

(19)



**Евразийское
патентное
ведомство**

(11) **034643**(13) **B1**(12) **ОПИСАНИЕ ИЗОБРЕТЕНИЯ К ЕВРАЗИЙСКОМУ ПАТЕНТУ**

(45) Дата публикации и выдачи патента
2020.03.02

(21) Номер заявки
201792052

(22) Дата подачи заявки
2016.03.14

(51) Int. Cl. **C07D 271/113** (2006.01)
A01N 43/26 (2006.01)

(54) **СОЛИ АМИДОВ N-(1,3,4-ОКСАДИАЗОЛ-2-ИЛ)АРИЛ КАРБОНОВОЙ КИСЛОТЫ И ИХ ПРИМЕНЕНИЕ В КАЧЕСТВЕ ГЕРБИЦИДОВ**

(31) **15159483.5**

(32) **2015.03.17**

(33) **EP**

(43) **2018.03.30**

(86) **PCT/EP2016/055396**

(87) **WO 2016/146561 2016.09.22**

(71)(73) Заявитель и патентовладелец:
**БАЙЕР КРОПСАЙЕНС
АКЦИЕНГЕЗЕЛЬШАФТ (DE)**

(72) Изобретатель:
**Кён Арним, Браун Ральф, Аренс
Хартмут, Вальдрафф Кристиан,
Хайнеманн Инес, Дитрих Хансйёрг,
Гатцвайлер Эльмар, Розингер
Кристофер Хью (DE)**

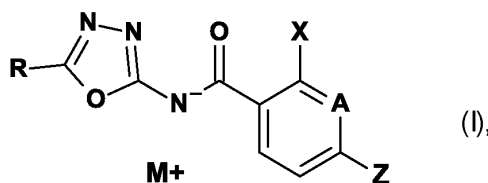
(74) Представитель:
**Веселицкая И.А., Веселицкий М.Б.,
Кузенкова Н.В., Каксис Р.А., Белоусов
Ю.В., Куликов А.В., Кузнецова Е.В.,
Соколов Р.А., Кузнецова Т.В. (RU)**

(56) **WO-A1-2012126932
WO-A1-2013164331**

Anonym: "Daten zu Vergleichsversuchen Nr. 13719550.9 - 1462", European Register Office, 9 July 2015 (2015-07-09), pages 1-5, XP002757333, Retrieved from the Internet: URL: <https://register.epo.org/application?documentId=EXQ5465S2290FI4&number=EP13719550&lng=en&npl=true> [retrieved on 2016-05-11] The document is available by entering Application no. EP 13719550 in 'All Documents', date 09-07-2015, the whole document

**WO-A1-2013124245
US-A-4416683**

(57) Соли N-(1,3,4-оксадiazол-2-ил)арилкарбоксамидов общей формулы (I), описанные в качестве гербицидов.



В этой формуле (I), X, Z и R представляют собой радикалы, такие как водород, органические радикалы, такие как алкил, и другие радикалы, такие как галоген. А представляет собой азот или углерод. M⁺ представляет собой катион.

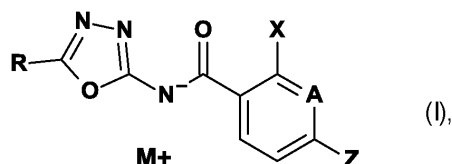
034643 B1

034643 B1

Изобретение относится к технической области гербицидов, особенно к гербицидам для селективной борьбы с широколиственными сорняками и сорняками в культурах полезных растений.

WO 2012/126932 A1 описывает N-(1,3,4-оксадиазол-2-ил)бензамиды и их применение в качестве гербицидов. Активные компоненты, описанные в данной заявке, не всегда проявляют достаточную активность против вредных растений и/или некоторые из них не имеют достаточной совместимости с некоторыми важными культурными растениями, такими как виды злаков, кукуруза и рис. Поэтому целью настоящего изобретения является обеспечение дополнительных гербицидно-активных компонентов. Эта цель достигается с помощью заявленных солей N-(1,3,4-оксадиазол-2-ил)арилкарбоксамидов, которые описаны ниже.

Настоящее изобретение также обеспечивает соли N-(1,3,4-оксадиазол-2-ил)бензамидов формулы (I)



где

A представляет собой N или CY,

R представляет собой водород, (C₁-C₆)алкил, R¹O-(C₁-C₆)алкил, CH₂R⁶, (C₃-C₇)циклоалкил, галоген-(C₁-C₆)алкил, (C₂-C₆)алкенил, галоген-(C₂-C₆)алкенил, (C₂-C₆)алкинил, галоген-(C₂-C₆)алкинил, OR¹, NHR¹, метоксикарбонил, этоксикарбонил, метоксикарбонилметил, этоксикарбонилметил, метилкарбонил, трифторметилкарбонил, диметиламино, ацетиламино, метилсульфенил, метилсульфинил, метилсульфонил, или гетероарил, гетероциклил, бензил или фенил каждый замещенный с помощью s радикалов из группы, которая состоит из галогена, нитро, циано, (C₁-C₆)алкила, галоген-(C₁-C₆)алкила, (C₃-C₆)циклоалкила, S(O)_n-(C₁-C₆)алкила, (C₁-C₆)алкокси, галоген-(C₁-C₆)алкокси, (C₁-C₆)алкокси-(C₁-C₄)алкила,

X представляет собой нитро, галоген, циано, формил, тиоцианато, (C₁-C₆)алкил, галоген-(C₁-C₆)алкил, (C₂-C₆)алкенил, галоген-(C₂-C₆)алкенил, (C₂-C₆)алкинил, галоген-(C₂-C₆)алкинил, (C₃-C₆)циклоалкил, галоген-(C₃-C₆)циклоалкил, (C₃-C₆)циклоалкил-(C₁-C₆)алкил, галоген-(C₃-C₆)циклоалкил-(C₁-C₆)алкил, COR¹, COOR¹, OCOOR¹, NR¹COOR¹, C(O)N(R¹)₂, NR¹C(O)N(R¹)₂, OC(O)N(R¹)₂, C(O)NR¹OR¹, OR¹, OCOR¹, OSO₂R², S(O)_nR², SO₂OR¹, SO₂N(R¹)₂, NR¹SO₂R², NR¹COR¹, (C₁-C₆)алкил-S(O)_nR², (C₁-C₆)алкил-OR¹, (C₁-C₆)алкил-OCOR¹, (C₁-C₆)алкил-OSO₂R², (C₁-C₆)алкил-CO₂R¹, (C₁-C₆)алкил-SO₂OR¹, (C₁-C₆)алкил-CON(R¹)₂, (C₁-C₆)алкил-SO₂N(R¹)₂, (C₁-C₆)алкил-NR¹COR¹, (C₁-C₆)алкил-NR¹SO₂R², NR₁R₂, P(O)(OR⁵)₂, CH₂P(O)(OR⁵)₂, (C₁-C₆)алкилгетероарил, (C₁-C₆)алкилгетероциклил, где каждый из двух последних радикалов является замещенным с помощью s радикалов, выбранных из галогена, (C₁-C₆)алкила, галоген-(C₁-C₆)алкила, S(O)_n-(C₁-C₆)алкила, (C₁-C₆)алкокси, галоген-(C₁-C₆)алкокси и где гетероциклил несет n оксо групп,

Y представляет собой водород, нитро, галоген, циано, тиоцианато, (C₁-C₆)алкил, галоген-(C₁-C₆)алкил, (C₂-C₆)алкенил, галоген-(C₂-C₆)алкенил, (C₂-C₆)алкинил, галоген-(C₂-C₆)алкинил, (C₃-C₆)циклоалкил, (C₃-C₆)циклоалкенил, галоген-(C₃-C₆)циклоалкил, (C₃-C₆)циклоалкил-(C₁-C₆)алкил, галоген-(C₃-C₆)циклоалкил-(C₁-C₆)алкил, COR¹, COOR¹, OCOOR¹, NR¹COOR¹, C(O)N(R¹)₂, NR¹C(O)N(R¹)₂, OC(O)N(R¹)₂, CO(NOR¹)R¹, NR¹SO₂R², NR¹COR¹, OR¹, OSO₂R², S(O)_nR², SO₂OR¹, SO₂N(R¹)₂, (C₁-C₆)алкил-S(O)_nR², (C₁-C₆)алкил-OR¹, (C₁-C₆)алкил-OCOR¹, (C₁-C₆)алкил-OSO₂R², (C₁-C₆)алкил-CO₂R¹, (C₁-C₆)алкил-CN, (C₁-C₆)алкил-SO₂OR¹, (C₁-C₆)алкил-CON(R¹)₂, (C₁-C₆)алкил-SO₂N(R¹)₂, (C₁-C₆)алкил-NR¹COR¹, (C₁-C₆)алкил-NR¹SO₂R², N(R¹)₂, P(O)(OR⁵)₂, CH₂P(O)(OR⁵)₂, (C₁-C₆)алкилфенил, (C₁-C₆)алкилгетероарил, (C₁-C₆)алкилгетероциклил, фенил, гетероарил или гетероциклил, где b последних радикалов являются каждый замещенным с помощью s радикалов из группы, которая состоит из галогена, нитро, циано, (C₁-C₆)алкила, галоген-(C₁-C₆)алкила, (C₃-C₆)циклоалкила, S(O)_n-(C₁-C₆)алкила, (C₁-C₆)алкокси, галоген-(C₁-C₆)алкокси, (C₁-C₆)алкокси-(C₁-C₄)алкила и цианометила и где гетероциклил несет n оксо групп,

Z представляет собой галоген, циано, тиоцианато, (C₁-C₆)алкил, (C₁-C₆)алкокси, галоген-(C₁-C₆)алкил, (C₂-C₆)алкенил, галоген-(C₂-C₆)алкенил, (C₂-C₆)алкинил, галоген-(C₂-C₆)алкинил, (C₃-C₆)циклоалкил, галоген-(C₃-C₆)циклоалкил, (C₃-C₆)циклоалкил-(C₁-C₆)алкил, галоген-(C₃-C₆)циклоалкил-(C₁-C₆)алкил, COR¹, COOR¹, OCOOR¹, NR¹COOR¹, C(O)N(R¹)₂, NR¹C(O)N(R¹)₂, OC(O)N(R¹)₂, C(O)NR¹OR¹, OSO₂R², S(O)_nR², SO₂OR¹, SO₂N(R¹)₂, NR¹SO₂R², NR¹COR¹, (C₁-C₆)алкил-S(O)_nR², (C₁-C₆)алкил-OR¹, (C₁-C₆)алкил-OCOR¹, (C₁-C₆)алкил-OSO₂R², (C₁-C₆)алкил-CO₂R¹, (C₁-C₆)алкил-SO₂OR¹, (C₁-C₆)алкил-CON(R¹)₂, (C₁-C₆)алкил-SO₂N(R¹)₂, (C₁-C₆)алкил-NR¹COR¹, (C₁-C₆)алкил-NR¹SO₂R², N(R¹)₂, P(O)(OR⁵)₂, гетероарил, гетероциклил или фенил, где три последних радикала являются каждый замещенным с помощью s радикалов из группы, которая состоит из галогена, нитро, циано, (C₁-C₆)алкила, галоген-(C₁-C₆)алкила, (C₃-C₆)циклоалкила, S(O)_n-(C₁-C₆)алкила, (C₁-C₆)алкокси или галоген-(C₁-C₆)алкокси, и где гетероциклил несет n оксо групп, или

Z также может представлять собой водород, если Y представляет собой S(O)_nR² радикал,

R^1 представляет собой водород, (C_1-C_6) алкил, (C_1-C_6) галогеналкил, (C_2-C_6) алкенил, (C_2-C_6) галогеналкенил, (C_2-C_6) алкинил, (C_2-C_6) галогеналкинил, (C_3-C_6) циклоалкил, (C_3-C_6) циклоалкенил, (C_3-C_6) галогенциклоалкил, (C_1-C_6) алкил-О- (C_1-C_6) алкил, (C_3-C_6) циклоалкил- (C_1-C_6) алкил, фенил, фенил- (C_1-C_6) алкил, гетероарил, (C_1-C_6) алкилгетероарил, гетероциклил, (C_1-C_6) алкилгетероциклил, (C_1-C_6) алкил-О-гетероарил, (C_1-C_6) алкил-О-гетероциклил, (C_1-C_6) алкил- NR^3 -гетероарил или (C_1-C_6) алкил- NR^3 -гетероциклил, где последние 21 радикалов являются замещенными с помощью s радикалов из группы, которая состоит из циано, галогена, нитро, тиоцианато, OR^3 , $S(O)_nR^4$, $N(R^3)_2$, NR^3OR^3 , COR^3 , $OCOR^3$, $SCOR^4$, NR^3COR^3 , $NR^3SO_2R^4$, CO_2R^3 , $COSR^4$, $CON(R^3)_2$ и (C_1-C_4) алкокси- (C_2-C_6) алкоксикарбонила и где гетероциклил несет n оксо групп,

R^2 представляет собой (C_1-C_6) алкил, (C_1-C_6) галогеналкил, (C_2-C_6) алкенил, (C_2-C_6) галогеналкенил, (C_2-C_6) алкинил, (C_2-C_6) галогеналкинил, (C_3-C_6) циклоалкил, (C_3-C_6) циклоалкенил, (C_3-C_6) галогенциклоалкил, (C_1-C_6) алкил-О- (C_1-C_6) алкил, (C_3-C_6) циклоалкил- (C_1-C_6) алкил, фенил, фенил- (C_1-C_6) алкил, гетероарил, (C_1-C_6) алкилгетероарил, гетероциклил, (C_1-C_6) алкилгетероциклил, (C_1-C_6) алкил-О-гетероарил, (C_1-C_6) алкил-О-гетероциклил, (C_1-C_6) алкил- NR^3 -гетероарил, (C_1-C_6) алкил- NR^3 -гетероциклил, где последний 21 радикал является замещенным с помощью s радикалов из группы, которая состоит из циано, галогена, нитро, тиоцианато, OR^3 , $S(O)_nR^4$, $N(R^3)_2$, NR^3OR^3 , COR^3 , $OCOR^3$, $SCOR^4$, NR^3COR^3 , $NR^3SO_2R^4$, CO_2R^3 , $COSR^4$, $CON(R^3)_2$ и (C_1-C_4) алкокси- (C_2-C_6) алкоксикарбонила, и где гетероциклил несет n оксо групп,

R^3 представляет собой водород, (C_1-C_6) алкил, (C_2-C_6) алкенил, (C_2-C_6) алкинил, (C_3-C_6) циклоалкил или (C_3-C_6) циклоалкил- (C_1-C_6) алкил,

R^4 представляет собой (C_1-C_6) алкил, (C_2-C_6) алкенил или (C_2-C_6) алкинил,

R^5 представляет собой метил или этил,

R^6 представляет собой ацетокси, ацетамидо, N-метилацетамидо, бензоилокси, бензамидо, N-метилбензамидо, метоксикарбонил, этоксикарбонил, бензоил, метилкарбонил, пиперидинилкарбонил, морфолинилкарбонил, трифторметилкарбонил, аминокарбонил, метиламинокарбонил, диметиламинокарбонил, (C_1-C_6) алкокси, (C_3-C_6) циклоалкил, или гетероарил, гетероциклил или фенил, каждый замещенный с помощью s радикалов из группы, которая состоит из метила, этила, метокси, трифторметила и галогена,

n представляет собой 0, 1 или 2,

s представляет собой 0, 1, 2 или 3,

M^+ представляет собой катион, выбранный из группы, которая состоит из следующих: ион натрия, ион калия, ион лития, ион магния, ион кальция, ион NH_4^+ , ион (2-гидроксиэт-1-ил)аммония, ион бис-N,N-(2-гидроксиэт-1-ил)аммония, ион трис-N,N,N-(2-гидроксиэт-1-ил)аммония, ион тетра-N,N,N,N-(2-гидроксиэт-1-ил)аммония, ион N-(2-гидроксиэт-1-ил)трис-N,N,N-метиламмония, ион метиламмония, ион диметиламмония, ион триметиламмония, ион тетраметиламмония, ион этиламмония, ион диэтиламмония, ион триэтиламмония, ион тетраэтиламмония, ион изопропиламмония, ион диизопропиламмония, ион тетрапропиламмония, ион тетрабутиламмония, ион тетраоктиламмония, ион 2-(2-гидроксиэт-1-окси)эт-1-иламмония, ион ди-(2-гидроксиэт-1-ил)аммония, ион триметилбензиламмония, ион триэтилбензиламмония, ион три- $((C_1-C_4)$ алкил)сульфония, ион бензиламмония, 1-ион фенилэтиламмония, ион 2-фенилэтиламмония, ион диизопропилэтиламмония, ион пиридина, ион пиперидина, ион имидазола, ион морфолина, ион 1,8-диазабикло[5.4.0]ундец-7-ена.

