	Cl	SO ₂ CH ₃	H	CH ₂	H	H	O	OH	> 260
4.41	Cl	SO ₂ CH ₃	H	CH ₂	H	H	O	OCH ₃	3,29(3H); 3,96(3H); 4,12(2H); 4,55(2H); 7,98(1H); 8,09(1H).
4.42	Cl	SCH ₃	H	O	H	H	CH ₂	OCH ₃	202-203
4.43	Cl	SO ₂ CH ₂	H	O	COOMe	H	CHCO ₂ CH ₃	OCH ₃	1,05(3H); 1,35(3H); 3,19(3H); 4,01(3H); 4,09(2H); 4,35(2H); 5,06(1H); 5,77(1H); 8,08(1H); 8,17(1H).
4.44	Cl	SO ₂ CH ₂	H	O	CH ₃	H	O	OCH ₃	1,78(3H); 3,30(3H); 3,98(3H); 6,40(1H); 8,08(1H); 8,15(1H).
4.45	Cl	SO ₂ CH ₂	H	O	CHO	H	CHCH ₃	OCH ₃	80-85
4.46	Cl	SO ₂ CH ₃	H	O	CH ₃	H	CHCH ₂ Cl	OH	1,65(3H); 3,27(3H); 3,50(2H); 4,00(3H); 4,22(1H); 4,88/5,08(1H); 7,99(1H); 8,12(1H).

№	R ¹	R ²	R ³	X	R ⁴	R ⁵	Y	R ¹⁹	Физични данни Т.т.(°C) ¹ H-NMR [δ ppm]
4.47	Cl	SO ₂ CH ₃	H	O	CH ₃	H	CHCH ₂ Cl	OH	100-105
4.48	Cl	SO ₂ CH ₃	H	O	CHO	H	CHCH ₃	OH	180-185
4.49	Cl	SO ₂ CH ₃	H	O	SC ₂ H ₅	H	CH ₂	OCH ₃	1,30(3H); 2,75(2H); 3,25(1H); 3,34(3H); 3,78(1H); 3,94(3H); 6,22(1H); 8,15(2H).
4.50	Cl	SO ₂ CH ₃	H	O	SC ₂ H ₅	H	CH ₂	OH	65-67
4.51	Cl	SO ₂ CH ₃	H	O	CH ₃	H	CHCH ₃	OCH ₃	1,01(3H); 1,28(3H); 3,33(4H); 3,96(3H); 4,98(1H); 8,12(1H); 8,20(1H).
4.52	Cl	SO ₂ CH ₃	H	O	CH ₃	H	CHCH ₃	OH	68-75
4.53	Cl	SO ₂ CH ₃	H	O	OCOCH ₃	H	CH ₂	OCH ₃	105-110
4.54	Cl	SO ₂ CH ₃	H	O	H	H	CH ₂	OH	

№	R ¹	R ²	R ³	X	R ⁴	R ⁵	Y	R ¹⁹	Физични данни Т.т.(°C)	
									¹ H-NMR [δ ppm]	
4.55	Cl	SO ₂ CH ₃	H	O	OCOCH ₃	H	CH ₂	OH		45-50
4.56	Cl	SO ₂ CH ₃	H	O	OCH ₃	H	CH ₂	OH		60-65
4.57	Cl	SO ₂ CH ₃	H	O	CHCl(CH ₃)	H	CH ₂	OCH ₃		1,63(3H); 3,23(3H); 3,50(2H); 3,99(3H); 4,25(1H); 4,83/5,03(1H); 7,96(1H); 8,13(1H).
4.58	Cl	SO ₂ CH ₃	H	O	CHCl(CH ₃)	H	CH ₂	OH		1,56(3H); 3,33(3H); 3,43(2H); 4,36(1H); 4,93(1H); 8,10(2H).
4.59	Cl	SO ₂ CH ₃	H	O	CH ₃	OCH ₃	CH ₂	OCH ₃		100-105
4.60	Cl	SO ₂ CH ₃	H	O	CH ₃	OCH ₃	CH ₂	OH		40-45
4.61	Cl	SO ₂ CH ₃	H	O	CF ₃	OCOCH ₃	CH ₂	OCH ₃		60-65
4.62	Cl	SCH ₃	H	O	H	H	CH ₂	OH		
4.63	Cl	SO ₂ CH ₃	H	O	COCH ₃	H	CH ₂	OCH ₃		2,36(3H); 3,25(3H); 3,66(2H); 4,01(3H); 5,20(1H); 8,01(1H); 8,12(1H).
4.64	Cl	SO ₂ CH ₃	H	O	CF ₃	H	CH ₂	OCH ₃		156
4.65	Cl	SO ₂ CH ₃	H	O	CF ₃	H	CH ₂	OH		170