В формуле (I) и всех формулах, которые следуют дальше, алкильные радикалы, у которых больше двух атомов углерода, могут быть с прямой или разветвленной цепью. Алкильные радикалы представляют собой, например, метил, этил, н-пропил или изопропил, н-, изо-, трет- или 2-бутил, пентилы, гексилы, такие как н-гексил, изогексил и 1,3-диметилбутил. Аналогичным образом алкенил представляет собой, например, аллил, 1-метилпроп-2-ен-1-ил, 2-метилпроп-2-ен-1-ил, бут-2-ен-1-ил, бут-3-ен-1-ил, 1-метилбут-3-ен-1-ил и 1-метилбут-2-ен-1-ил. Алкинил представляет собой, например, пропаргил, бут-2-ин-1-ил, бут-3-ин-1-ил, 1-метилбут-3-ин-1-ил. Многократная связь может быть в любом положении в каждом ненасыщенном радикале. Циклоалкил представляет собой насыщенную кольцевую систему с от 3 до 6 атомов углерода, например циклопропил, циклобутил, циклопентил или циклогексил. Аналогичным образом циклоалкенил представляет собой моноциклическую алкенильную группу, которая содержит от 3 до 6 углеродных членов кольца, например циклопропенил, циклобутенил, циклопентенил и циклогексенил, где двойная связь может быть в любом положении.

Галоген представляет собой фтор, хлор, бром или йод.

Гетероциклил представляет собой насыщенный, частично насыщенный или полностью ненасыщенный циклический радикал который содержит от 3 до 6 атомов кольца, из которых от 1 до 4 из группы, которая состоит из кислорода, азота и серы, и который может дополнительно быть конденсирован с помощью бензольного кольца. Например, гетероциклил представляет собой пиперидинил, пирролидинил, тетрагидрофуранил, дигидрофуранил и оксетанил.

Гетероарил представляет собой ароматический циклический радикал который содержит 3-6 атомов кольца, из которых 1-4 из группы, которая состоит из кислорода, азота и серы, и которые могут дополнительно быть конденсированы с помощью бензольного кольца. Например, гетероарил представляет собой бензи-

мидазол-2-ил, фуранил, имидазолил, изоксазолил, изотиазолил, оксазолил, пиразинил, пиримидинил, пиридазинил, пиридинил, бензизоксазолил, тиазолил, пирролил, пиразолил, тиофенил, 1,2,3-оксадиазолил, 1,2,4-оксадиазолил, 1,2,5-оксадиазолил, 1,3,4-оксадиазолил, 1,2,4-триазолил, 1,2,3-триазолил, 1,2,5-триазолил, 1,3,4-триазолил, 1,2,4-триазолил, 1,2,4-тиадиазолил, 1,3,4-тиадиазолил, 1,2,3-тиадиазолил, 1,2,5-тиадиазолил, 2Н-1,2,3,4-тетразолил, 1Н-1,2,3,4-тетразолил, 1,2,3,4-оксатриазолил, 1,2,3,5-оксатриазолил, 1,2,3,4-тиатриазолил и 1,2,3,5-тиатриазолил.

Если группа полизамещенная радикалами, это следует понимать как то, что эта группа замещена одним или несколькими одинаковыми или разными радикалами, выбранными из упомянутых радикалов. То же самое относится к образованию кольцевых систем различными атомами и элементами.

Определение катиона M^+ следует понимать как то, что соли согласно изобретению формулы (I) находятся в незаряженном виде. В случае одновалентных катионов это означает, что анион присутствует в качестве противоиона. В случае поливалентных катионов, например ди- или трехвалентных катионов, в качестве противоионов присутствуют два или три атома.

Предпочтение отдается соединениям согласно изобретению формулы (I) где

A представляет собой N или CY,

R представляет собой водород, (C_1-C_6) алкил, (C_3-C_7) циклоалкил, галоген- (C_1-C_6) алкил, (C_3-C_7) циклоалкилметил, метоксикарбонилметил, этоксикарбонилметил, ацетилметил, метоксиметил, метоксизтил, бензил, пиразин-2-ил, фуран-2-ил, тетрагидрофуран-2-ил, морфолин, диметиламино или фенил, замещенный с помощью s радикалов из группы, которая состоит из метила, метокси, трифторметила и галогена;

X представляет собой нитро, галоген, циано, (C_1-C_6) алкил, галоген- (C_1-C_6) алкил, (C_3-C_6) циклоалкил, OR^1 , $S(O)_nR^2$, (C_1-C_6) алкил- $S(O)_nR^2$, (C_1-C_6) алкил- OR^1 , (C_1-C_6) алкил- $CON(R^1)_2$, (C_1-C_6) алкил- $SO_2N(R^1)_2$, (C_1-C_6) алкил- NR^1COR^1 , (C_1-C_6) алкил- $NR^1SO_2R^2$, (C_1-C_6) алкилгетероарил, (C_1-C_6) алкилгетероцикл, где каждый из двух последних радикалов является замещенным с помощью s радикалов, выбранных из галогена, (C_1-C_6) алкила, галоген- (C_1-C_6) алкила, $S(O)_n$ - (C_1-C_6) алкила, (C_1-C_6) алкокси, галоген- (C_1-C_6) алкокси и где гетероцикл несет n оксо групп,

Y представляет собой водород, нитро, галоген, циано, (C_1-C_6) алкил, (C_1-C_6) -галогеналкил, OR^1 , $S(O)_nR^2$, $SO_2N(R^1)_2$, $N(R^1)_2$, $NR^1SO_2R^2$, NR^1COR^1 , (C_1-C_6) алкил- $S(O)_nR^2$, (C_1-C_6) алкил- OR^1 , (C_1-C_6) алкил- $CON(R^1)_2$, (C_1-C_6) алкил- $SO_2N(R^1)_2$, (C_1-C_6) алкил- NR^1COR^1 , (C_1-C_6) алкил- $NR^1SO_2R^2$, (C_1-C_6) алкилфенил, (C_1-C_6) алкилгетероарил, (C_1-C_6) алкилгетероцикл, фенил, гетероарил или гетероцикл, где каждый из 6 последних радикалов является замещенным с помощью s радикалов из группы, которая состоит из галогена, нитро, циано, (C_1-C_6) алкила, галоген- (C_1-C_6) алкила, (C_3-C_6) циклоалкила, $S(O)_n$ - (C_1-C_6) алкила, (C_1-C_6) алкокси, галоген- (C_1-C_6) алкокси, (C_1-C_6) алкокси- (C_1-C_4) алкила и цианометила и где гетероцикл несет n оксо групп,

Z представляет собой галоген, циано, нитро, метил, галоген- (C_1-C_6) алкил, (C_3-C_6) циклоалкил, $S(O)_nR^2$, 1,2,4-триазол-1-ил, пиразол-1-ил или

Z также может представлять собой водород, если Y представляет собой $S(O)_nR^2$ радикал,

R^1 представляет собой водород, (C_1-C_6) алкил, (C_2-C_6) алкенил, (C_2-C_6) алкинил, (C_3-C_6) циклоалкил, (C_3-C_6) циклоалкил- (C_1-C_6) алкил, (C_1-C_6) алкил-О- (C_1-C_6) алкил, фенил, фенил- (C_1-C_6) алкил, гетероарил, (C_1-C_6) алкилгетероарил, гетероцикл, (C_1-C_6) алкилгетероцикл, (C_1-C_6) алкил-О-гетероарил, (C_1-C_6) алкил-О-гетероцикл, (C_1-C_6) алкил- NR^3 -гетероарил или (C_1-C_6) алкил- NR^3 -гетероцикл, где 16 последних радикалов являются замещенными с помощью s радикалов из группы, которая состоит из циано, галогена, нитро, OR^3 , $S(O)_nR^4$, $N(R^3)_2$, NR^3OR^3 , COR^3 , $OCOR^3$, NR^3COR^3 , $NR^3SO_2R^4$, CO_2R^3 , $CON(R^3)_2$ и (C_1-C_4) алкокси- (C_2-C_6) алкоксикарбонила и где гетероцикл несет n оксо групп,

R^2 представляет собой (C_1-C_6) алкил, (C_3-C_6) циклоалкил или (C_3-C_6) циклоалкил- (C_1-C_6) алкил, где каждый из упомянутых выше трех радикалов является замещенным с помощью s радикалов из группы, которая состоит из галогена и OR^3 ,

R^3 представляет собой водород или (C_1-C_6) алкил,

R^4 представляет собой (C_1-C_6) алкил,

n представляет собой 0, 1 или 2,

s представляет собой 0, 1, 2 или 3,

M^+ представляет собой катион, выбранный из группы, которая состоит из следующих: ион натрия, ион калия, ион лития, ион магния, ион кальция, ион NH_4^+ , ион (2-гидроксиэт-1-ил)аммония, ион бис-N,N-(2-гидроксиэт-1-ил)аммония, ион трис-N,N,N-(2-гидроксиэт-1-ил)аммония, ион тетра-N,N,N,N-(2-гидроксиэт-1-ил)аммония, ион N-(2-гидроксиэт-1-ил)трис-N,N,N-метиламмония, ион метиламмония, ион диметиламмония, ион триметиламмония, ион тетраметиламмония, ион этиламмония, ион диэтиламмония, ион триэтиламмония, ион тетраэтиламмония, ион изопропиламмония, ион диизопропиламмония, ион тетрапропиламмония, ион тетрабутиламмония, ион тетраоктиламмония, ион 2-(2-гидроксиэт-1-окси)эт-1-иламмония, ион ди-(2-гидроксиэт-1-ил)аммония, ион триметилбензиламмония, ион триэтилбензиламмония, ион три- $((C_1-C_4)$ алкил)сульфония, ион бензиламмония, ион 1-фенилэтиламмония, ион 2-фенилэтиламмония, ион диизопропилэтиламмония, ион пиридина, ион пиперидиния, ион имидазола, ион морфолина, ион 1,8-диазабицикло[5.4.0]ундец-7-ена.

Особое предпочтение отдается соединениям согласно изобретению формулы (I) где

A представляет собой N или CY,

R представляет собой (C₁-C₆)алкил, (C₃-C₇)циклоалкил или метоксиметил,

X представляет собой галоген, (C₁-C₆)алкил, галоген-(C₁-C₆)алкил, OR¹ или S(O)_nR²,

Y представляет собой (C₁-C₆)алкил, (C₁-C₆)галогеналкил, OR¹ или S(O)_nR²,

Z представляет собой галоген, метил, галоген-(C₁-C₆)алкил или S(O)_nR²,

R¹ представляет собой водород, (C₁-C₆)алкил или (C₃-C₆)циклоалкил,

R² представляет собой (C₁-C₆)алкил,

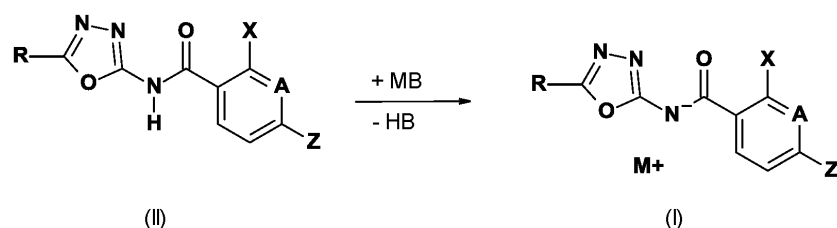
n представляет собой 0, 1 или 2,

s представляет собой 0, 1, 2 или 3,

M⁺ представляет собой катион, выбранный из группы, которая состоит из иона натрия, иона калия, иона лития, иона магния, иона кальция и NH₄⁺ иона.

Соединения согласно изобретению могут быть получены, например, способом, показанным на схеме 1, путем депротонирования N-(1,3,4-оксадиазол-2-ил) бензамида и -никотинамида (II) с пригодным основанием формулы M⁺B⁻(схема), где B⁻, например, гидрид, гидроксил или алкокси анионы, такие как метокси, этокси, н-пропокси, изопропокси, н-бутокси или трет-бутокси.

Схема:



Соединения формулы (II) известны из WO 2012/126932 A1 и могут быть получены описанными там способами.

Соединения формулы (I) согласно изобретению обладают превосходной гербицидной активностью в отношении широкого спектра экономически важных одно- и двудольных однолетних вредных растений. Активные компоненты также хорошо борются с многолетними вредными растениями, с которыми сложно бороться и которые производят побеги из корневищ, корневых запасов или других многолетних органов.

Таким образом, настоящее изобретение также обеспечивает способ борьбы с нежелательными растениями или способ регулирования роста растений, предпочтительно в растительных культурах, где одно или несколько соединений согласно изобретению применяют на растения (например, вредные растения, такие как однодольные или двудольные сорняки или нежелательные культурные растения), семена (например, зерна, семена или ростки, такие как клубни или побеги с почками) или площадь, на которой растут растения (например, площадь выращивания). Соединения согласно изобретению могут быть применены, например, перед посевом (при необходимости также путем внесения в почву) до прорастания или после прорастания. Конкретные примеры некоторых представителей однодольных и двудольных сорняков, с которыми можно бороться посредством соединений согласно изобретению, являются следующими, хотя перечисление не предназначено для ограничения на конкретные виды.

Однодольные вредные растения родов: Aegilops, Agropyron, Agrostis, Alopecurus, Apera, Avena, Brachiaria, Bromus, Cenchrus, Commelina, Cynodon, Cyperus, Dactyloctenium, Digitaria, Echinochloa, Eleocharis, Eleusine, Eragrostis,

Eriochloa, Festuca, Fimbristylis, Heteranthera, Imperata, Ischaemum, Leptochloa, Lolium, Monochoria, Panicum, Paspalum, Phalaris, Phleum, Poa, Rottboellia, Sagittaria, Scirpus, Setaria и Sorghum.

Двудольные вредные растения родов: Abutilon, Amaranthus, Ambrosia, Anoda, Anthemis, Aphanes, Artemisia, Atriplex, Bellis, Bidens, Capsella, Carduus, Cassia, Centaurea, Chenopodium, Cirsium, Convolvulus, Datura, Desmodium, Emex, Erysimum, Euphorbia, Galeopsis, Galinsoga, Galium, Hibiscus, Ipomoea, Kochia, Lamium, Lepidium, Lindernia, Matricaria, Mentha, Mercurialis, Mullugo, Myosotis, Papaver, Pharbitis, Plantago, Polygonum, Portulaca, Ranunculus, Raphanus, Rorippa, Rotala, Rumex, Salsola, Senecio, Sesbania, Sida, Sinapis, Solanum, Sonchus, Sphenoclea, Stellaria, Taraxacum, Thlaspi, Trifolium, Urtica, Veronica, Viola и Xanthium.

Если соединения согласно изобретению применяют на поверхность почвы перед прорастанием, либо появление сеянцев сорняков полностью предотвращается, либо сорняки растут до тех пор, пока они не достигнут стадии семядоли, но затем они перестанут расти и в конечном итоге полностью исчезнут по прошествии трех-четырех недель.

Если активные компоненты наносят после появления всходов на зеленые части растений, рост прекращается после обработки, а вредные растения остаются на стадии роста в момент времени применения или полностью умирают через определенное время, так что, таким образом, борьба за существование сорняков, которые вредны для сельскохозяйственных культур, устраняется очень рано и поддерживается.

Хотя соединения согласно изобретению обладают исключительной гербицидной активностью против однодольных и двудольных сорняков, культурные растения экономически важных культур, например двудольных культур родов *Arachis*, *Beta*, *Brassica*, *Cucumis*, *Cucurbita*, *Helianthus*, *Daucus*, *Glycine*, *Gossypium*, *Ipomoea*, *Lactuca*, *Linum*, *Lycopersicon*, *Nicotiana*, *Phaseolus*, *Pisum*, *Solanum*, *Vicia* или однодольных культур родов *Allium*, *Ananas*, *Asparagus*, *Avena*, *Hordeum*, *Oryza*, *Panicum*, *Saccharum*, *Secale*, *Sorghum*, *Triticale*, *Triticum*, *Zea*, в частности *Zea* и *Triticum*, будут повреждены в незначительной степени, если вообще, в зависимости от структуры конкретного соединения согласно изобретению и нормы его применения. По этим причинам настоящие соединения очень подходят для селективной борьбы с ростом нежелательных растений в сельскохозяйственных культурах, таких как сельскохозяйственные полезные растения или декоративные растения.

Кроме того, соединения согласно изобретению (в зависимости от их конкретной структуры и нормы применения) имеют превосходные регулирующие рост свойства для сельскохозяйственных растений. Они вмешиваются в метаболизм растений с регулирующим эффектом и могут, таким образом, применяться для контролируемого воздействия растительных компонентов и для облегчения сбора урожая, например путем высушивания и замедления роста. Кроме того, они также пригодны для общей борьбы и ингибирования нежелательного вегетативного роста без уничтожения растений в процессе. Ингибирование вегетативного роста играет важную роль для многих одно- и двудольных культур, поскольку, например, это может уменьшить или полностью предотвратить полегание.

В силу своих гербицидных и регулирующих рост растений свойств активные компоненты могут также использоваться для борьбы с вредными растениями в культурах генетически модифицированных растений или растений, модифицированных обычным мутагенезом. В целом, трансгенные растения характеризуются особыми выгодными свойствами, например устойчивостью к определенным пестицидам, в частности некоторым гербицидам, устойчивостью к болезням растений или патогенам болезней растений, таким как некоторые насекомые или микроорганизмы, такие как грибы, бактерии или вирусы. Другие особые свойства относятся, например, к собранному материалу в отношении количества, качества, хранения, состава и конкретных составляющих. Например, известны известные трансгенные растения с повышенным содержанием крахмала, или измененным качеством крахмала, или с другими жирными кислотами в собранном материале.

Предпочтительно в отношении трансгенных культур, применять соединения согласно изобретению в экономически важных трансгенных культурах полезных растений и декоративных растений, например таких злаковых культурах, как пшеница, ячмень, рожь, овес, просо/сорго, рис и кукуруза или других культурах сахарной свеклы, хлопка, сои, рапса, картофеля, томатов, гороха и других видов овощей. Предпочтительно применять соединения согласно изобретению в качестве гербицидов в культурах полезных растений, которые устойчивы или были устойчивы рекомбинантными средствами к фитотоксическому влиянию гербицидов.

Предпочтительно применять соединения согласно изобретению в экономически важных трансгенных культурах полезных растений и декоративных растений, например зерновых, таких как пшеница, ячмень, рожь, овес, просо/сорго, рис, маниока и кукуруза или других культурах сахарной свеклы, хлопка, сои, рапса, картофеля, томатов, гороха и других овощей. Предпочтительно соединения согласно изобретению могут быть применены в качестве гербицидов в культурах полезных растений, которые устойчивы или были устойчивы к генной инженерии, к фитотоксическому влиянию гербицидов.

Обычные способы получения новых растений, которые имеют модифицированные свойства по сравнению с существующими растениями, состоят, например, в традиционных методиках культивирования и в получении мутантов. Альтернативным образом новые растения с модифицированными свойствами могут быть получены с помощью рекомбинантных методик (см., например, EP-A-0221044, EP-A-0131624). Например, есть описания нескольких случаев:

генетические модификации сельскохозяйственных культур с целью модификации крахмала, синтезированного в растениях (например, WO 92/11376, WO 92/14827, WO 91/19806),

трансгенные культурные растения, устойчивые к определенным гербицидам типа глюфосината (см., например, EP-A-0242236, EP-A-242246), или типа глюфосата (WO 92/00377), или типа сульфонилмочевины (EP-A-0257993, US-A-5013659),

трансгенные культурные растения, например хлопок, способные вырабатывать токсины *Bacillus thuringiensis* (токсины Bt), которые делают растения устойчивыми к определенным вредителям (EP-A-0142924, EP-A-0193259),

трансгенные культурные растения с модифицированной композицией жирных кислот (WO 91/13972),

генетически модифицированные культурные растения с новыми компонентами или вторичными метаболитами, например новыми фитоалексинами, которые вызывают повышенную устойчивость к болезням (EP-A-309862, EP-A-0464461),

генетически модифицированные растения со сниженным фотодыханием, которые имеют более высокие урожаи и более высокую устойчивость к стрессу (EP-A-0305398),

трансгенные культурные растения, которые вырабатывают фармацевтически или диагностически важные белки ("молекулярный фарминг"),

трансгенные культурные растения, которые имеют более высокие урожаи или более высокое качество,

трансгенные культурные растения, которые имеют комбинации, например, вышеупомянутых новых свойств ("пирамидирование генов").

В принципе, известно большое количество молекулярно-биологических методик, с помощью которых можно генерировать новые трансгенные растения с модифицированными свойствами; см., например, I. Potrykus and G. Spangenberg (eds.) *Gene Transfer to Plants*, Springer Lab Manual (1995), Springer Verlag Berlin, Heidelberg, или Christou, "Trends in Plant Science" 1 (1996) 423-431).

Для таких рекомбинантных манипуляций молекулы нуклеиновой кислоты, которые допускают мутагенез или изменение последовательности путем рекомбинации последовательностей ДНК, могут быть введены в плазмиды. С помощью стандартных методик можно, например, проводить основные обмены, удалять части последовательностей или добавлять природные или синтетические последовательности. Для соединения фрагментов ДНК друг с другом к фрагментам могут быть добавлены адаптеры или линкеры; см., например, Sambrook et al., 1989, *Molecular Cloning*, A Laboratory Manual, 2nd ed. Cold Spring Harbor Laboratory Press, Cold Spring Harbor, NY, или Winnacker "Gene und Klone", VCH Weinheim 2nd edition 1996.

Например, генерация растительных клеток с пониженной активностью генного продукта может быть достигнута путем экспрессии по меньшей мере одной соответствующей антисмысловой РНК, смысловой РНК для достижения эффекта косупрессии или путем экспрессии по меньшей мере одного подходящего сконструированного рибозима, который специфически расщепляет транскрипты указанного выше генного продукта. С этой целью сначала можно использовать молекулы ДНК, которые охватывают всю кодирующую последовательность генных продуктов, включая любые фланкирующие последовательности, которые могут присутствовать, а также молекулы ДНК, которые охватывают только части кодирующей последовательности, и в этом случае необходимо, чтобы эти части были достаточно длинными, чтобы иметь антисмысловой эффект в клетках. Также возможно использовать последовательности ДНК, которые имеют высокую степень гомологии с кодирующими последовательностями генных продуктов, но не полностью идентичны им.

При экспрессии молекул нуклеиновой кислоты в растениях синтезируемый белок может быть локализован в любой желаемой части растительной клетки. Однако для достижения локализации в определенной части можно, например, присоединить кодирующую область к последовательностям ДНК, которые обеспечивают локализацию в определенной части. Такие последовательности известны специалистам в данной области (см., например, Braun et al., *EMBO J.* 11 (1992), 3219-3227, Wolter et al., *Proc. Natl. Acad. Sci. USA* 85 (1988), 846-850, Sonnewald et al., *Plant J.* 1 (1991), 95-106). Молекулы нуклеиновой кислоты также могут быть экспрессированы в органеллах растительных клеток.

Трансгенные растительные клетки могут быть регенерированы известными методиками, чтобы вызвать появление целых растений. В принципе, трансгенные растения могут быть растениями любых желательных видов растений, то есть не только однодольными, но и двудольными растениями.

Таким образом, могут быть получены трансгенные растения, свойства которых изменяются сверхэкспрессией, подавлением или ингибированием гомологичных (=естественных) генов или последовательностей генов или экспрессии гетерологичных (=чужеродных) генов или последовательностей генов.

Соединения согласно изобретению могут быть использованы с предпочтением в трансгенных культурах, которые устойчивы к регуляторам роста, например дикамба, или к гербицидам, которые ингибируют основные ферменты растений, например ацетолактатсинтазы (ALS), EPSP-синтазы, глутаминсинтазы (GS) или гидроксифенилпируватдиоксигеназы (HPPD), или к гербицидам из группы сульфонилмочевин, глифосатов, глюфосинатов или бензоилизоксазолов и аналогичных активных компонентов.

Когда активные компоненты согласно изобретению применяются в трансгенных культурах, имеет место не только воздействие на вредные растения, наблюдаемое в других культурах, но также часто и эффекты, характерные для применения в конкретной трансгенной культуре, например, измененный или специфически расширенный спектр сорняков, с которыми можно бороться, измененные нормы применения, которые могут быть использованы для применения, предпочтительно хорошая сочетаемость с гербицидами, к которым устойчивы трансгенные культуры, и влияние на рост и урожай трансгенных культурных растений.

Следовательно, изобретение также предусматривает применение соединений согласно изобретению в качестве гербицидов для борьбы с вредными растениями в трансгенных культурных растениях.

По сравнению с соответствующими кислотами соединения согласно изобретению имеют более высокую растворимость в воде и, следовательно, более предпочтительные свойства композиции. Они очень подходят для приготовления композиций на водной основе.

Соединения согласно изобретению могут быть применены в виде смачиваемых порошков, эмульгируемых концентратов, распыляемых растворов, пылевидных продуктов или гранул в обычных композициях. Таким образом, изобретение также обеспечивает гербицидные и регулирующие рост композиции, которые содержат соединения согласно изобретению.

Соединения согласно изобретению могут быть сформулированы различными способами в соответ-

ствии с требуемыми биологическими и/или физико-химическими параметрами. Возможные композиции включают, например, смачиваемые порошки (WP), водорастворимые порошки (SP), водорастворимые концентраты, эмульгируемые концентраты (EC), эмульсии (EW), такие как эмульсии масло-в-воде и вода-в-масле, распыляемые растворы, суспензионные концентраты (SC), дисперсии на основе масла или воды, смешиваемые с маслом растворы, капсульные суспензии (CS), пылеподобные продукты (DP), продукты для протравливания, гранулы для рассеивания и внесения в почву, гранулы (GR) в форме микрогранул, гранулы для распыления, абсорбционные и адсорбционные гранулы, диспергируемые в воде гранулы (WG), водорастворимые гранулы (SG), ULV-композиции, микрокапсулы и воски.

Эти отдельные типы композиций в принципе известны и описаны, например, в: Winnacker-Küchler, "Chemische Technologie", volume 7, C. Hanser Verlag München, 4th ed. 1986, Wade van Valkenburg, "Pesticide Formulations", Marcel Dekker, N.Y., 1973, K. Martens, "Spray Drying" Handbook, 3rd Ed. 1979, G. Goodwin Ltd. London.

Необходимые вспомогательные вещества для композиции, такие как инертные материалы, поверхностно-активные вещества, растворители и другие добавки, также известны и описаны, например, в: Watkins, "Handbook of Insecticide Dust Diluents и Carriers", 2nd Ed., Darland Books, Caldwell N.J., H.v. Olphen, "Introduction to Clay Colloid Chemistry", 2nd Ed., J. Wiley & Sons, N.Y., C. Marsden, "Solvents Guide", 2nd Ed., Interscience, N.Y. 1963, McCutcheon's "Detergents и Emulsifiers Annual", MC Publ. Corp., Ridge-wood N.J., Sisley и Wood, "Encyclopedia of Surface Active Agents", Chem. Publ. Co. Inc., N.Y. 1964, Schoönfeldt, "Grenzflächenaktive Äthylenoxidaddukte", Wiss. Verlagsgesell., Stuttgart 1976, Winnacker-Küchler, "Chemische Technologie", volume 7, C. Hanser Verlag München, 4th ed. 1986.

На основе этих композиций также возможно производить комбинации с другими пестицидно активными веществами, например инсектицидами, акарицидами, гербицидами, фунгицидами, а также с защитными веществами, удобрениями и/или регуляторами роста, например в форме готовой композиции или баковой смеси. Подходящими защитными веществами являются, например, мефенпир-диэтил, ципросульфамид, изоксадифен-этил, клокинтоцет-мексил и дихлормид.

Смачиваемые порошки представляют собой препараты, которые могут быть равномерно диспергированы в воде и, кроме активного компонента, помимо разбавителя или инертного вещества, также включают поверхностно-активные вещества из ионного и/или неионного типа (смачивающие агенты, диспергаторы), например полиэтил-алкилфенолы, полиэтоксифирированные жирные спирты, полиэтоксифирированные жирные амины, сульфаты полигликолевых эфиров жирных спиртов, алкансульфонаты, алкилбензолсульфонаты, лигносульфонат натрия, 2,2'-динафтилметан-6,6'-дисульфат натрия, дибутил-нафталинсульфонат натрия или другой олеилметилтаурат натрия. Для получения смачиваемых порошков активные гербицидные компоненты тонко измельчают, например в обычных аппаратах, таких как молотковые мельницы, мельницы воздушодувки и воздушно-струйные мельницы, и одновременно или последовательно смешивают с вспомогательными веществами для композиции.

Эмульгируемые концентраты получают путем растворения активного компонента в органическом растворителе, например, бутаноле, циклогексаноне, диметилформамиде, ксилоле или других ароматических соединениях с высокой температурой кипения, или углеводородах, или смесях органических растворителей с добавлением одного или нескольких ионных и/или неионных поверхностно-активных веществ (эмульгаторы). Примерами эмульгаторов, которые могут быть использованы, являются алкиларилсульфонаты кальция, такие как додецилбензолсульфонат кальция, или неионные эмульгаторы, такие как сложные эфиры полигликолей жирных кислот, простые эфиры алкиларил-полигликолей, простые полигликолевые эфиры жирных спиртов, продукты конденсации оксид-этиленов пропилен, алкилполиэфиры, сложные эфиры сорбитана, например сложные эфиры сорбита жирных кислот или сложные эфиры полиоксиэтилтенсорбитана, например сложные эфиры полиоксиэтил-сорбитановых жирных кислот.

Пылеподобные продукты получают путем измельчения активного компонента с мелкодисперсными твердыми веществами, например тальком, природными глинами, такими как каолин, бентонит и пиррофиллит или диатомовая земля.

Концентраты суспензии могут быть на основе воды или масла. Они могут быть приготовлены, например, путем мокрого измельчения с помощью коммерческих шаровых мельниц и необязательного добавления поверхностно-активных веществ, которые, например, уже были указаны выше для других типов препаратов.

Эмульсии, например эмульсии типа "масло-в-воде" (EW), могут быть получены, например, с помощью мешалок, коллоидных мельниц и/или статических смесителей с использованием водных органических растворителей и необязательно поверхностно-активных веществ, как уже указано выше, например, для других типов препаратов.

Гранулы могут быть получены либо путем распыления активного компонента на адсорбирующий гранулированный инертный материал, либо путем применения концентратов активного компонента на поверхность носителей, таких как песок, каолиниты или гранулированный инертный материал, с помощью адгезивов, например поливинилового спирта, полиакрилата натрия или других минеральных масел. Пригодные активные компоненты также могут быть гранулированы обычным способом для получения гранул удобрений, при желании в виде смеси с удобрениями.