№	R ¹	R ²	R ³	X	R ⁴	R ⁵	Y	R ¹⁹	Физични данни Т.т.(°С) ¹ H-NMR [δ ppm]
4.66	Cl	SO ₂ CH ₃	H	O	F	F	CH ₂	OCH ₃	
4.67	Cl	SO ₂ CH ₃	H	O	F	F	CH ₂	OH	
4.68	Cl	SO ₂ CH ₃	H	O	F	H	CH ₂	OCH ₃	142-143
4.69	Cl	SO ₂ CH ₃	H	O	F	H	CH ₂	OH	
4.70	Cl	SO ₂ CH ₃	H	O	CH ₂ Cl	H	CH ₂	OCH ₃	107-110
4.71	Cl	SO ₂ CH ₃	H	O	CH ₂ Cl	H	CH ₂	OH	60-65
4.72	Cl	SO ₂ CH ₃	H	O	OCH ₃	H	CH ₂	OCH ₃	105-110
4.73	Cl	SO ₂ CH ₃	H	O	OC ₂ H ₅	H	CH ₂	OCH ₃	155-160
4.74	Cl	SO ₂ CH ₃	H	CH ₂	H	H	S	OCH ₃	
4.75	CH ₃	H	H	C=O	H	H	S	OCH ₃	112-120
4.76	Cl	SO ₂ CH ₃	H	O	CF ₃	OH	CH ₂	OH	3,38(s); 3,56(d); 3,79(d); 8,16(s); 8,67(s,br).
4.77	Cl	SO ₂ CH ₃	H	O	O-третC ₄ H ₉	H	CH ₂	OCH ₃	130-135
4.78	Cl	SO ₂ CH ₃	H	O	O-третC ₄ H ₉	H	CH ₂	OH	1,25(s); 3,05(dd); 3,34(s); 3,45(dd); 6,17(m); 8,08(s).

№	R ¹	R ²	R ³	X	R ⁴	R ⁵	Y	R ¹⁹	Физични данни Т.т.(°C) ¹ H-NMR [δ ppm]
4.79	Cl	SO ₂ CH ₃	H	O	CH ₃	H	CHCH ₃	OCH ₃	1,01(d); 1,28(d); 3,35(m); 3,96(s); 4,99(m); 8,12(d); 8,20(d).
4.80	Cl	SO ₂ CH ₃	H	O	CH ₃	H	CHCH ₃	OH	68-75
4.81	Cl	SO ₂ CH ₃	H	O	SC ₂ H ₅	H	CH ₂	OCH ₃	1,30(t); 2,77(q); 3,25(dd); 3,34(s); 3,78(dd); 3,94(s); 6,22(m); 8,24(s).
4.82	Cl	SO ₂ CH ₃	H	O	SC ₂ H ₅	H	CH ₂	OH	65-67
4.83	SCH ₃	SCH ₃	H	O	H	H	CH ₂	OCH ₂ CH ₃	1,28(t); 2,30(s); 2,46(s); 3,28(t); 4,31(q); 4,45(t); 7,42(d); 7,68(d).
4.84	SCH ₃	SCH ₃	H	O	H	H	CH ₂	OH	2,32(s); 2,48(s); 3,28(t); 4,42(t); 7,48(d); 7,64(d); 13,2(s).
4.85	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃	H	O	H	H	CH ₂	OH	3,25(s); 3,35(s); 3,44(t); 8,05(d); 8,45(d).

В следващата таблица 4 са представени освен гореописаните съединения и други производни на бензоената киселина със формула (III), които са получени или могат да се получат по аналогичен начин.

3-хетероциклизаместените безоилови производни с формула (I) и техните приемливи в земеделието соли са подходящи за хербициди както като смес от изомери, така и под формата на чисти изомери. Хербицидните средства съдържащи съединенията с формула (I), преодоляват много добре растеж на растения върху некултивирани площи, особено при високи количества на приложение. При култури като пшеница, ориз, царевица, соя и памук те действат на бурени и плевели, без да увреждат забележимо културните растения. Този ефект настъпва преди всичко при ниски разходни количества.

В зависимост от съответните методи на приложение. съединенията с формула (I), съответно съдържащите ги хербицидни средства могат да се използват още за допълнителен брой културни растения за отстраняване на нежелани растения. Имат се предвид следните култури:

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

Освен това, съединенията с формула (I) могат да се прилагат при култури, които чрез селекция, включително генно инженерни мето-

ди, са устойчиви на действието на хербициди.

Съединенията с формула (I), съответно съдържащите ги хербицидни средства могат да се прилагат например под формата на директно разпръсквани водни разтвори, прахове, суспензии, също високопроцентни водни, маслени или подобни суспензии или дисперсии, емулсии, маслени дисперсии, пасти, средства за опрашаване, средства за поръсване или гранулати, чрез разпръскване, опушване, разпращаване, посипване или заливане. Формите на приложение се приготвят според целите на приложение. Те трябва да осигуряват във всеки случай по възможност най-fino разпределение на активното вещество съгласно изобретението.

Хербицидните средства съдържат хербицидно активно количество най-малко от едно съединение с формула (I) или приемлива в земеделието сол на (I) и обичайните за приготвяне на готови форми от защитни средства за растенията помощни средства.

Като инертни помощни вещества се имат предвид по същество: фракции от земно масло със средна до висока точка на кипене, както и масла от растителен или животински произход, алифатни, пръстенни и ароматни въглеводороди напр. парафини, тетрахидронафталин, алкилирани нафталини и техни производни, алкилирани бензени и техни производни, алкохоли като метанол, етанол, пропанол, бутанол и циклохексанол, кетони като циклохексанон, силно полярни разтворители напр. амини като N-метилпирилодон и вода.

Водни форми на приложение могат да се приготвят от емулсионни концентрати, суспензии, пасти, омокрящи се прахове или водно-диспергиращи се гранулати чрез прибавяне на вода. За приготвяне на емулсии, пасти или маслени дисперсии, субстратите могат да се разтварят като такива или в масло или разтворител и посредством омокрящи, закрепващи, диспергиращи или емулгиращи средства да се хомогенизират във вода. Те могат обаче да се приготвят също като концентрати, състоящи се от активно вещество, омокрящо, закрепващо, диспергиращо или емулгиращо средство и в даден случай разтворител или масло, които са подходящи за разреждане с вода.