Гранулы, диспергируемые в воде, обычно получают обычными способами, такими как распылительная сушка, гранулирование в псевдооживленном слое, в лотковом грануляторе, смешивание с высокоскоростными смесителями и экструзия без твердого инертного материала.

Для получения гранул из лоткового гранулятора, гранул из псевдооживленного слоя, гранул из экструдера и гранул через распыление см., например, методики в "Spray-Drying Handbook" 3rd ed. 1979, G. Goodwin Ltd., London, J.E. Browning, "Agglomeration", Chemical and Engineering 1967, pages 147 ff, "Perry's Chemical Engineer's Handbook", 5th Ed., McGraw-Hill, New York 1973, S. 8-57.

Более подробную информацию о разработке композиций для защиты растений см., например, G.C. Klingman, "Weed Control as a Science", John Wiley и Sons, Inc., New York, 1961, pages 81-96 и J.D. Freyer, S.A. Evans, "Weed Control Handbook", 5th Ed., Blackwell Scientific Publications, Oxford, 1968, pages 101-103.

Агрохимические препараты содержат обычно от 0,1 до 99 мас.%, особенно от 0,1 до 95 мас.% соединений согласно изобретению.

В смачиваемых порошках концентрация активного компонента составляет, например, от 10 до 90 мас.%, остаток до 100 мас.%, состоящий из обычных составляющих композиции. В эмульгируемых концентратах концентрация активного компонента может составлять от 1 до 90% и предпочтительно от 5 до 80% по массе. Пылеподобные композиции содержат от 1 до 30 мас.% активного компонента, предпочтительно обычно от 5 до 20 мас.% активного компонента; распыляемые растворы содержат от примерно 0,05 до 80, предпочтительно от 2 до 50 мас.% активного компонента. В случае вододиспергируемых гранул содержание активного компонента частично зависит от того, находится ли активный компонент в жидкой или твердой форме и какие вспомогательные вещества для грануляции, наполнители и т.д. используют. В вододиспергируемых гранулах содержание активного компонента составляет, например, от 1 до 95, предпочтительно от 10 до 80 мас.%.

Кроме того, упомянутые композиции активного компонента необязательно содержат соответствующие обычные клеящие вещества, смачиватели, диспергаторы, эмульгаторы, пенетранты, консерванты, антифризы и растворители, наполнители, носители и красители, пеногасители, ингибиторы испарения и агенты, которые влияют на pH и вязкость.

На основе этих композиций также возможно получать комбинации с другими пестицидно-активными веществами, например инсектицидами, акарицидами, гербицидами, фунгицидами, а также с защитными веществами, удобрениями и/или регуляторами роста, например в форме готового препарата или баковой смеси.

Для применения композиции в коммерческой форме при необходимости разбавляются обычным образом, например в случае смачиваемых порошков, эмульгируемых концентратов, дисперсий и вододиспергируемых гранул с водой. Пылеподобные составы, гранулы для применения на грунт или гранулы для рассеивания и распыляемые растворы обычно не разбавляются другими инертными веществами до применения.

Требуемая норма применения соединений формулы (I) зависит от внешних условий, включая температуру, влажность и тип используемого гербицида. Она может варьироваться в широких пределах, например между 0,001 и 1,0 кг/га или больше активного вещества, но предпочтительно составляет от 0,005 до 750 г/га.

Приведенные ниже примеры иллюстрируют изобретение.

А. Химические примеры.

Получение натриевой соли 2-метил-N-(5-метил-1,3,4-оксадиазол-2-ил)-3-(метилсульфонил)-4-(трифторметил)бензамида (№ 1-14).

К раствору 200 мг (0,55 ммоль) 2-метил-N-(5-метил-1,3,4-оксадиазол-2-ил)-3-(метилсульфонил)-4-(трифторметил)бензамида в 5 мл метанола добавляли при комнатной температуре (к.т.) 0,101 мл (0,55 ммоль) 30%-го раствора метоксида натрия в метаноле. После перемешивания при к.т. в течение 8 ч смесь концентрировали. Остаток дважды смешивали с 5 мл абс. толуола и концентрировали досуха.

Выход: 0,21 г (0,55 ммоль; 99%).

¹H-ЯМР (ДМСО-d₆, 400 МГц): 7,79 (d, 1H), 7,67 (d, 1H), 3,34 (s, 3H); 2,71 (s, 3H), 2,28 (s, 3H).

Получение бета-гидроксиэтилтриметиламмониевой соли 2-хлор-N-(5-метил-1,3,4-оксадиазол-2-ил)-3-(метилсульфинил)-4-(трифторметил)бензамида (№ 1-153).

К раствору 100 мг (0,272 ммоль) 2-хлор-N-(5-метил-1,3,4-оксадиазол-2-ил)-3-(метилсульфинил)-4-(трифторметил)бензамида в 2,5 мл метанола добавляли при к.т. раствор 0,077 мл (0,272 ммоль) 45%-го раствора гидроксида бета-гидроксиэтилтриметиламмония. После перемешивания при к.т. в течение 8 ч смесь концентрировали. Остаток дважды смешивали с 5 мл толуола и концентрировали досуха.

Выход: 0,12 г (0,25 ммоль; 94%).

¹H-ЯМР (ДМСО-d₆, 400 МГц): 7,74 (d, 1H), 7,65 (d, 1H), 4,06 (bs, 2H); 3,72 (bs, 2H); 3,28 (s, 9H); 3,11 (s, 3H); 2,38 (s, 3H).

Примеры, перечисленные в приведенных ниже таблицах, были приготовлены аналогичным образом с вышеупомянутыми методиками или получены аналогичным образом с вышеупомянутыми методиками. Соединения, перечисленные в таблицах ниже, являются особенно предпочтительными. Особенно пред-

почтительными являются соли N-(1,3,4-оксадиазол-2-ил)бензамида формулы (I), в которых

A представляет собой C_Y,

R представляет собой метил,

X представляет собой метил,

Y представляет собой метилсульфонил,

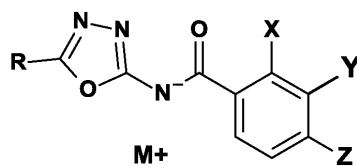
Z представляет собой трифторметил,

M⁺ представляет собой катион, выбранный из группы, которая состоит из иона натрия, иона калия, иона NH₄⁺, иона N-(2-гидроксиэт-1-ил)-трис-N,N,N-метиламмония, иона тетраметиламмония, иона тетрапропиламмония, иона тетраоктиламмония, иона триметилбензиламмония.

Используемые здесь аббревиатуры обозначают:

Ac	=	ацетил	Bn	=	бензил	Bu	=	n-бутил
c-Pr	=	c-пропил	Et	=	этил	Me	=	метил
n-Oct	=	n-октил	Pr	=	n-пропил			

Таблица 1. Соединения общей формулы (I) где А представляет собой СУ



№	R	X	Y	Z	M ⁺	Физические данные (¹ H ЯМР, DMSO-d ₆ , 400 мГц)
1-1	Me	Cl	H	SO ₂ Me	Na ⁺	
1-2	Me	SO ₂ Me	H	CF ₃	Na ⁺	
1-3	Me	SO ₂ Me	H	CF ₃	Pr ₄ N ⁺	
1-4	Me	SO ₂ Me	H	CF ₃	Me ₃ N(CH ₂ C H ₂ OH) ⁺	
1-5	Me	SMe	SMe	CF ₃	Na ⁺	
1-6	Me	SMe	SOMe	CF ₃	Na ⁺	
1-7	Me	SMe	SO ₂ Me	CF ₃	Na ⁺	
1-8	Me	Me	SMe	CF ₃	Na ⁺	
1-9	Me	Me	SMe	C ₂ F ₅	Na ⁺	
1-10	c-Pr	Me	SMe	CF ₃	Na ⁺	
1-11	Me	Me	SOMe	CF ₃	Na ⁺	
1-12	Me	Me	SOMe	CF ₃	Me ₃ N(CH ₂ C H ₂ OH) ⁺	
1-13	Et	Me	SOMe	CF ₃	Na ⁺	
1-14	Me	Me	SO ₂ Me	CF ₃	Na ⁺	7.79 (d, 1H), 7.67 (d, 1H), 3.34 (s; 3H); 2.71 (s, 3H), 2.28 (s, 3H)
1-15	Me	Me	SO ₂ Me	CF ₃	Li ⁺	7.83 (d, 1H), 7.74 (d, 1H), 3.34 (s; 3H); 2.72 (s, 3H), 2.33 (s, 3H)
1-16	Me	Me	SO ₂ Me	CF ₃	K ⁺	7.78 (d, 1H), 7.66 (d, 1H), 3.36 (s; 3H); 2.71 (s, 3H), 2.28 (s, 3H)
1-17	Me	Me	SO ₂ Me	CF ₃	Mg ²⁺	
1-18	Me	Me	SO ₂ Me	CF ₃	Ca ²⁺	
1-19	Me	Me	SO ₂ Me	CF ₃	Me ₃ S ⁺	
1-20	Me	Me	SO ₂ Me	CF ₃	Et ₃ S ⁺	
1-21	Me	Me	SO ₂ Me	CF ₃	Me ₄ N ⁺	7.77 (d, 1H), 7.63 (d, 1H), 3.33 (s; 3H); 3.10 (s, 12H), 2.70 (s, 3H), 2.27 (s, 3H)
1-22	Me	Me	SO ₂ Me	CF ₃	Et ₄ N ⁺	7.81 (d, 1H), 7.69 (d, 1H), 3.34 (s; 3H); 3.20 (q, 8H), 2.70 (s, 3H), 2.30 (s, 3H), 1.15 (t, 12H)
1-23	Me	Me	SO ₂ Me	CF ₃	Bu ₄ N ⁺	
1-24	Me	Me	SO ₂ Me	CF ₃	i-Pr ₄ N ⁺	
1-25	Me	Me	SO ₂ Me	CF ₃	Et ₃ N(Bn) ⁺	7.67 (d, 1H), 7.61 (d, 1H), 7.49- 7.38 (m, 5H); 4.57 (s, 2H); 3.30 (q, 6H), 3.18 (s, 3H); 2.84 (s, 3H); 2.38 (s, 3H); 1.41 (t, 9H)
1-26				CF ₃	Pr ₄ N ⁺	7.77 (d, 1H), 7.70

	Me	Me	SO ₂ Me			(d,1H), 3.24-3.19 (m, 11H); 2.90 (s,3H); 2.39 (s, 3H); 1.71-1.65 (m, 8H); 0.96 (t, 12H)
1-27	Me	Me	SO ₂ Me	CF ₃	Me ₃ N(CH ₂ CH ₂ OH) ⁺	7.73 (2d, 2H), 4.00 (bs, 2H); 3.64 – 3.62 (m, 2H); 3.27 (s, 9H); 3.20 (s, 3H), 2.82 (s, 3H); 2.38 (s, 3H);)
1-28	Me	Me	SO ₂ Me	CF ₃	Me ₃ N(Bn) ⁺	7.71 (2d, 2H), 7.50-7.45 (m, 5H); 4.71 (s, 2H); 3.24 (s,9H), 3.20 (s,3H); 2.79 (s, 3H); 2.43 (s, 3H)
1-29	Me	Me	SO ₂ Me	CF ₃	n-Oct ₄ N ⁺	7.76 (d,1H), 7.69 (d,1H), 3.27-3.22 (m, 8H); 3.18 (s, 3H); 2.37 (s, 3H); 1.62 (m, 8H); 1.30-1.25 (m, 40H); 0.88 (t, 12H)
1-30	Me	Me	SOMe	C ₂ F ₅	Na ⁺	
1-31	MeOCH ₂	Me	SO ₂ Me	CF ₃	Na ⁺	
1-32	MeOCH ₂	Me	SO ₂ Me	CF ₃	Me ₃ N(CH ₂ CH ₂ OH) ⁺	
1-33	Pr	Me	SO ₂ Me	CF ₃	Na ⁺	
1-34	MeO(CH ₂) ₂ -	Me	SO ₂ Me	CF ₃	Na ⁺	
1-35	Me	Me	SEt	CF ₃	Na ⁺	
1-36	Et	Me	SEt	CF ₃	Na ⁺	
1-37	Me	Me	SOEt	CF ₃	Na ⁺	
1-38	Me	Me	SOEt	CHF ₂	Na ⁺	
1-39	Me	Me	SO ₂ Et	CF ₃	Na ⁺	
1-40	Et	Me	SO ₂ Et	CF ₃	Na ⁺	
1-41	Me	Me	SO ₂ Et	CHF ₂	Na ⁺	
1-42	Me	Me	1H-пиразол-1-ил	CF ₃	Na ⁺	
1-43	Me	Me	1H-пиразол-1-ил	CF ₃	Me ₃ N(CH ₂ CH ₂ OH) ⁺	
1-44	Me	Me	1H-пиразол-1-ил	C ₂ F ₅	Na ⁺	
1-45	Me	Me	4-CF ₃ -1H-пиразол-1-ил	CF ₃	Na ⁺	
1-46	Me	Me	4-Ме-1H-пиразол-1-ил	CF ₃	Na ⁺	
1-47	Me	Me	2H-1,2,3-триазол-2-ил	CF ₃	Na ⁺	
1-48	Me	Me	2H-1,2,3-триазол-	C ₂ F ₅	Na ⁺	

			2-ил			
1-49	Me	Me	1H-1,2,3-триазол-1-ил	CF ₃	Na ⁺	
1-50	Me	Me	1H-1,2,3-триазол-1-ил	C ₂ F ₅	Na ⁺	
1-51	Me	Me	1H-1,2,4-триазол-1-ил	CF ₃	Na ⁺	
1-52	Me	Me	1H-1,2,4-триазол-1-ил	C ₂ F ₅	Na ⁺	
1-53	Me	Me	SMe	CN	Na ⁺	
1-54	Me	Me	SOMe	CN	Na ⁺	
1-55	Me	Me	SO ₂ Me	CN	Na ⁺	
1-56	Me	Me	SMe	Cl	Na ⁺	
1-57	Me	Me	SOMe	Cl	Na ⁺	
1-58	Me	Me	SO ₂ Me	Cl	Na ⁺	
1-59	Me	Me	SEt	Cl	Na ⁺	
1-60	Me	Me	SOEt	Cl	Na ⁺	
1-61	Et	Me	SOEt	Cl	Na ⁺	
1-62	Me	Me	SO ₂ Et	Cl	Na ⁺	
1-63	Me	Me	SMe	Br	Na ⁺	
1-64	Me	Me	SEt	Br	Na ⁺	
1-65	Me	Me	Ac	SO ₂ Me	Na ⁺	
1-66	Me	Me	(CO)-с-Pr	SO ₂ Me	Na ⁺	
1-67	Me	Me	C(=NOMe)Me	SO ₂ Me	Na ⁺	
1-68	Me	Me	C(=NOEt)Me	SO ₂ Me	Na ⁺	
1-69	Me	Me	5-с-Pr-изоксазол-3-ил	SO ₂ Me	Na ⁺	
1-70	Me	Me	5-метоксиметил-1,2-оксазол-3-ил	SO ₂ Me	Na ⁺	
1-71	Me	Me	3-метил-4,5-дигидро-1,2-оксазол-5-ил	SO ₂ Me	Na ⁺	
1-72	Me	Me	4,5-дигидро-1,2-оксазол-3-ил	SO ₂ Me	Na ⁺	
1-73	Et	Me	4,5-дигидро-1,2-оксазол-3-ил	SO ₂ Me	Na ⁺	
1-74	Me	Me	пиразол-1-ил	SO ₂ Me	Na ⁺	
1-75	MeOCH ₂	Me	пиразол-1-ил	SO ₂ Me	Na ⁺	
1-76	Me	Me	4-CF ₃ -1H-пиразол-1-ил	SO ₂ Me	Na ⁺	
1-77	Me	Me	4-Cl-1H-пиразол-1-ил	SO ₂ Me	Na ⁺	8.29 (s, 1H), 7.92 (s, 1H), 7.90 (d, 1H), 7.82 (d, 1H), 3.09 (s, 3H), 2.50 (s, 3H), 2.30 (s, 3H)
1-78	Me	Me	OMe	SO ₂ Me	Na ⁺	
1-79	Me	Me	SMe	SO ₂ Me	Na ⁺	
1-80	Me	Me	SOMe	SO ₂ Me	Na ⁺	
1-81	Me	Me	SO ₂ Me	SO ₂ Me	Na ⁺	
1-82	Et	Me	SO ₂ Me	SO ₂ Me	Na ⁺	
1-83	Me	Me	SEt	SO ₂ Me	Na ⁺	
1-84	Me	Me	SOEt	SO ₂ Me	Na ⁺	

1-85	Me	Me	SO ₂ Et	SO ₂ Me	Na ⁺	
1-86	Me	Me	SO ₂ Et	SO ₂ Et	Na ⁺	
1-87	Et	Me	SO ₂ Et	SO ₂ Me	Na ⁺	
1-88	Me	Me	SCH ₂ CH ₂ OMe	SO ₂ Me	Na ⁺	
1-89	Me	Me	SOCH ₂ CH ₂ OMe	SO ₂ Me	Na ⁺	
1-90	Me	Me	SO ₂ CH ₂ CH ₂ OMe	SO ₂ Me	Na ⁺	
1-91	Me	Et	SMe	CF ₃	Na ⁺	
1-92	Me	Et	SOMe	CF ₃	Na ⁺	
1-93	Me	Et	SO ₂ Me	CF ₃	Na ⁺	
1-94	Me	Et	SEt	CF ₃	Na ⁺	
1-95	Me	Et	SOEt	CF ₃	Na ⁺	
1-96	Me	Et	SO ₂ Et	CF ₃	Na ⁺	
1-97	Me	Et	SMe	Cl	Na ⁺	
1-98	Et	Et	SMe	Cl	Na ⁺	
1-99	Me	Et	SOMe	Cl	Na ⁺	
1-100	Me	Et	SEt	Cl	Na ⁺	
1-101	Me	Et	SOEt	Cl	Na ⁺	
1-102	Me	Et	SO ₂ Et	Cl	Na ⁺	
1-103	Me	Et	SMe	Br	Na ⁺	
1-104	Me	Et	SO ₂ Me	Br	Na ⁺	
1-105	Me	Pr	SMe	CF ₃	Na ⁺	
1-106	Me	Pr	SOMe	CF ₃	Na ⁺	
1-107	Me	c-Pr	SMe	CF ₃	Na ⁺	
1-108	Me	c-Pr	SOMe	CF ₃	Na ⁺	
1-109	Me	c-Pr	SO ₂ Me	CF ₃	Na ⁺	
1-110	Me	CH ₂ OMe	SMe	CF ₃	Na ⁺	
1-111	Me	CH ₂ OMe	SOMe	CF ₃	Na ⁺	
1-112	Me	CH ₂ OMe	SO ₂ Me	CF ₃	Na ⁺	
1-113	Me	CH ₂ OMe	SEt	CF ₃	Na ⁺	
1-114	Me	CH ₂ OMe	SOEt	CF ₃	Na ⁺	
1-115	Me	CH ₂ OMe	SO ₂ Et	CF ₃	Na ⁺	
1-116	Me	CH ₂ OMe	SMe	SO ₂ Me	Na ⁺	
1-117	Me	CH ₂ OMe	SOMe	SO ₂ Me	Na ⁺	
1-118	Me	CH ₂ OMe	SO ₂ Me	SO ₂ Me	Na ⁺	
1-119	Me	OMe	SMe	CF ₃	Na ⁺	
1-120	Me	OMe	SMe	CF ₃	Me ₃ N(CH ₂ C H ₂ OH) ⁺	
1-121	Me	OMe	SOMe	CF ₃	Na ⁺	
1-122	Me	OMe	SOMe	CF ₃	Me ₃ N(CH ₂ C H ₂ OH) ⁺	
1-123	Me	OMe	SO ₂ Me	CF ₃	Na ⁺	
1-124	Me	OMe	SO ₂ Me	CF ₃	Me ₃ N(CH ₂ C H ₂ OH) ⁺	
1-125	Me	OMe	SMe	CHF ₂	Na ⁺	
1-126	Me	OMe	SMe	CHF ₂	Pr ₄ N ⁺	
1-127	Me	OMe	SMe	CHF ₂	Me ₃ N(CH ₂ C H ₂ OH) ⁺	
1-128	Et	OMe	SMe	CHF ₂	Na ⁺	
1-129	Et	OMe	SMe	CHF ₂	Pr ₄ N ⁺	
1-130	Et	OMe	SMe	CHF ₂	Me ₃ N(CH ₂ C H ₂ OH) ⁺	
1-131	Me	OMe	SOMe	CHF ₂	Na ⁺	
1-132	Me	OMe	SOMe	CHF ₂	Pr ₄ N ⁺	

1-133	Me	OMe	SOMe	CHF ₂	Me ₃ N(CH ₂ C H ₂ OH) ⁺	
1-134	Et	OMe	SOMe	CHF ₂	Na ⁺	
1-135	Et	OMe	SOMe	CHF ₂	Pr ₄ N ⁺	
1-136	Et	OMe	SOMe	CHF ₂	Me ₃ N(CH ₂ C H ₂ OH) ⁺	
1-137	Me	OMe	SO ₂ Me	CHF ₂	Na ⁺	
1-138	Me	OMe	SO ₂ Me	CHF ₂	Pr ₄ N ⁺	
1-139	Me	OMe	SO ₂ Me	CHF ₂	Me ₃ N(CH ₂ C H ₂ OH) ⁺	
1-140	Et	OMe	SO ₂ Me	CHF ₂	Na ⁺	
1-141	Et	OMe	SO ₂ Me	CHF ₂	Pr ₄ N ⁺	
1-142	Et	OMe	SO ₂ Me	CHF ₂	Me ₃ N(CH ₂ C H ₂ OH) ⁺	
1-143	Me	OMe	SEt	CF ₃	Na ⁺	
1-144	Me	OMe	SOEt	CF ₃	Na ⁺	
1-145	Me	OMe	SO ₂ Et	CF ₃	Na ⁺	
1-146	Me	Cl	SMe	H	Na ⁺	
1-147	Me	Cl	SO ₂ Me	Me	Na ⁺	
1-148	Me	Cl	SO ₂ Et	Me	Na ⁺	
1-149	Me	Cl	SMe	CF ₃	Na ⁺	
1-150	Me	Cl	SOMe	CF ₃	Na ⁺	7.80 (d,1H), 7.64 (d,1H), 3.10 (s, 3H), 2.28 (s, 3H)
1-151	Me	Cl	SOMe	CF ₃	Et ₃ N(Bn) ⁺	7.68 (d,1H), 7.53 (d,1H), 7.47-7.41 (m, 5H); 4.65 (s, 2H); 3.35 (q, 6H), 3.09 (s, 3H); 2.38 (s, 3H); 1.43 (t, 9H)
1-152	Me	Cl	SOMe	Cl	Pr ₄ N ⁺	7.75 (d, 1H), 7.63 (d, 1H), 3.27-3.23 (m, 8H); 3.10 (s, 3H); 2.39 (s, 3H); 1.73-1.67 (m, 8H); 0.95 (t, 12H)
1-153	Me	Cl	SOMe	Cl	Me ₃ N(CH ₂ C H ₂ OH) ⁺	B7.74 (d, 1H), 7.65 (d, 1H), 4.06 (bs, 2H); 3.72 (bs, 2H); 3.28 (s, 9H); 3.11 (s, 3H); 2.38 (s, 3H)
1-154	Me	Cl	SOMe	Cl	Me ₃ N(Bn) ⁺	7.74 (d,1H), 6.65 (d,1H), 7.50-7.45 (m, 5H); 4.73 (s, 2H); 3.26 (s,9H), 3.10 (s,3H); 2.41 (s, 3H)

1-155	Me	Cl	SOMe	Cl	n-Oct ₄ N ⁺	7.75 (d,1H), 7.62 (d,1H), 3.29-3.25 (m, 8H); 3.09 (s,3H); 2.37 (s, 3H); 1.64 (m, 8H); 1.28-1.24 (m, 48H); 0.87 (t, 12H)
1-156	Me	Cl	SOMe	CF ₃	Et ₃ N(Bn) ⁺	7.68 (d,1H), 7.53 (d,1H), 7.47-7.41 (m, 5H); 4.65 (s, 2H); 3.35 (q,6H), 3.09 (s,3H); 2.38 (s, 3H); 1.43 (t, 9H)
1-157	Me	Cl	SOMe	CF ₃	Li ⁺	7.84 (d,1H), 7.71 (d,1H), 3.11 (s,3H), 2.33 (s,3H)
1-158	Me	Cl	SOMe	CF ₃	K ⁺	7.82 (d,1H), 7.68 (d,1H), 3.10 (s,3H), 2.30 (s,3H)
1-159	Me	Cl	SOMe	CF ₃	Mg ²⁺	
1-160	Me	Cl	SOMe	CF ₃	Ca ²⁺	
1-161	Me	Cl	SOMe	CF ₃	Me ₃ S ⁺	
1-162	Me	Cl	SOMe	CF ₃	Et ₃ S ⁺	
1-163	Me	Cl	SOMe	CF ₃	Me ₄ N ⁺	7.78 (d,1H), 7.61 (d,1H), 3.10 (s, 12H), 3.09 (s,3H), 2.26 (s,3H)
1-164	Me	Cl	SOMe	CF ₃	Et ₄ N ⁺	7.83 (d,1H), 7.69 (d,1H), 3.20 (q, 8H), 3.10 (s,3H), 1.15 (t, 12H)
1-165	Me	Cl	SOMe	CF ₃	Bu ₄ N ⁺	
1-166	Me	Cl	SOMe	CF ₃	i-Pr ₄ N ⁺	
1-167	Me	Cl	SO ₂ Me	CF ₃	Na ⁺	7.94 (d,1H), 7.76 (d,1H), 3.49 (s,3H), 2.28 (s,3H)
1-168	Me	Cl	SO ₂ Me	CF ₃	Me ₃ N(CH ₂ C H ₂ OH) ⁺	
1-169	Me	Cl	SO ₂ Me	CF ₃	Et ₄ N ⁺	7.91 (d,1H), 7.73 (d,1H), 3.47 (s,3H), 3.19 (q, 8H), 2.28 (s,3H), 1.16 (t, 12H)
1-170	c-Pr	Cl	SO ₂ Me	CF ₃	Na ⁺	7.93 (d,1H), 7.75 (d,1H), 3.50 (s,3H), 2.00 – 1.96 (m, 1H), 0.99-0.94 (m,

						2H), 0.84-0.80 (m, 2H)
1-171	c-Pr	Cl	SO ₂ Me	CF ₃	Pr ₄ N ⁺	
1-172	Me	Cl	SO ₂ Me	c-Pr	Na ⁺	
1-173	Me	Cl	SO ₂ Et	CF ₃	Na ⁺	
1-174	Me	Cl	SOEt	c-Pr	Na ⁺	7.41 (d, 1H), 6.92 (d, 1H), 3.41-3.19 (m, 2H), 2.28 (s, 3H), 1.24 (t, 3H), 1.08-0.98 (m, 3H), 0.64-0.57 (m, 1H)
1-175	Me	Cl	SO ₂ Et	c-Pr	Na ⁺	
1-176	Me	Cl	SCH ₂ -c-Pr	c-Pr	Na ⁺	
1-177	Me	Cl	SOCH ₂ -c-Pr	c-Pr	Na ⁺	
1-178	Me	Cl	SO ₂ CH ₂ -c-Pr	c-Pr	Na ⁺	
1-179	Me	Cl	S(CH ₂) ₂ OMe	c-Pr	Na ⁺	
1-180	Me	Cl	SO(CH ₂) ₂ OMe	c-Pr	Na ⁺	
1-181	Me	Cl	SO ₂ (CH ₂) ₂ OMe	c-Pr	Na ⁺	
1-182	Me	Cl	1H-пиразол-1-ил	CF ₃	Na ⁺	7.96 (d, 1H), 7.82 (d, 1H), 7.75 (d, 1H), 7.74 (d, 1H), 6.51 (dd, 1H), 3.32 (s, 3H), 2.28 (s, 3H)
1-183	Me	Cl	1H-пиразол-1-ил	CF ₃	Me ₃ N(CH ₂ CH ₂ OH) ⁺	
1-184	Me	Cl	1H-пиразол-1-ил	C ₂ F ₅	Na ⁺	
1-185	Me	Cl	4-CF ₃ -1H-пиразол-1-ил	CF ₃	Na ⁺	
1-186	Me	Cl	4-Me-1H-пиразол-1-ил	CF ₃	Na ⁺	
1-187	Me	Cl	2H-1,2,3-триазол-2-ил	CF ₃	Na ⁺	
1-188	Me	Cl	2H-1,2,3-триазол-2-ил	C ₂ F ₅	Na ⁺	
1-189	Me	Cl	1H-1,2,3-триазол-1-ил	CF ₃	Na ⁺	
1-190	Me	Cl	1H-1,2,3-триазол-1-ил	C ₂ F ₅	Na ⁺	
1-191	Me	Cl	1H-1,2,4-триазол-1-ил	CF ₃	Na ⁺	
1-192	Me	Cl	1H-1,2,4-триазол-1-ил	C ₂ F ₅	Na ⁺	
1-193	Me	Cl	1H-пиразол-1-ил	SO ₂ Me	Na ⁺	
1-194	Me	Cl	1H-пиразол-1-ил	SO ₂ Me	Me ₃ N(CH ₂ CH ₂ OH) ⁺	
1-195	Me	Cl	2-Br-1H-пиразол-1-ил	SO ₂ Me	Na ⁺	
1-196	Me	Cl	4-CF ₃ -1H-пиразол-1-ил	SO ₂ Me	Na ⁺	
1-197	Me	Cl	4-Me-1H-пиразол-1-ил	SO ₂ Me	Na ⁺	

1-198	Me	Cl	2H-1,2,3-триазол-2-ил	SO ₂ Me	Na ⁺	
1-199	Me	Cl	1H-1,2,4-триазол-1-ил	SO ₂ Me	Na ⁺	
1-200	Me	Cl	1H-1,2,3-триазол-1-ил	SO ₂ Me	Na ⁺	
1-201	Me	Cl	OCH ₂ CH ₂ OMe	Cl	Na ⁺	
1-202	Me	Cl	SMe	Cl	Na ⁺	
1-203	Et	Cl	SMe	Cl	Na ⁺	
1-204	Me	Cl	SOMe	Cl	Na ⁺	
1-205	Et	Cl	SOMe	Cl	Na ⁺	
1-206	Me	Cl	SO ₂ Me	Cl	Na ⁺	
1-207	Et	Cl	SO ₂ Me	Cl	Na ⁺	
1-208	Me	Cl	SEt	Cl	Na ⁺	
1-209	Me	Cl	SOEt	Cl	Na ⁺	
1-210	Me	Cl	SO ₂ Et	Cl	Na ⁺	
1-211	Me	Cl	SCH ₂ CH ₂ OMe	SO ₂ Me	Na ⁺	
1-212	Me	Cl	SOCH ₂ CH ₂ OMe	SO ₂ Me	Na ⁺	
1-213	Me	Cl	SO ₂ CH ₂ CH ₂ OMe	SO ₂ Me	Na ⁺	
1-214	Me	Cl	CH ₂ OMe	SO ₂ Me	Na ⁺	
1-215	Me	Cl	CH ₂ OMe	SO ₂ Me	K ⁺	
1-216	Me	Cl	CH ₂ OMe	SO ₂ Me	Pr ₄ N ⁺	
1-217	Me	Cl	CH ₂ OMe	SO ₂ Me	Me ₃ N(CH ₂ C H ₂ OH) ⁺	
1-218	Me	Cl	CH ₂ OCH ₂ CF ₃	SO ₂ Me	Na ⁺	
1-219	Et	Cl	CH ₂ OCH ₂ CF ₃	SO ₂ Me	Na ⁺	
1-220	Me	Cl	CH ₂ OCH ₂ CH ₂ OMe	SO ₂ Me	Na ⁺	
1-221	Me	Cl	Ac	SO ₂ Me	Na ⁺	
1-222	Me	Cl	(CO)-с-Pr	SO ₂ Me	Na ⁺	
1-223	Me	Cl	C(=NOMe)Me	SO ₂ Me	Na ⁺	
1-224	Me	Cl	C(=NOEt)Me	SO ₂ Me	Na ⁺	
1-225	Me	Cl	5-с-Pr-изоксазол-3-ил	SO ₂ Me	Na ⁺	
1-226	Me	Cl	5-метоксиметил-1,2-оксазол-3-ил	SO ₂ Me	Na ⁺	
1-227	Me	Cl	3-метил-4,5-дигидро-1,2-оксазол-5-ил	SO ₂ Me	Na ⁺	
1-228	Me	Cl	4,5-дигидро-1,2-оксазол-3-ил	SO ₂ Me	Na ⁺	
1-229	Me	Cl	2H-1,2,3-триазол-2-ил	SO ₂ Me	Na ⁺	
1-230	Me	Cl	2H-1,2,3-триазол-2-ил	SO ₂ Me	Me ₃ N(CH ₂ C H ₂ OH) ⁺	
1-231	Me	Cl	4,5-дигидро-1,2-оксазол-3-ил	SO ₂ Et	Na ⁺	
1-232	Me	Cl	5-цианометил-4,5-дигидро-1,2-оксазол-3-ил	SO ₂ Et	Na ⁺	
1-233	Me	Cl	5-цианометил-4,5-дигидро-1,2-оксазол-3-ил	SO ₂ Et	Pr ₄ N ⁺	
1-234	Me	Cl	5-цианометил-4,5-дигидро-1,2-	SO ₂ Et	Me ₃ N(CH ₂ C H ₂ OH) ⁺	