Като повърхностно активни вещества (адюванти) се имат пред вид алкални, алкалоземни, амониеви соли на ароматни сулфоновни киселини напр. лигнин-, фенол-, нафталин- и

дибутилнафталинсулфоновни киселини, както и мастни киселинини, алкил- и алкиларилсулфонати, алкил-, лаурилетер- и мастноалкохолни сулфати както и соли на сулфатирани хекса-, хепта- и октадеканоли. както и мастни алкохолгликолови етери, кондензационни продукти на сулфониран нафталин и негови производни с формалдехид, кондензационни продукти на нафталини, съотв. нафталинсулфоновни киселини с фенол и формалдехид, полиоксиетиленоктилфенолетери, етоксилуван изооктил-, октил- или нонилфенол, алкилфенил-, трибутилфенил- полигликолетер, алкиларилполиетералкохоли, изотридецилалкохол, кондензати на мастен алкохол с етиленов оксид, етоксилувано рициново масло, полиоксиетилен- или полиоксипропиленалкилетер, лауриалкохолполигликол-етерацетат, сорбитестер, лигнинсулфитни екстракти или метилцелулоза.

Прахове, средства за посипване и разпрашаване могат да се приготвят чрез смилане заедно на активното вещество с твърд носител.

Гранулати напр. обвити, импрегнирани и хомогенни гранулати могат да се приготвят чрез свързване на активното вещество с твърдия носител. Твърди носители са минерали като силициеви киселини, кизелгели, силикати, талк, каолин, варовик, вар, креда, глина, льос, бяла глина, доломит, инфузорна пръст, калциев и магнезиев сулфат, магнезиев оксид, смляни пластмаси, торове като амониев сулфат, амониев фосфат, амониев нитрат, карбамид и растителни продукти като брашно от зърнени растения, кори от дървета, дървесина и брашно от орехови черупки, целулозен прах или други твърди носители.

Концентрациите на съединенията с формула (I) в готовите за приложение препарати могат да варират в широк обхват. Най-общо, готовите форми съдържат около от 0,001 до 98 тегловни %, за предпочитане от 0,01 до 95 тегловни % от най-малко едно активно вещество. При това активните вещества се прибавят с чистота от 90 % до 100 % за предпочитане 95 % до 100 % (съгласно NMR-спектъра).

Следващите примери за приготвяне на готови форми поясняват приготвянето на такива препарати:

I. 20 тегловни части от съединение № 3.2 се разтварят в смес, която се състои от 80 тегловни части алкилиран бензен, 10 тегловни части съхраняван продукт от 8 до 10 mol ети-

леноксид на 1 mol маслена киселина-N-моное-таноламид, 5 тегловни части калциева сол на додецилбензолсулфонова киселина и 5 тегловни части съхраняван продукт от 40 mol етиленоксид на 1 mol рициново масло. Чрез изливане и фино разпределяне на разтвора в 100 000 тегловни части вода се получава водна дисперсия, която съдържа 0,02 тегловни части от активното вещество.

II. 20 тегловни части от съединение № 3.9 се разтварят в смес, която се състои от 40 тегловни части циклохексанон, 30 тегловни части изобутанол, 20 тегловни части съхраняван продукт от 7 mol етиленоксид на 1 mol изооктилфенол и 10 тегловни части съхраняван продукт от 40 mol етиленоксид на 1 mol рициново масло. Чрез изливане и фино разпределяне на разтвора в 100 000 тегловни части вода се получава водна дисперсия, която съдържа 0,02 тегловни % от активното вещество.

III. 20 тегловни части от активното вещество № 3.10 се разтварят в смес, която се състои от 25 тегловни части циклохексанон, 65 тегловни части фракция от земно масло с температура на кипене от 210 до 280°C и 10 тегловни части съхраняван продукт от 40 mol етиленоксид на 1 mol рициново масло. Чрез прибавяне и фино разпределяне на разтвора в 100 000 тегловни части вода се получава водна дисперсия, която съдържа 0,02 тегловни % от активното вещество.

IV. 20 тегловни части от активното вещество № 3.16 се смесват добре с 3 тегловни части натриева сол на диизобутилнафталинсулфонова киселина, 17 тегловни части натриева сол на лигнисулфонова киселина от сулфитна луга и 60 тегловни части прахообразен гел от силициева киселина и се смилат в чукова мелница. Чрез фино разпределяне на сместа в 20 000 тегловни части вода се получава суспензия за разпръскване, която съдържа 0,1 тегловни части от активното вещество.

V. 3 тегловни части от активното вещество № 3.21 се смесват с 97 тегловни части каолин с фини частици. По този начин се получава средство за напръшване, което съдържа 3 тегловни части от активното вещество.

VI. 20 тегловни части от активното вещество № 3.22 се смесват интимно с 2 тегловни части калциева сол на додецилбензолсулфонова киселина, 8 тегловни части мастноалкохол полигликолетер, 2 тегловни части

натриева сол на кондензат от фенол-карбамид-формалдехид и 68 тегловни части парафиново минерално масло. Получава се стабилна маслена дисперсия.

VII. 1 тегловна част от активното вещество № 3.34 се разтваря в смес, която се състои от 70 тегловни части циклохексанон, 20 тегловни части етоксилиран изооктилфенол и 10 тегловни части етоксилирано рициново масло. Получава се стабилен емулсионен концентрат.

VIII. 1 тегловна част от активното вещество № 3.35 се разтваря в смес, която се състои от 80 тегловни части циклохексанон и 20 тегловни части Wettol[®] EM 31 (= нейонен емулгатор на база етоксилирано рициново масло). Получава се стабилен емулсионен концентрат.

Прилагането на съединенията с формула (I), съответно на хербицидното средство може да се осъществи по метода преди или след поникването. Ако активните вещества са по-малко поносими за определени културни растения, те могат да се приложат техники на изпълнение, при които хербицидното средство се разпръсква с помощта на уред за разпръскване, така че листата на чувствителните културни растения по възможност да не се засегнат, докато активното вещество достига до листата на растящите отдолу нежелани растения или непокрита повърхности от почвата (post-directed, lay-by).

Разходните количества от съединение с формула (I) са в зависимост целта, сезона, целевото растение и стадия на растеж от 0,001 до 3,0, за предпочитане 0,01 до 1,0 kg/ha активно вещество. (a.S.).

За разширяване на спектъра на действие и за постигане на синергични ефекти 3-хетероциклзаместените безоилови производни с формула (I) могат да се смесват и прилагат заедно с многобройни представители на други хербицидни или регулиращи растежа групи активни вещества. Например имат се предвид като партньори за смесване 1,2,4-тиадиазоли, 1,3,4-тиадиазоли, амиди, аминоксифосфорни киселини и техни производни, аминотриазоли, анилиди, арилокси-/хетероарилоксиалканови киселини и техни производни, бензоени киселини и техни производни, бензотиадиазинони, 2-(хетарил/арил)-1,3-циклохександиони, хетероарил-арил-кетони, бензилизоксазолидинони, метил-CF₃-фенилни производни, карбамати, хинолинкарбоксилни киселини и техни производни,

хлорацетанилиди, циклохексеноноксиметерни производни, диазини, дихлоропропионови киселини и техни производни, дихидробензофурани, дихидрофуран-3-они, динитроанилини, динитрофеноли, дифенилетери, дипиридили, халогенкарбоксилни киселини и техни производни, карбамиди, 3-фенилурацили, имидазоли, имидазолинони, N-фенил-3,4,5,6-тетрахидрофталимиди, оксадиазоли, оксирани, феноли, естери на арилокси- и хетероарилоксифеноксипропионовата киселина, фенилоцетна киселина и нейни производни, 2-фенилпропионови киселини и техни производни, пиразоли, фенилпиразоли, пиридазини, пиридинкарбоксилни киселини и техни производни, пиримидилетери, сулфонамиди, сулфонилкарбамиди, триазини, триазинони, триазолинони, триазолкарбоксамиди и урацили.

Освен това може да бъде от полза съединенията с

формула (I) да се използват самостоятелно или в комбинация с други хербициди, смесени също с други средства за растителна защита например със средства за борба с вредители или фитопатогенни гъби, съответно бактерии. От интерес е още смесваемостта с разтвори на минерални соли, които могат да се използват за отстраняване на недостига на хранене и микроелементи. Могат също да се прибавят нефитотоксични масла и маслени концентрати.

Примери за приложение

Хербицидното действие на 3-хетероциклзаместени безоилови производни с формула (I) може да се покаже чрез следните оранжерийни опити.

Като съдове за култивиране служат пластмасови саксии за цветя с глинен пясък с около 3,0 % хумус като субстрат. Семената на изпитваните растения се засяват отделно по видове.

При третиране преди поникването суспендираните или емулгирани във вода активни вещества се нанасят направо след засяването посредством фино разпределящи дюзи. Съдовете се оросяват леко, за да се стимулира поникването и растежът и след това се покриват с прозрачни пластмасови качулки, докато пораснат растенията. Това покриване причинява равномерно поникване на изпитваните растения, доколкото те не са увредени от активните вещества.

За целта на третирането, след поникване опитните растения се отглеждат според формата на растеж първо до височина от 3 до 15 cm и едва тогава се обработват със суспенди-

раните или емулгирани във вода активни вещества. Затова изпитваните растения или директно се посяват и се отглеждат в същите съдове, или се отглеждат като разсад отделно, и няколко дни преди третирането се пресаждат в съдовете за опитите. Разходните количества за третирането след поникване са 31,2 съотв. 15,6 g/ha активно вещество (а.в.).

Растенията се съхраняват специфично за вида при температури от 10 до 25°C, съотв. 20 до 35°C. Периодът на опитите продължава от 2 до 4 седмици. През това време се наблюдават растенията и се оценява тяхната реакция на отделните третираня.

Оценката се прави по скала от 0 до 100. При това 100 означава никакво преживяване на растенията, съотв. пълно разрушаване на най-малко надземните части и 0 никакво увреждане или нормално протичане на развитието.

Приложенията в оранжерийните опити растения са от следните видове:

Chenopodium album

Setaria faberii

Sinapis alba

Solanum nigrum

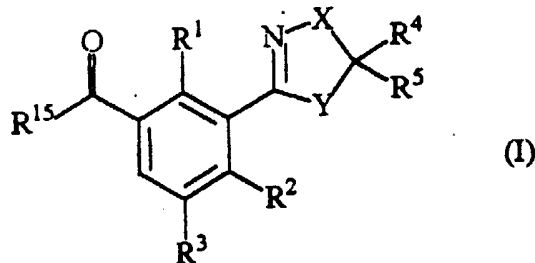
Triticum aestivum

Zea mays

При разходни количества 31,2, съотв. 15,6 h/ha съединението 3.33 (таблица 3) показва след поникване твърде добро действие срещу гореизброените едно- и двуседелни вредни растения и добра поносимост при зимна пшеница и царевица.