			оксазол-3-ил			
1-235	Me	Cl	5-цианометил-4,5-дигидро-1,2-оксазол-3-ил	SO ₂ Et	Li ⁺	
1-236	Me	Cl	5-цианометил-4,5-дигидро-1,2-оксазол-3-ил	SO ₂ Et	K ⁺	
1-237	Me	Cl	5-цианометил-4,5-дигидро-1,2-оксазол-3-ил	SO ₂ Et	Mg ²⁺	
1-238	Me	Cl	5-цианометил-4,5-дигидро-1,2-оксазол-3-ил	SO ₂ Et	Ca ²⁺	
1-239	Me	Cl	5-цианометил-4,5-дигидро-1,2-оксазол-3-ил	SO ₂ Et	Me ₃ S ⁺	
1-240	Me	Cl	5-цианометил-4,5-дигидро-1,2-оксазол-3-ил	SO ₂ Et	Et ₃ S ⁺	
1-241	Me	Cl	5-цианометил-4,5-дигидро-1,2-оксазол-3-ил	SO ₂ Et	Me ₄ N ⁺	
1-242	Me	Cl	5-цианометил-4,5-дигидро-1,2-оксазол-3-ил	SO ₂ Et	Et ₄ N ⁺	
1-243	Et	Cl	5-метоксиметил-4,5-дигидро-1,2-оксазол-3-ил	SO ₂ Et	Na ⁺	7.88 (d, 1H), 7.71 (d, 1H), 5.02-4.89 (m, 1H), 3.60-3.31 (m, 9H); 3.11-3.01 (m, 1H); 1.18 (t, 3H), 1.09 (t, 3H)
1-244	Et	Cl	5-метоксиметил-4,5-дигидро-1,2-оксазол-3-ил	SO ₂ Et	Et ₄ N ⁺	7.86 (d, 1H), 7.67 (d, 1H), 5.01-4.89 (m, 1H), 3.59-3.23 (m, 9H); 3.22-3.17 (m, 8H), 3.11-3.01 (m, 1H); 1.20-1.09 (m, 18H)
1-245	Me	Cl	OMe	SO ₂ Me	Na ⁺	
1-246	Me	Cl	OMe	SO ₂ Et		
1-247	Me	Cl	OEt	SO ₂ Me	Na ⁺	7.75 (d, 1H), 7.40 (d, 1H), 4.19 (q, 2H), 3.32 (s, 3H), 2.32 (s, 3H), 1.41 (t, 3H)
1-248	Me	Cl	OEt	SO ₂ Et	Na ⁺	
1-249	Me	Cl	OPr	SO ₂ Me	Na ⁺	
1-250	Me	Cl	OPr	SO ₂ Et	Na ⁺	
1-251	Me	Cl	O-CHF ₂	SO ₂ Me	Na ⁺	
1-252	Me	Cl	о-пропаргил	SO ₂ Me	Na ⁺	

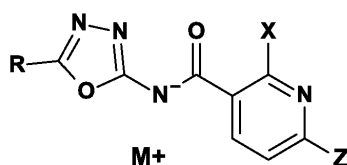
1-253	Me	Cl	OCH ₂ c-Pr	SO ₂ Me	Na ⁺	
1-254	Me	Cl	OCH ₂ c-Pr	SO ₂ Et	Na ⁺	7.68 (d, 1H), 7.35 (d, 1H), 3.98-3.91 (m, 2H), 3.51-3.44 (m, 2H), 2.28 (s, 3H), 1.38 – 1.35 (m, 1H), 1.10 (t, 3H), 0.63-0.59 (m, 2H), 0.43-0.39 (m, 2H)
1-255	Me	Cl	O(CH ₂) ₂ Cl	SO ₂ Me	Na ⁺	
1-256	Me	Cl	O(CH ₂) ₂ F	SO ₂ Me	Na ⁺	
1-257	Me	Cl	OCH ₂ CF ₃	SO ₂ Et	Na ⁺	
1-258	Me	Cl	O(CH ₂) ₃ OMe	SO ₂ Me	Na ⁺	7.70 (d, 1H), 7.35 (d, 1H), 4.19 (t, 2H), 3.54 (t, 2H), 3.27 (s, 3H), 2.28 (s, 3H), 2.10 – 2.05 (m, 2H)
1-259	Me	Cl	OCH ₂ -1,3-диоксолан-2-ил	SO ₂ Me	Na ⁺	
1-260	Me	Cl	SMe	SO ₂ Me	Na ⁺	
1-261	Me	Cl	SOMe	SO ₂ Me	Na ⁺	
1-262	Me	Cl	SO ₂ Me	SO ₂ Me	Na ⁺	
1-263	Me	Cl	SEt	SO ₂ Me	Na ⁺	
1-264	Me	Cl	SOEt	SO ₂ Me	Na ⁺	
1-265	Me	Cl	SO ₂ Et	SO ₂ Me	Na ⁺	
1-266	Me	Cl	SCH ₂ CH ₂ OMe	SO ₂ Me	Na ⁺	
1-267	Me	Cl	SOCH ₂ CH ₂ OMe	SO ₂ Me	Na ⁺	
1-268	Me	Cl	SO ₂ CH ₂ CH ₂ OMe	SO ₂ Me	Na ⁺	
1-269	Me	Br	1H-пиразол-1-ил	CF ₃	Na ⁺	
1-270	Me	Br	1H-пиразол-1-ил	C ₂ F ₅	Na ⁺	
1-271	Me	Br	2H-1,2,3-триазол-2-ил	CF ₃	Na ⁺	
1-272	Me	Br	2H-1,2,3-триазол-2-ил	C ₂ F ₅	Na ⁺	
1-273	Me	Br	1H-1,2,3-триазол-1-ил	CF ₃	Na ⁺	
1-274	Me	Br	1H-1,2,3-триазол-1-ил	C ₂ F ₅	Na ⁺	
1-275	Me	Br	1H-1,2,4-триазол-1-ил	CF ₃	Na ⁺	
1-276	Me	Br	1H-1,2,4-триазол-1-ил	C ₂ F ₅	Na ⁺	
1-277	Me	Me	SMe	Me	Na ⁺	
1-278	Me	Me	SOMe	Me	Na ⁺	
1-279	Me	Me	SO ₂ Me	Me	Na ⁺	
1-280	Me	Me	SEt	Me	Na ⁺	
1-281	Me	Me	SOEt	Me	Na ⁺	
1-282	Me	Me	SO ₂ Et	Me	Na ⁺	
1-283	Me	Me	S-c-Pr	Me	Na ⁺	
1-284	Me	Me	SO-c-Pr	Me	Na ⁺	

1-285	Me	Me	SO ₂ -c-Pr	Me	Na ⁺	
1-286	Me	Me	SCH ₂ -c-Pr	Me	Na ⁺	
1-287	Me	Me	SOCH ₂ -c-Pr	Me	Na ⁺	
1-288	Me	Me	SO ₂ CH ₂ -c-Pr	Me	Na ⁺	
1-289	Me	Me	SCH ₂ CH ₂ OMe	Me	Na ⁺	
1-290	Me	Me	SOCH ₂ CH ₂ OMe	Me	Na ⁺	
1-291	Me	Me	SO ₂ CH ₂ CH ₂ OMe	Me	Na ⁺	
1-292	Me	Me	SMe	Et	Na ⁺	
1-293	Me	Me	SOMe	Et	Na ⁺	
1-294	Me	Me	SO ₂ Me	Et	Na ⁺	
1-295	Me	Me	SEt	Et	Na ⁺	
1-296	Me	Me	SOEt	Et	Na ⁺	
1-297	Me	Me	SO ₂ Et	Et	Na ⁺	
1-298	Me	Me	S-c-Pr	Et	Na ⁺	
1-299	Me	Me	SO-c-Pr	Et	Na ⁺	
1-300	Me	Me	SO ₂ -c-Pr	Et	Na ⁺	
1-301	Me	Me	SCH ₂ -c-Pr	Et	Na ⁺	
1-302	Me	Me	SOCH ₂ -c-Pr	Et	Na ⁺	
1-303	Me	Me	SO ₂ CH ₂ -c-Pr	Et	Na ⁺	
1-304	Me	Me	SCH ₂ CH ₂ OMe	Et	Na ⁺	
1-305	Me	Me	SOCH ₂ CH ₂ OMe	Et	Na ⁺	
1-306	Me	Me	SO ₂ CH ₂ CH ₂ OMe	Et	Na ⁺	
1-307	Me	Me	SMe	i-Pr	Na ⁺	
1-308	Me	Me	SOMe	i-Pr	Na ⁺	
1-309	Me	Me	SO ₂ Me	i-Pr	Na ⁺	
1-310	Me	Me	SEt	i-Pr	Na ⁺	
1-311	Me	Me	SOEt	i-Pr	Na ⁺	
1-312	Me	Me	SO ₂ Et	i-Pr	Na ⁺	
1-313	Me	Me	S-c-Pr	i-Pr	Na ⁺	
1-314	Me	Me	SO-c-Pr	i-Pr	Na ⁺	
1-315	Me	Me	SO ₂ -c-Pr	i-Pr	Na ⁺	
1-316	Me	Me	SCH ₂ -c-Pr	i-Pr	Na ⁺	
1-317	Me	Me	SOCH ₂ -c-Pr	i-Pr	Na ⁺	
1-318	Me	Me	SO ₂ CH ₂ -c-Pr	i-Pr	Na ⁺	
1-319	Me	Me	SCH ₂ CH ₂ OMe	i-Pr	Na ⁺	
1-320	Me	Me	SOCH ₂ CH ₂ OMe	i-Pr	Na ⁺	
1-321	Me	Me	SO ₂ CH ₂ CH ₂ OMe	i-Pr	Na ⁺	
	Me					
	Me					
	Me					
1-322	Me	Et	SMe	Me	Na ⁺	
1-323	Me	Et	SOMe	Me	Na ⁺	
1-324	Me	Et	SO ₂ Me	Me	Na ⁺	
1-325	Me	Et	SEt	Me	Na ⁺	
1-326	Me	Et	SOEt	Me	Na ⁺	
1-327	Me	Et	SO ₂ Et	Me	Na ⁺	
1-328	Me	Et	S-c-Pr	Me	Na ⁺	
1-329	Me	Et	SO-c-Pr	Me	Na ⁺	
1-330	Me	Et	SO ₂ -c-Pr	Me	Na ⁺	
1-331	Me	Et	SCH ₂ -c-Pr	Me	Na ⁺	
1-332	Me	Et	SOCH ₂ -c-Pr	Me	Na ⁺	
1-333	Me	Et	SO ₂ CH ₂ -c-Pr	Me	Na ⁺	
1-334	Me	Et	SCH ₂ CH ₂ OMe	Me	Na ⁺	

1-335	Me	Et	SOCH ₂ CH ₂ OMe	Me	Na+	
1-336	Me	Et	SO ₂ CH ₂ CH ₂ OMe	Me	Na+	
1-337	Me	Et	SMe	Et	Na+	
1-338	Me	Et	SOMe	Et	Na+	
1-339	Me	Et	SO ₂ Me	Et	Na+	
1-340	Me	Et	SEt	Et	Na+	
1-341	Me	Et	SOEt	Et	Na+	
1-342	Me	Et	SO ₂ Et	Et	Na+	
1-343	Me	Et	S-c-Pr	Et	Na+	
1-344	Me	Et	SO-c-Pr	Et	Na+	
1-345	Me	Et	SO ₂ -c-Pr	Et	Na+	
1-346	Me	Et	SCH ₂ -c-Pr	Et	Na+	
1-347	Me	Et	SOCH ₂ -c-Pr	Et	Na+	
1-348	Me	Et	SO ₂ CH ₂ -c-Pr	Et	Na+	
1-349	Me	Et	SCH ₂ CH ₂ OMe	Et	Na+	
1-350	Me	Et	SOCH ₂ CH ₂ OMe	Et	Na+	
1-351	Me	Et	SO ₂ CH ₂ CH ₂ OMe	Et	Na+	
1-352	Me	Et	SMe	i-Pr	Na+	
1-353	Me	Et	SOMe	i-Pr	Na+	
1-354	Me	Et	SO ₂ Me	i-Pr	Na+	
1-355	Me	Et	SEt	i-Pr	Na+	
1-356	Me	Et	SOEt	i-Pr	Na+	
1-357	Me	Et	SO ₂ Et	i-Pr	Na+	
1-358	Me	Et	S-c-Pr	i-Pr	Na+	
1-359	Me	Et	SO-c-Pr	i-Pr	Na+	
1-360	Me	Et	SO ₂ -c-Pr	i-Pr	Na+	
1-361	Me	Et	SCH ₂ -c-Pr	i-Pr	Na+	
1-362	Me	Et	SOCH ₂ -c-Pr	i-Pr	Na+	
1-363	Me	Et	SO ₂ CH ₂ -c-Pr	i-Pr	Na+	
1-364	Me	Et	SCH ₂ CH ₂ OMe	i-Pr	Na+	
1-365	Me	Et	SOCH ₂ CH ₂ OMe	i-Pr	Na+	
1-366	Me	Et	SO ₂ CH ₂ CH ₂ OMe	i-Pr	Na+	
1-367	Me	c-Pr	SMe	Me	Na+	
1-368	Me	c-Pr	SOMe	Me	Na+	
1-369	Me	c-Pr	SO ₂ Me	Me	Na+	
1-370	Me	c-Pr	SEt	Me	Na+	
1-371	Me	c-Pr	SOEt	Me	Na+	
1-372	Me	c-Pr	SO ₂ Et	Me	Na+	
1-373	Me	c-Pr	S-c-Pr	Me	Na+	
1-374	Me	c-Pr	SO-c-Pr	Me	Na+	
1-375	Me	c-Pr	SO ₂ -c-Pr	Me	Na+	
1-376	Me	c-Pr	SCH ₂ -c-Pr	Me	Na+	
1-377	Me	c-Pr	SOCH ₂ -c-Pr	Me	Na+	
1-378	Me	c-Pr	SO ₂ CH ₂ -c-Pr	Me	Na+	
1-379	Me	c-Pr	SCH ₂ CH ₂ OMe	Me	Na+	
1-380	Me	c-Pr	SOCH ₂ CH ₂ OMe	Me	Na+	
1-381	Me	c-Pr	SO ₂ CH ₂ CH ₂ OMe	Me	Na+	
1-382	Me	c-Pr	SMe	Et	Na+	
1-383	Me	c-Pr	SOMe	Et	Na+	
1-384	Me	c-Pr	SO ₂ Me	Et	Na+	
1-385	Me	c-Pr	SEt	Et	Na+	
1-386	Me	c-Pr	SOEt	Et	Na+	
1-387	Me	c-Pr	SO ₂ Et	Et	Na+	