Патентни претенции

1. 3-Хетероциклизаместени бензоилови производни с формула



в която заместителите имат следните значения:

R^1, R^2 са водород, нитро, халоген, циано, C_1-C_6 алкил, C_1-C_6 халогеналкил, C_1-C_6 ал-

кокси, C_1-C_6 халогеналкокси, C_1-C_6 алкилтио, C_1-C_6 халогеналкилтио, C_1-C_6 алкилсулфинил, C_1-C_6 халогеналкилсулфинил, C_1-C_6 алкилсулфонил или C_1-C_6 халогеналкилсулфонил;

5 R^3 е водород, халоген или C_1-C_6 алкил;

R^4, R^5 са водород, халоген, циано, нитро, C_1-C_4 алкил, C_1-C_4 алкокси- C_1-C_4 алкил, ди- $(C_1-C_4$ алкокси)- C_1-C_4 алкил, ди- $(C_1-C_4$ алкил)амино- C_1-C_4 алкил, [2,2-ди- $(C_1-C_4$ алкил)хидразино-1]- C_1-C_4 алкил, C_1-C_4 алкилиминоокси- C_1-C_4 алкил), C_1-C_4 алкоксикарбонил- C_1-C_4 алкил, C_1-C_4 алкилтио- C_1-C_4 алкил, C_1-C_4 халогеналкил, C_1-C_4 цианоалкил, C_3-C_6 циклоалкил, C_1-C_4 алкокси, C_1-C_4 алкокси- C_2-C_4 ал-

15 кокси, C_1-C_4 халогеналкокси, хидрокси, C_1-C_4 алкилкарбонилокси, C_1-C_4 алкилтио, C_1-C_4 халогеналкилтио, ди- $(C_1-C_4$ алкил)амино, $CO R^6$, фенил или бензил, при което двата последно споменати заместителя могат да бъдат частично или напълно халогенирани и/или могат да носят една или повече от следните групи: нитро, циано, C_1-C_4 алкил, C_1-C_4 халогеналкил, C_1-C_4 алкокси или C_1-C_4 халогеналкокси; или

25 R^4 и R^5 заедно образуват C_2-C_6 алкандиолова верига, която може да бъде заместена еднократно до четирикратно с C_1-C_4 алкил и/или може да бъде прекъсната от кислород или азот в даден случай заместен с C_1-C_4 алкил; или

R^4 и R^5 образуват заедно с прилежащия им въглерод карбонилна или тиокарбонилна група;

30 R^6 е водород, C_1-C_4 алкил, C_1-C_4 халогеналкил, C_1-C_4 алкокси, C_1-C_4 алкокси- C_2-C_4 алкокси, C_1-C_4 халогеналкокси, C_3-C_6 алкенилокси, C_3-C_6 алкинилокси или NR^7R^8 ;

35 R^7 е водород или C_1-C_4 алкил;

R^8 е C_1-C_4 алкил;

X е O, S, NR^9 , CO или $CR^{10}R^{11}$;

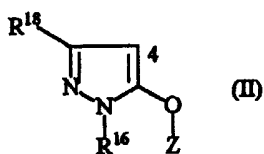
Y е O, S, NR^{12} , CO или $CR^{13}R^{14}$;

R^9, R^{12} са водород или C_1-C_4 алкил;

40 $R^{10}, R^{11}, R^{13}, R^{14}$ са водород, C_1-C_4 алкил, C_1-C_4 халогеналкил, C_1-C_4 алкоксикарбонил, C_1-C_4 халогеналкоксикарбонил или $CONR^7R^8$; или

45 R^4 и R^9 , или R^4 и R^{10} , или R^5 и R^{12} , или R^5 и R^{13} образуват заедно C_2-C_6 алкандиолова верига, която може да бъде едно- до четирикратно заместена с C_1-C_4 алкил и/или може да бъде прекъсната от кислород или в даден случай азот, заместен с C_1-C_4 алкил;

50 R^{15} означава свързан на 4 място пирозол с формула (II)



в която

R^{16} е C_1-C_6 алкил;

Z е H или SO_2R^{17} ;

R^7 е C_1-C_4 алкил, C_1-C_4 халогеналкил, фенил или фенил, който е частично или напълно халогениран и/или носи една до три от следните групи:

нитро, циано, C_1-C_4 алкил, C_1-C_4 халогеналкил, C_1-C_4 алкокси или C_1-C_4 халогеналкокси;

R^{18} е водород или C_1-C_6 алкил;

при което X и Y не са едновременно кислород или сяра;

и с изключение на 4-[2-хлоро-3-(4,5-дихидроизоксазол-3-ил)-4-метилсулфонилбензоил]-1-етил-5-хидрокси-1H-пиразол, 4-[2-хлоро-3-(4,5-дихидроизоксазол-3-ил)-4-метилсулфонилбензоил]-1,3-диметил-5-хидрокси-1H-пиразол, 4-[2-хлоро-3-(5-циано-4,5-дихидроизоксазол-3-ил)-4-метилсулфонилбензоил]-1,3-диметил-5-хидрокси-1H-пиразол, 4-[2-хлоро-3-(4,5-дихидротиазол-2-ил)-4-метилсулфонилбензоил]-1,3-диметил-5-хидрокси-1H-пиразол и 4-[2-хлоро-3-(4,5-дихидротиазол-2-ил)-4-метилсулфонилбензоил]-1,3-диметил-5-хидрокси-1H-пиразол; както и техните приемливи в земеделието соли.

2. 3-хетероциклизаместени бензоилови производни с формула I съгласно претенция 1, в която заместителите имат следните значения:

R^1 , R^2 са водород, нитро, халоген, циано, C_1-C_6 алкил, C_1-C_6 халогеналкил, C_1-C_6 алкокси, C_1-C_6 халогеналкокси, C_1-C_6 алкилтио, C_1-C_6 халогеналкилтио, C_1-C_6 алкилсулфинил, C_1-C_6 халогеналкилсулфинил, C_1-C_6 алкилсулфонил или C_1-C_6 халогеналкилсулфонил;

R^3 е водород, халоген или C_1-C_6 алкил;

R^4 , R^5 са водород, халоген, циано, нитро, C_1-C_4 алкил, C_1-C_4 алкокси- C_1-C_4 алкил, ди- $(C_1-C_4$ алкокси)- C_1-C_4 алкил, ди- $(C_1-C_4$ алкил)амино- C_1-C_4 алкил, [2,2-ди- $(C_1-C_4$ алкил)хидразино-1]- C_1-C_4 алкил, C_1-C_6 алкилиминоокси- C_1-C_4 алкил, C_1-C_4 алкоксикарбонил- C_1-C_4 алкил, C_1-C_4 алкилтио- C_1-C_4 алкил, C_1-C_4 халогеналкил, C_1-C_4 цианоалкил, C_3-C_8 циклоалкил, C_1-C_4 алкокси, C_1-C_4 алкокси- C_2-C_4 алкокси, C_1-C_4 халогеналкокси, C_1-C_4 алкилтио, C_1-C_4 халогеналкилтио, ди- $(C_1-C_4$ алкил)амино, COR^6 , фенил или бензил, при което двата

последни заместители могат да бъдат частично или напълно халогенирани и/или могат да носят една до три от следните групи: нитро, циано, C_1-C_4 алкил, C_1-C_4 халогеналкил, C_1-C_4 алкокси или C_1-C_4 халогеналкокси; или

R^4 и R^5 образуват заедно C_2-C_6 алкандилова верига, която може да бъде еднократно до четирикратно заместена с C_1-C_4 алкил и/или да бъде прекъсната с кислород или азот, в даден случай заместен с C_1-C_4 алкил; или

R^4 и R^5 образуват заедно с въглеродния атом, с който са свързани, карбонилна или тиокарбонилна група;

R^6 C_1-C_4 алкил, C_1-C_4 халогеналкил, C_1-C_4 алкокси, C_1-C_4 алкокси- C_2-C_4 алкокси, C_1-C_4 халогеналкокси, C_3-C_6 алкенилокси, C_3-C_6 алкинилокси или NR^7R^8 ;

R^7 е водород или C_1-C_4 алкил;

R^8 е C_1-C_4 алкил;

20 X е O , S , NR^9 , CO или $CR^{10}R^{11}$;

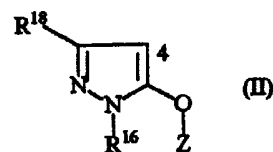
Y е O , S , NR^{12} , CO или $CR^{13}R^{14}$;

R^9 , R^{12} са водород или C_1-C_4 алкил;

R^{10} , R^{11} , R^{13} , R^{14} са водород, C_1-C_4 алкил, C_1-C_4 халогеналкил, C_1-C_4 алкоксикарбонил, C_1-C_4 халогеналкокси-карбонил или $CONR^7R^8$; или

30 R^4 и R^9 , или R^4 и R^{10} , или R^5 и R^{12} , или R^5 и R^{13} образуват заедно C_2-C_6 алкандилова верига, която може да бъде заместена еднократно до четирикратно с C_1-C_4 алкил и/или може да бъде прекъсната с кислород или азот, в даден случай заместен с C_1-C_4 алкил;

R^{15} е свързан на 4-място пиразол с формула



в която

R^{16} означава C_1-C_6 алкил;

Z е H или SO_2R^{17} ;

R^{17} е C_1-C_4 алкил, C_1-C_4 халогеналкил, фенил или фенил, който е частично или напълно халогениран и/или носи една до три от следните групи: нитро, циано, C_1-C_4 алкил, C_1-C_4 халогеналкил, C_1-C_4 алкокси или C_1-C_4 халогеналкокси;

R^{18} е водород или C_1-C_6 алкил, при което X и Y не означават едновременно кислород или сяра; и с изключение на 4-[2-хлоро-3-(4,5-дихидроизоксазол-3-ил)-4-метилсулфонилбензо-

ил]-1-етил-5-хидрокси-1Н-пиразол, 4-[2-хлоро-3-(4,5-дихидроизоксазол-3-ил)-4-метилсулфонилбензоил]-1,3-диметил-5-хидрокси-1Н-пиразол, 4-[2-хлоро-3-(5-циано-4,5-дихидроизоксазол-3-ил)-4-метилсулфонилбензоил]-1,3-диметил-5-хидрокси-1Н-пиразол, 4-[2-хлоро-3-(4,5-дихидроизоксазол-2-ил)-4-метилсулфонилбензоил]-1,3-диметил-5-хидрокси-1Н-пиразол и 4-[2-хлоро-3-(тиазолин-4,5-дион-2-ил)-4-метилсулфонилбензоил]-1,3-диметил-5-хидрокси-1Н-пиразол;

както и техните приемливи в земеделието соли.

3. 3-хетероцикллизаместени бензоилови производни с формула (I) съгласно претенция 1 или 2, характеризиращи се с това, че R³ означава водород.