1-388	Me	c-Pr	S-c-Pr	Et	Na+	
1-389	Me	c-Pr	SO-c-Pr	Et	Na+	
1-390	Me	c-Pr	SO ₂ -c-Pr	Et	Na+	
1-391	Me	c-Pr	SCH ₂ -c-Pr	Et	Na+	
1-392	Me	c-Pr	SOCH ₂ -c-Pr	Et	Na+	
1-393	Me	c-Pr	SO ₂ CH ₂ -c-Pr	Et	Na+	
1-394	Me	c-Pr	SCH ₂ CH ₂ OMe	Et	Na+	
1-395	Me	c-Pr	SOCH ₂ CH ₂ OMe	Et	Na+	
1-396	Me	c-Pr	SO ₂ CH ₂ CH ₂ OMe	Et	Na+	
1-397	Me	c-Pr	SMe	i-Pr	Na+	
1-398	Me	c-Pr	SOMe	i-Pr	Na+	
1-399	Me	c-Pr	SO ₂ Me	i-Pr	Na+	
1-400	Me	c-Pr	SEt	i-Pr	Na+	
1-401	Me	c-Pr	SOEt	i-Pr	Na+	
1-402	Me	c-Pr	SO ₂ Et	i-Pr	Na+	
1-403	Me	c-Pr	S-c-Pr	i-Pr	Na+	
1-404	Me	c-Pr	SO-c-Pr	i-Pr	Na+	
1-405	Me	c-Pr	SO ₂ -c-Pr	i-Pr	Na+	
1-406	Me	c-Pr	SCH ₂ -c-Pr	i-Pr	Na+	
1-407	Me	c-Pr	SOCH ₂ -c-Pr	i-Pr	Na+	
1-408	Me	c-Pr	SO ₂ CH ₂ -c-Pr	i-Pr	Na+	
1-409	Me	c-Pr	SCH ₂ CH ₂ OMe	i-Pr	Na+	
1-410	Me	c-Pr	SOCH ₂ CH ₂ OMe	i-Pr	Na+	
1-411	Me	c-Pr	SO ₂ CH ₂ CH ₂ OMe	i-Pr	Na+	

Таблица 2. Соединения общей формулы (I) где А представляет собой N



№	R	X	Z	M ⁺	Физические данные (¹ H ЯМР, ДМСО-d ₆ , 400 МГц)
2-1	Me	Me	CF ₃	Na ⁺	8.16 (d, 1H), 7.68 (d, 1H), 3.18 (s, 3H), 2.33 (s, 3H)
2-2	Me	Me	CF ₃	Et ₃ N(Bn) ⁺	
2-3	Me	Me	CF ₃	Pr ₄ N ⁺	8.08 (d, 1H), 7.62 (d, 1H), 3.14-3.10 (m, 8H), 2.68 (s, 3H), 2.26 (s, 3H), 1.64-1.58 (m, 8H), 0.89 (t, 12H)
2-4	Me	Me	CF ₃	Me ₃ N(CH ₂ CH ₂ OH) ⁺	8.08 (d, 1H), 7.62 (d, 1H), 5.48 (bs, 1H), 3.85-3.82 (m, 2H), 3.41-3.38 (m, 2H), 3.10 (s, 12H), 2.68 (s, 3H), 2.27 (s, 3H)
2-5	Me	Me	CF ₃	Me ₃ N(Bn) ⁺	8.14 (d, 1H), 7.70 (d, 1H), 7.55-7.49 (m, 5H), 4.52 (s, 2H), 3.02 (s, 12H), 2.67 (s, 3H), 2.34 (s, 3H)

2-6	Me	Me	CF ₃	n-Oct ₄ N ⁺	8.08 (d,1H), 7.62 (d,1H), 3.17-3.13 (m, 8H), 2.68 (s,3H), 2.26 (s,3H), 1.62-1.49 (m, 8H), 1.32-1.18 (m, 40H), 0.86 (t, 12H)
2-7	Me	Me	CF ₃	Et ₃ N(Bn) ⁺	8.08 (d,1H), 7.61 (d,1H), 7.53-7.51 (m, 5H), 4.47 (s, 2H), 3.16 (q, 8H), 2.68 (s,3H), 2.26 (s,3H), 1.30 (t, 12H)
2-8	Me	Me	CF ₃	K ⁺	8.13 (d,1H), 7.68 (d,1H), 2.68 (s,3H), 2.33 (s,3H)
2-9	Me	Me	CF ₃	Li ⁺	8.26 (d,1H), 7.70 (d,1H), 2.75 (s,3H), 2.34 (s,3H)
2-10	Me	Me	CF ₃	Mg ²⁺	
2-11	Me	Me	CF ₃	Ca ²⁺	
2-12	Me	Me	CF ₃	Me ₃ S ⁺	
2-13	Me	Me	CF ₃	Et ₃ S ⁺	
2-14	Me	Me	CF ₃	Me ₄ N ⁺	8.20 (d,1H), 7.80 (d,1H), 3.10 (s,12H), 2.66 (s,3H), 2.42 (s, 3H)
2-15	Me	Me	CF ₃	Et ₄ N ⁺	8.13 (d,1H), 7.69 (d,1H), 3.20 (q, 8H), 2.67 (s,3H), 2.32 (s, 3H), 1.16 (t, 12H)
2-16	Me	Me	CF ₃	Bu ₄ N ⁺	
2-17	Me	Me	CF ₃	i-Pr ₄ N ⁺	
2-18	Me	Cl	CF ₃	Na ⁺	
2-19	Me	Cl	CF ₃	Pr ₄ N ⁺	
2-20	Me	Br	CF ₃	Na ⁺	
2-21	Me	CH ₂ OMe	CF ₃	Na ⁺	

Б. Примеры композиций.

а) Пылеподобный продукт получали путем смешивания 10 частей по массе соединения формулы (I) и/или его солей и 90 частей по массе талька в качестве инертного вещества и путем измельчения смеси в молотковой мельнице.

б) Легко диспергируемый в воде, смачиваемый порошок получали путем смешивания 25 частей по массе соединения формулы (I) и/или его солей, 64 частей по массе каолинсодержащего кварца в качестве инертного вещества, 10 частей по массе лигносульфоната калия и 1 части по массе олеилметилтаурата натрия в качестве смачивающего агента и диспергатора и путем измельчения смеси в мельнице с цилиндрическим диском.

в) Легко диспергируемый в воде дисперсионный концентрат получали путем смешивания 20 частей по массе соединения формулы (I) и/или его солей с 6 частями по массе полигликолевого эфира алкилфенола (@Triton X 207), 3 частей по массе изотридеканола полигликолевого эфира (8 EO) и 71 части по массе парафинового минерального масла (диапазон кипения, например, от 255 до 277°C) и путем измельчения смеси во фрикционной шаровой мельнице до величины менее 5 мкм.

г) Эмульгируемый концентрат получали из 15 частей по массе соединения формулы (I) и/или его солей, 75 частей по массе циклогексанона в качестве растворителя и 10 частей по массе этоксилированного нонилфенола в качестве эмульгатора.

д) Гранулы, диспергируемые в воде, получали путем смешивания

75 частей по массе соединения формулы (I) и/или его солей,

10 частей по массе лигносульфоната кальция,

5 частей по массе лаурилсульфата натрия,

3 частей по массе поливинилового спирта и

7 частей по массе каолина,

путем измельчения смеси в штифтовой дисковой мельнице и путем гранулирования порошка в псевдооживленном слое с помощью распыления воды в качестве гранулирующей жидкости.

е) Гранулы, диспергируемые в воде, также получали путем гомогенизации и измельчения в колло-

идной мельнице

25 частей по массе соединения формулы (I) и/или его солей,
5 частей по массе 2,2'-динафтилметан-6,6'-дисульфоната натрия,
2 частей по массе олеилметилтаурата натрия,
1 части по массе поливинилового спирта
17 частей по массе карбоната кальция и
50 частей по массе воды,

затем путем измельчения смеси в шаровой мельнице и распыления и сушения полученной суспензии в оросительной колонне с помощью однофазного сопла.

В. Биологические примеры.

1. Гербицидное действие против вредных растений до появления всходов.

Семена однодольных и двудольных сорняков и культурных растений выкладывали в супесь в древесно-волокнистых горшках, покрывали грунтом. Соединения согласно изобретению и, для сравнительных целей, наиболее структурно сходные соединения, известные из WO 2012/126932 A1, сформулированные в виде смачиваемых порошков (WP) или в виде эмульсионных концентратов (EC), затем применяли на поверхность грунта в виде водной суспензии или эмульсии при норме подачи воды, равной 600-800 л/га, с добавлением 0,2% смачивающего агента. После обработки горшки ставили в теплицу и держали в оптимальных условиях роста для испытуемых растений. Повреждение для испытуемых растений визуально оценивали по прошествии испытательного периода в 3 недели по сравнению с необработанными контролями (гербицидное действие в процентах (%): 100% активность = растения умерли, 0% активности = как контрольные растения). Испытуемые соединения согласно изобретению демонстрировали лучшую эффективность в отношении сорняков и одновременно лучшую совместимость, то есть меньшее повреждение для культурных растений. Сравнительные испытания были проведены в качестве примера на некоторых сорняках и культурных растениях.

Сокращения, используемые здесь:

ABUTH	Abutilon theophrasti	AMARE	Amaranthus
retroflexus			
POLCO	Polygonum convolvulus	STEME	Stellaria media
TRZAS	Triticum aestivum (пшеница)	ZEAMX	Zea mays
(кукуруза)			

Таблица V1

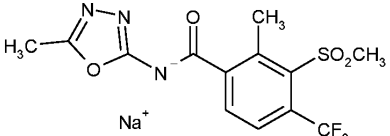
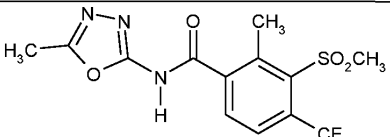
Соединение №	Норма [г/га]	Действие против ABUTH	Повреждение для TRZAS
 № 1-14, согласно изобретению	20	100%	0%
 № 2-145, из WO 2012/126932	20	70%	40%

Таблица V2

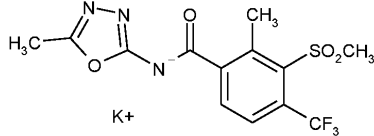
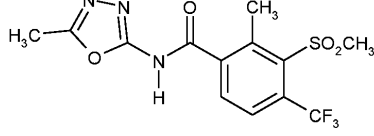
Соединение №	Норма [г/га]	Действие против STEME	Повреждение для TRZAS
 № 1-16, согласно изобретению	20	90%	0%
 № 2-145, из WO 2012/126932	20	70%	40%

Таблица V3

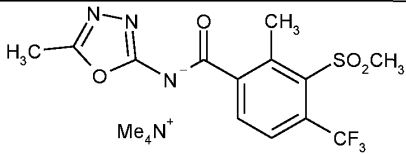
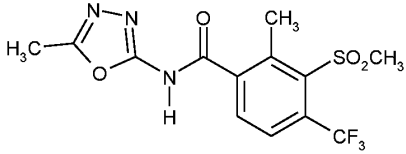
Соединение №	Норма [г/га]	Действие против STEME	Повреждение для TRZAS
 № 1-21, согласно изобретению	20	90%	0%
 № 2-145, из WO 2012/126932	20	70%	40%

Таблица V4

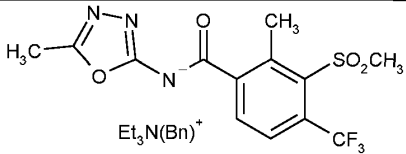
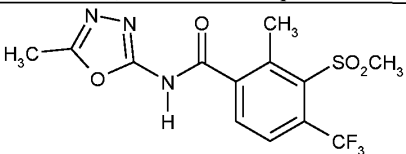
Соединение №	Норма [г/га]	Действие против ABUTH	Повреждение для TRZAS
 № 1-25, согласно изобретению	20	100%	0%
 № 2-145, из WO 2012/126932	20	70%	40%

Таблица V5

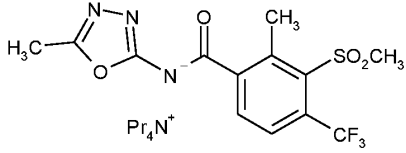
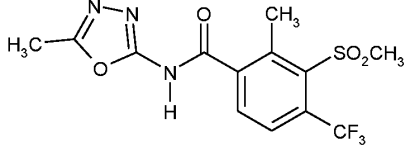
Соединение №	Норма [г/га]	Действие против ABUTH	Повреждение для TRZAS
 № 1-26, согласно изобретению	20	100%	0%
 № 2-145, из WO 2012/126932	20	70%	40%

Таблица V6

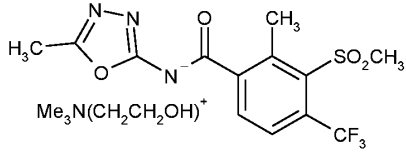
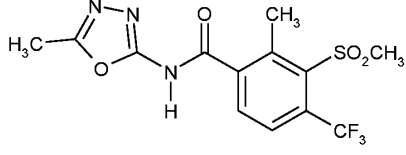
Соединение №	Норма [г/га]	Действие против ABUTH	Повреждение для TRZAS
 № 1-27, согласно изобретению	20	100%	0%
 № 2-145, из WO 2012/126932	20	70%	40%

Таблица V7

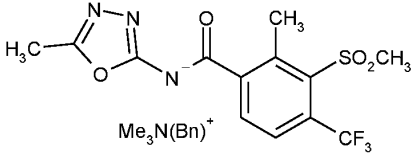
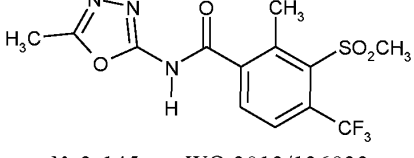
Соединение №	Норма [г/га]	Действие против ABUTH	Повреждение для TRZAS
 № 1-28, согласно изобретению	20	100%	0%
 № 2-145, из WO 2012/126932	20	70%	40%

Таблица V8

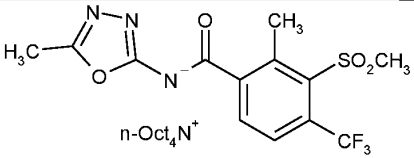
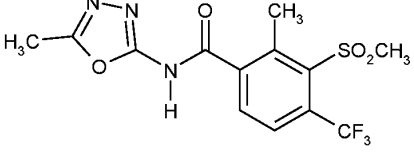
Соединение №	Норма [г/га]	Действие против ABUTH	Повреждение для TRZAS
 № 1-29, согласно изобретению	20	100%	0%
 № 2-145, из WO 2012/126932	20	70%	40%

Таблица V9

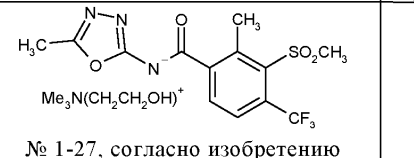
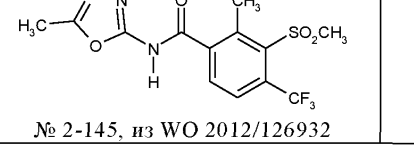
Соединение №	Норма [г/га]	Действие против			Повреждение для ZEAMX
		ALOMY	CYPES	ABUTH	
 № 1-27, согласно изобретению	20	70%	70%	100%	0%
 № 2-145, из WO 2012/126932	20	20%	40%	70%	0%