4. 3-хетероцикллизаместени бензоилови производни с формула (I) съгласно претенции 1 до 3, характеризиращи се с това, че R¹, R² са нитро, халоген, циано, C₁-C₆ алкил, C₁-C₆ халогеналкил, C₁-C₆ алкокси, C₁-C₆ халогеналкокси, C₁-C₆ алкилтио, C₁-C₆ халогеналкилтио, C₁-C₆ алкилсулфинил, C₁-C₆ халогеналкилсулфинил, C₁-C₆ алкилсулфонил или C₁-C₆ халогеналкилсулфонил.

5. 3-хетероцикллизаместени бензоилови производни с формула I съгласно претенции 1 до 4, характеризиращи се с това, че Z означава SO₂R¹⁷.

6. 3-хетероцикллизаместени бензоилови производни с формула I съгласно претенции 1 до 4, характеризиращи се с това, че Z означава водород.

7. 3-хетероцикллизаместени бензоилови производни с формула I съгласно претенции 1 до 4 или 6, характеризиращи се с това, че X означава кислород и Y означава CR¹³R¹⁴.

8. 3-хетероцикллизаместени бензоилови производни с формула I съгласно претенции 1 до 4 или 6, или 7, характеризиращи се с това, че

R⁴ означава халоген, нитро, C₁-C₄ алкил, C₁-C₄ алкокси- C₁-C₄ алкил, C₁-C₄ алкоксикарбонил-C₁-C₄ алкил, C₁-C₄-алкилтио C₁-C₄ алкил, C₁-C₄ халогеналкил, C₁-C₄ цианоалкил, C₃-C₈ циклоалкил, C₁-C₄ алкокси, C₁-C₄ алкокси-C₂-C₄ алкокси, C₁-C₄ халогеналкокси, C₁-C₄ алкилтио, C₁-C₄ халогеналкилтио, ди-(C₁-C₄ алкил)амино, COR⁶, фенил или бензил, при което двата последни заместители могат да бъдат частично или напълно халогенирани и/или да носят една до три от следните групи: нитро, циано, C₁-C₄ алкил, C₁-C₄ халогеналкил, C₁-C₄ алкокси или C₁-C₄ халогеналкокси;

R⁵ е водород или C₁-C₄ алкил; или

R⁴ и R⁵ образуват заедно C₂-C₆ алкандилова верига, която може да бъде заместена еднократно до четирикратно с C₁-C₄ алкил и/

или може да бъде прекъсната с кислород или азот, в даден случай заместен с C₁-C₄ алкил; или

R⁵ и R¹³ образуват заедно алкандилова верига, която може да бъде еднократно до четирикратно заместена с C₁-C₄ алкил и/или да бъде прекъсната с кислород или азот, в даден случай заместен с C₁-C₄ алкил.

9. 3-хетероцикллизаместени бензоилови производни с формула (I) съгласно претенции 1 до 4, или 6 до 8, характеризиращи се с това, че

R⁴ означава C₁-C₄ алкил, C₁-C₄ халогеналкил, C₁-C₄ алкоксикарбонил или CONR⁷R⁸; R⁵ е водород или C₁-C₄ алкил; или

R⁴ и R⁵ образуват заедно C₂-C₆ алкандилова верига, която може да бъде заместена еднократно до четирикратно с C₁-C₄ алкил и/или може да бъде прекъсната с кислород или азот, в даден случай заместен с C₁-C₄ алкил; или

R⁵ и R¹³ образуват заедно C₂-C₄ алкандилова верига, която може да бъде еднократно до четирикратно заместена с C₁-C₄ алкил и/или може да бъде прекъсната с кислород или азот, в даден случай заместен с C₁-C₄ алкил.

10. 3-хетероцикллизаместени бензоилови производни с формула I съгласно претенции 1 до 4 или 6, или 7, характеризиращи се с това, че R⁴ и R⁵ означават водород.

11. 3-хетероцикллизаместени бензоилови производни с формула I съгласно претенции 1 до 4 или 6, или 7, или 10, характеризиращи се с това, че R¹⁸ означава водород.

12. 4-[2-хлоро-3-(4,5-дихидроизоксазол-3-ил)-4-метилсулфонилбензоил]-1-метил-5-хидрокси-1Н-пиразол.

13. Приемлива в земеделието сол на 4-[2-хлоро-3-(4,5-дихидроизоксазол-3-ил)-4-метилсулфонилбензоил]-1-метил-5-хидрокси-1Н-пиразол.

14. 3-хетероцикллизаместени бензоилови производни с формула I съгласно претенции 1 до 4 или 6, характеризиращи се с това, че

X означава S, NR⁹, CO или CR¹⁰R¹¹; или Y означава O, S, NR¹² или CO;

15. 3-хетероцикллизаместени бензоилови производни с формула I съгласно претенции 1 до 4 или 6, или 14, характеризиращи се с това, че R¹⁸ означава водород.