Таблица V10

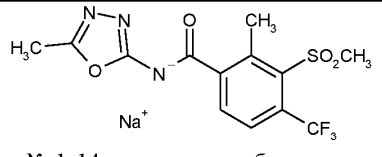
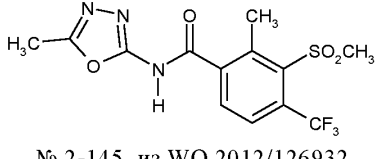
Соединение №	Норма [г/га]	Действие против			Повреждение для ZEAMX
		ALOMY	CYPES	ABUTH	
 № 1-14, согласно изобретению	20	60%	40%	100%	0%
 № 2-145, из WO 2012/126932	20	20%	40%	70%	0%

Таблица V11

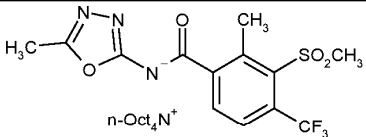
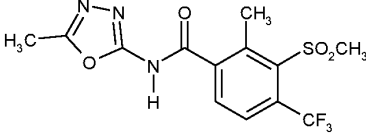
Соединение №	Норма [г/га]	Действие против			Повреждение для ZEAMX
		ALOMY	CYPES	ABUTH	
 n-Oct ₄ N ⁺ № 1-29, согласно изобретению	20	60%	60%	100%	0%
 № 1-29, согласно изобретению	20	20%	40%	70%	0%

Таблица V12

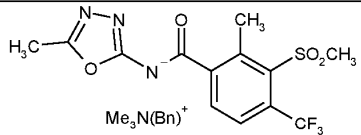
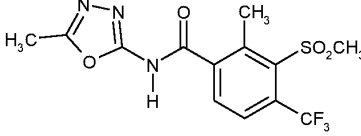
Соединение №	Норма [г/га]	Действие против			Повреждение для ZEAMX
		ALOMY	CYPES	ABUTH	
 Me ₃ N(Bn) ⁺ № 1-28, согласно изобретению	20	10%	70%	100%	10%
 № 2-145, из WO 2012/126932	20	20%	40%	70%	0%

Таблица V13

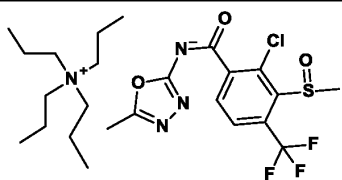
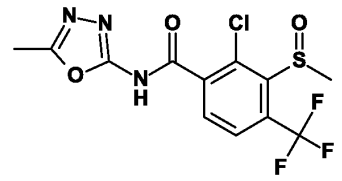
Соединение №	Норма [г/га]	Действие против			Повреждение для ZEAMX
		ALOMY	CYPES	ABUTH	
 № 1-152, согласно изобретению	20	0%	80%	90%	0%
 № 2-360, из WO 2012/126932	20	20%	60%	60%	0%

Таблица V14

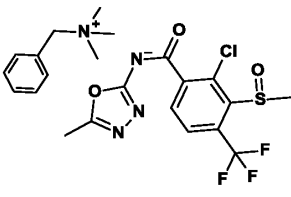
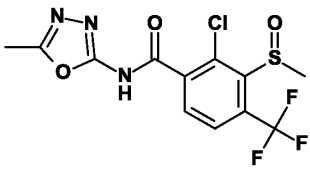
Соединение №	Норма [г/га]	Действие против			Повреждение для ZEAMX
		ALOMY	CYPES	ABUTH	
 № 1-154, согласно изобретению	20	60%	80%	90%	0%
 № 2-360, из WO 2012/126932	20	20%	60%	60%	0%

Таблица V15

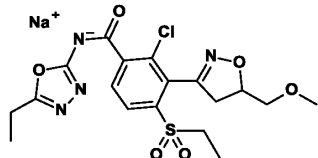
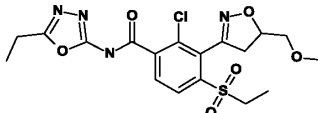
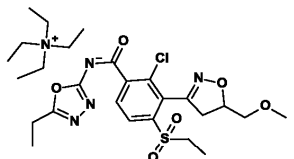
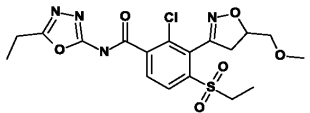
Соединение №	Норма [г/га]	Действие против			Повреждение для ZEAMX
		ALOMY	CYPES	ABUTH	
 № 1-243, согласно изобретению	320	30%	80%	90%	0%
 № 3-265, из WO 2012/126932	320	10%	80%	90%	0%

Таблица V16

Соединение №	Норма [г/га]	Действие против			Повреждение для ZEAMX
		ALOMY	CYPES	ABUTH	
 № 1-244, согласно изобретению	320	20%	100%	80%	10%
 № 3-265, из WO 2012/126932	320	10%	80	10%	0%

2. Гербицидное действие против вредных растений после появления всходов.

Семена однодольных и двудольных сорняков и культурных растений выкладывали в супесь в древесно-волокнистых горшках, покрытых почвой, и культивировали в теплице при хороших условиях роста. Через 2-3 недели после посева тестируемые растения обрабатывали на стадии одного листа. Соединения согласно изобретению и, для сравнительных целей, наиболее структурно сходные соединения, известные из WO 2012/126932 A1, сформулированные в виде смачиваемых порошков (WP) или в виде эмульсионных концентратов (EC), затем распыляли на зеленые части растений в виде водной суспензии или эмульсии при норме подачи воды, равной 600-800 л/га, с добавлением 0,2% смачивающего агента.

После того как испытуемые растения оставили стоять в теплице в оптимальных условиях роста в течение примерно 3 недель, действие композиций оценивали визуально по сравнению с необработанными контролями (гербицидное действие в процентах (%): 100% активность = растения умерли, 0% активности = как контрольные растения). Испытуемые соединения согласно изобретению демонстрировали лучшую эффективность в отношении сорняков и одновременно лучшую совместимость, то есть меньшее повреждение для культурных растений. Сравнительные испытания были проведены в качестве примера на некоторых сорняках и культурных растениях.

Таблица N1

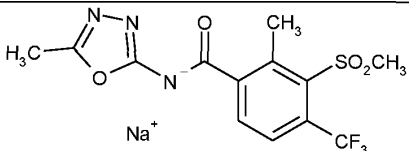
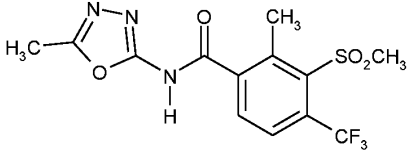
Соединение №	Норма [г/га]	Действие против AMARE	Повреждение для ZEAMX
 № 1-14, согласно изобретению	5	100%	0%
 № 2-145, из WO 2012/126932	5	80%	40%

Таблица N2

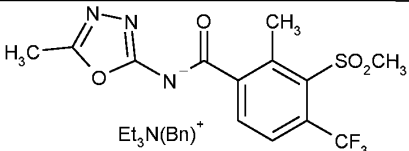
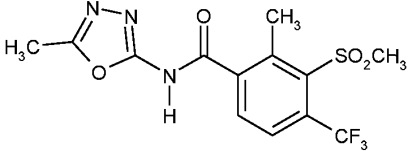
Соединение №	Норма [г/га]	Действие против AMARE	Повреждение для ZEAMX
 № 1-25, согласно изобретению	5	100%	0%
 № 2-145, из WO 2012/126932	5	80%	40%

Таблица N3

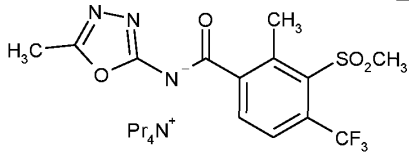
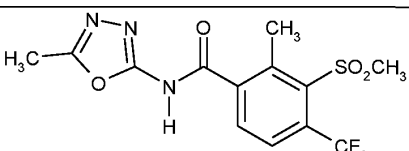
Соединение №	Норма [г/га]	Действие против AMARE	Повреждение для ZEAMX
 № 1-26, согласно изобретению	5	100%	0%
 № 2-145, из WO 2012/126932	5	80%	40%

Таблица N4

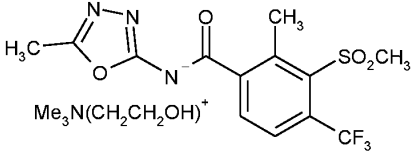
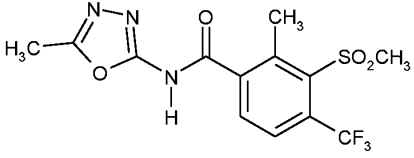
Соединение №	Норма [г/га]	Действие против AMARE	Повреждение для ZEAMX
 № 1-27, согласно изобретению	5	100%	0%
 № 2-145, из WO 2012/126932	5	80%	40%

Таблица N5

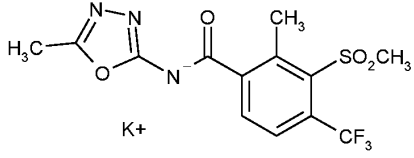
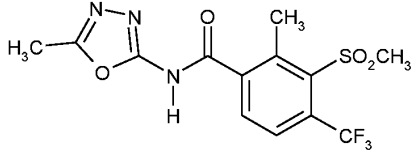
Соединение №	Норма [г/га]	Действие против POLCO	Повреждение для ZEAMX
 № 1-16, согласно изобретению	5	60%	0%
 № 2-145, из WO 2012/126932	5	40%	40%

Таблица N6

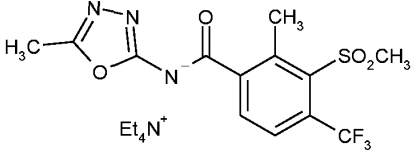
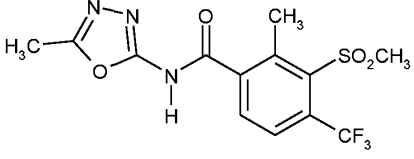
Соединение №	Норма [г/га]	Действие против POLCO	Повреждение для ZEAMX
 № 1-22, согласно изобретению	5	60%	0%
 № 2-145, из WO 2012/126932	5	40%	40%

Таблица N7

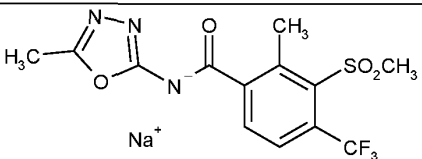
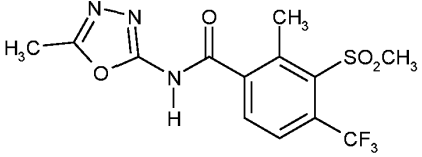
Соединение №	Норма [г/га]	Действие против		Повреждение для TRZAS
		ALOMY	VERPE	
 Na^+ № 1-14, согласно изобретению	5	80%	100%	0%
 № 2-145, из WO 2012/126932	5	60	60%	80%

Таблица N8

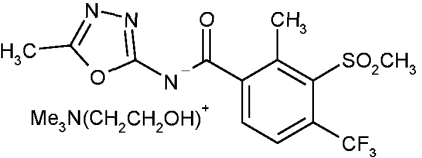
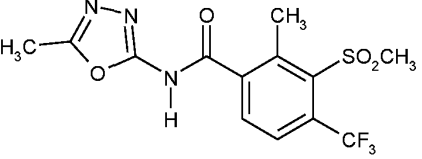
Соединение №	Норма [г/га]	Действие против		Повреждение для TRZAS
		ALOMY	VERPE	
 $\text{Me}_3\text{N}(\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OH})^+$ № 1-27, согласно изобретению	5	80%	90%	0%
 № 2-145, из WO 2012/126932	5	60%	60%	80%

Таблица N9

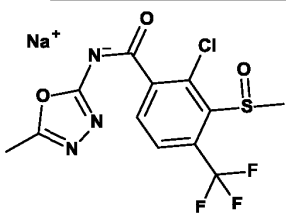
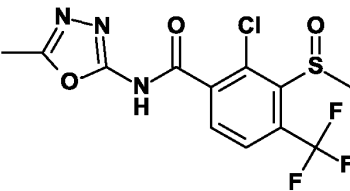
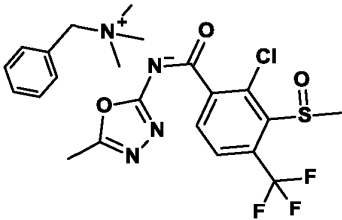
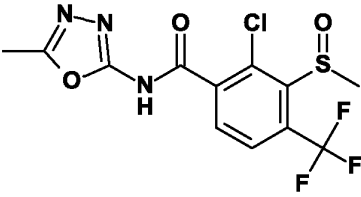
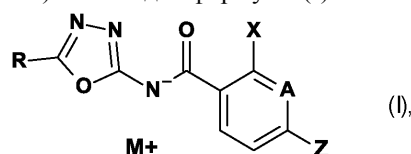
Соединение №	Норма [г/га]	Действие против		Повреждение для TRZAS
		ALOMY	VERPE	
 Na^+ № 1-150, согласно изобретению	5	80%	70%	0%
 № 2-360, из WO 2012/126932	5	60%	50%	30%

Таблица N10

Соединение №	Норма [г/га]	Действие против		Повреждение для TRZAS
		ALOMY	VERPE	
 № 1-154, согласно изобретению	5	80%	80%	0%
 № 2-360, из WO 2012/126932	5	60%	50%	30%

ФОРМУЛА ИЗОБРЕТЕНИЯ

1. Соли N-(1,3,4-оксадиазол-2-ил)бензамидов формулы (I)



где

A представляет собой N или CY,

R представляет собой (C₁-C₆)алкил, (C₃-C₇)циклоалкил или метоксиметил;

X представляет собой галоген, (C₁-C₆)алкил, галоген-(C₁-C₆)алкил, OR¹ или S(O)_nR²;

Y представляет собой (C₁-C₆)алкил, галоген-(C₁-C₆)алкил, OR¹ или S(O)_nR²;

Z представляет собой галоген, метил, галоген-(C₁-C₆)алкил или S(O)_nR²;

R¹ представляет собой водород, (C₁-C₆)алкил или (C₃-C₆)циклоалкил;

R² представляет собой (C₁-C₆)алкил;

n представляет собой 0, 1 или 2,

M⁺ представляет собой катион, выбранный из группы, состоящей из иона натрия, иона калия, иона лития, иона магния, иона кальция, иона N-(2-гидроксиэт-1-ил)трис-N,N,N-метиламмония, иона тетраметиламмония, иона тетрапропиламмония и иона триметилбензиламмония.

2. Соли N-(1,3,4-оксадиазол-2-ил)бензамидов по п.1, где

A представляет собой CY;

R представляет собой метил;

X представляет собой метил;

Y представляет собой метилсульфонил;

Z представляет собой трифторметил;

M⁺ представляет собой катион, выбранный из группы, состоящей из иона натрия, иона калия, иона лития, иона магния, иона кальция, иона N-(2-гидроксиэт-1-ил)трис-N,N,N-метиламмония, иона тетраметиламмония, иона тетрапропиламмония и иона триметилбензиламмония.

3. Гербицидная композиция, содержащая гербицидно-активное количество по меньшей мере одной соли соединения формулы (I) по п.1 или 2 в смеси со вспомогательными веществами для композиции.

4. Способ борьбы с нежелательными растениями, который отличается тем, что эффективное количество по меньшей мере одной соли соединения формулы (I) по п.1 или 2 или гербицидной композиции по п.3 применяют на растения или места произрастания нежелательной растительности.

5. Применение соли соединения формулы (I) по п.1 или 2 для борьбы с нежелательными растениями.

6. Применение гербицидной композиции по п.3 для борьбы с нежелательными растениями.

7. Применение по п.5 или 6, где соль соединения формулы (I) используют для борьбы с нежелательными растениями в культурах полезных растений.

8. Применение по п.7, где полезные растения представляют собой трансгенные полезные растения.