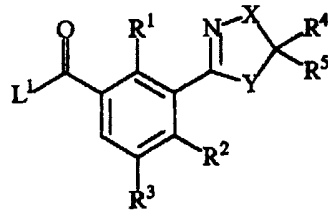
16. 3-хетероцикллизаместени бензоилови производни с формула I съгласно претенции 1 до 4 или 6, или 14, характеризиращи се с това, че

R⁴ означава халоген, циано, C₁-C₄ алкил, C₁-C₄ алкокси- C₁-C₄ алкил, C₁-C₄ алкоксикарбонил- C₁-C₄ алкил, C₁-C₄ алкилтио- C₁-C₄ алкил, C₁-C₄ халогеналкил, C₁-C₄ цианоалкил, C₃-C₈ циклоалкил, C₁-C₆ алкокси, C₁-C₄ алкокси- C₁-C₄ алкокси, C₁-C₄ халогеналкокси, C₁-C₄ алкилтио, C₁-C₄ халогеналкилтио, ди-(C₁-C₄ алкил)амино, COR⁶, фенол или бензил, при което двата последни заместители могат да бъдат частично или напълно халогенирани и/или могат да носят една до три от следните групи: нитро, циано, C₁-C₄ алкил, C₁-C₄ халогеналкил, C₁-C₄ алкокси или C₁-C₄ халогеналкокси;

R⁵ е водород или C₁-C₄ алкил; или

R⁴ и R⁵ образуват заедно C₂-C₆ алкандиолова верига, която може да бъде заместена еднократно до четирикратно с C₁-C₄ алкил и/или може да бъде прекъсната с кислород или азот, в даден случай заместен с C₁-C₄ алкил; или

R⁴ и R⁹, или R⁴ и R¹⁰, или R⁵ и R¹², или



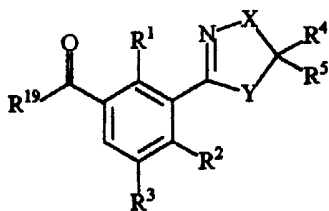
(IIIa)

в които заместителите R¹ до R⁵, X и Y имат значенията, дадени в претенция 1, и L¹ означава нуклеофилна напускаща група, и ацилираният продукт, в даден случай в присъствие на катализатор, се превръща в съединение с формула I (с Z = H) и в даден случай, за получаване на 3-хетероциклизаместени бензоилови производни с формула I, в която Z = SO₂R¹⁷, взаимодейства със съединение с формула



в която R¹⁷ има значенията, дадени в претенция 1, и L² означава нуклеофилна напускаща група.

18. 3-хетероциклизаместени производни на бензоена киселина с формула

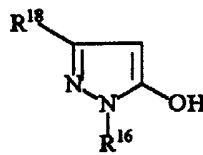


(III)

R⁵ и R¹³ образуват заедно C₂-C₆ алкандиолова верига, която може да бъде еднократно до четирикратно заместена с C₁-C₄ алкил и/или да бъде прекъсната с кислород или азот, в даден случай заместен с C₁-C₄ алкил;

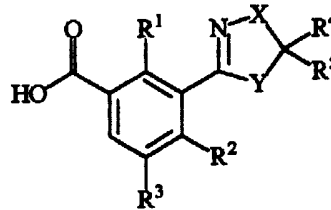
R¹⁸ означава C₁-C₆ алкил.

17. Метод за получаване на 3-хетероциклизаместени бензоилови производни с формула I съгласно претенция 1, характеризиращ се с това, че пиразол с формула II, в която Z = H, и заместителите R¹⁶ и R¹⁸ имат значенията, дадени в претенция 1,



(II) (Z = H)

се ацилира с активирана карбоксилна киселина с формула III α или с карбоксилна киселина с формула III β



(IIIβ)

в която

R¹⁹ означава хидрокси или остатък, който може да бъде хидролизиран и заместителите R¹ до R⁵, X и Y имат значенията, дадени в претенции 1 до 16, с изключение на метилов 2-хлоро-3-(4,5-дихидроизоксазол-3-ил)-4-метилсулфонилбензоат, метилов 2-хлоро-3-(4,5-дихидроизоксазол-2-ил)-4-метилсулфонилбензоат и метилов 2,4-дихлоро-3-(5-метилкарбонилокси-4,5-дихидроизоксазол-3-ил)бензоат.

19. 3-хетероциклизаместени производни на бензоена киселина с формула III съгласно претенция 18, характеризиращи се с това, че заместителите R¹ до R⁵, X и Y имат значенията, дадени в претенции 2 до 16.

20. 3-хетероциклизаместени производни на бензоена киселина с формула III съгласно претенция 18 или 19, характеризиращи се с това, че

R¹⁹ означава водород, хидрокси или C₁-C₆ алкокси.

21. Средство, характеризиращо се с това, че съдържа хербицидно активно количество от най-малко едно 3-хетероциклилзаместено бензоилово производно с формула I или негова приемлива в земеделието сол съгласно претенции 1 до 16, заедно с обичайно помощно средство за приготвяне на готова форма на растително защитно средство.

22. Метод за получаване на средство съгласно претенция 21, характеризиращ се с това, че хербицидно активно количество от най-малко едно 3-хетероциклилзаместено бензоилово производно с формула I или негова приемлива в земеделието сол съгласно претенции 1 до 16

се смесва с обичайно помощно средство за приготвяне на готова форма на растително защитно средство.

23. Метод за борба с нежелан растеж, характеризиращ се с това, че на растенията, тяхното жизнено пространство и/или семена се въздейства с хербицидно активно количество от най-малко едно 3-хетероциклилзаместено бензоилово производно с формула I или негова приемлива в земеделието сол съгласно претенции от 1 до 16.

24. Използване на 3-хетероциклилзаместени бензоилови производни с формула I и тяхна приемлива в земеделието сол съгласно претенции от 1 до 16 като хербицид.

Издание на Патентното ведомство на Република България
1113 София, бул. "Д-р Г. М. Димитров" 52-Б

Експерт: Б.Шикаланова

Редактор: А.Семерджиева

Пор. № 42291

Тираж: 40 ВН