

(19)



Евразийское
патентное
ведомство

(21) 202092254 (13) A1

(12) ОПИСАНИЕ ИЗОБРЕТЕНИЯ К ЕВРАЗИЙСКОЙ ЗАЯВКЕ

(43) Дата публикации заявки
2021.03.09

(22) Дата подачи заявки
2019.03.29

(51) Int. Cl. C07D 403/04 (2006.01)
A01N 43/58 (2006.01)
C07D 407/04 (2006.01)
C07D 409/04 (2006.01)
C07D 413/04 (2006.01)
C07D 417/04 (2006.01)

(54) ГЕРБИЦИДНЫЕ СОЕДИНЕНИЯ

(31) 201811012074

(32) 2018.03.30

(33) IN

(86) PCT/EP2019/058029

(87) WO 2019/185875 2019.10.03

(71) Заявитель:
ЗИНГЕНТА ПАРТИСИПЕЙШНС АГ
(CH)

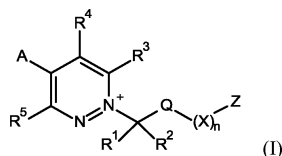
(72) Изобретатель:

Скатт Джеймс Николас, Уиллеттс
Найджел Джеймс (GB), Сонаване
Равиндра, Пхадте Мангала,
Кандукури Сандип Редди, Сасмал
Сварненду (IN), Армстронг Сара,
Макгрاناган Андреа (GB)

(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)

(57) Соединения формулы (I)



где заместители являются такими, как определено в п.1 формулы изобретения, применимые в качестве пестицидов, в особенности в качестве гербицидов.

A1

202092254

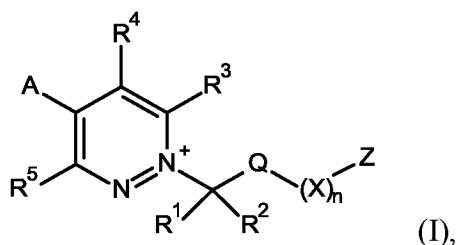
202092254

A1

ГЕРБИЦИДНЫЕ СОЕДИНЕНИЯ

Настоящее изобретение относится к гербицидно активным пиридазиновым производным, а также к способам и промежуточным соединениям, применяемым для получения таких производных. Настоящее изобретение дополнительно распространяется на гербицидные композиции, содержащие такие производные, а также на применение таких соединений и композиций для контроля роста нежелательных растений, в частности, на применение для контроля сорняков в культурах полезных растений.

Настоящее изобретение основано на открытии того, что пиридазиновые производные формулы (I), определенные в данном документе, проявляют на удивление хорошую гербицидную активность. Таким образом, в соответствии с настоящим изобретением представлено соединение формулы (I) или его агрономически приемлемая соль или цвиттер-ионные формы:



где

R^1 выбран из группы, состоящей из водорода, галогена, C_1 - C_6 алкила, C_2 - C_6 алкенила, C_2 - C_6 алкинила, C_3 - C_6 циклоалкила, C_1 - C_6 галогеналкила, $-OR^7$, $-OR^{15a}$, $-N(R^6)S(O)_2R^{15}$, $-N(R^6)C(O)R^{15}$, $-N(R^6)C(O)OR^{15}$, $-N(R^6)C(O)NR^{16}R^{17}$, $-N(R^6)CHO$, $-N(R^{7a})_2$ и $-S(O)_rR^{15}$;

R^2 выбран из группы, состоящей из водорода, галогена, C_1 - C_6 алкила и C_1 - C_6 галогеналкила;

и при этом, если R^1 выбран из группы, состоящей из $-OR^7$, $-OR^{15a}$, $-N(R^6)S(O)_2R^{15}$, $-N(R^6)C(O)R^{15}$, $-N(R^6)C(O)OR^{15}$, $-N(R^6)C(O)NR^{16}R^{17}$, $-N(R^6)CHO$, $-N(R^{7a})_2$ и $-S(O)_tR^{15}$, R^2 выбран из группы, состоящей из водорода и C_1 - C_6 алкила; или

5

R^1 и R^2 вместе с атомом углерода, к которому они присоединены, образуют C_3 - C_6 циклоалкильное кольцо или 3-6-членный гетероцикл, который содержит 1 или 2 гетероатома, по отдельности выбранные из N и O; и

10

Q представляет собой $(CR^{1a}R^{2b})_m$;

m равняется 0, 1, 2 или 3;

15

каждые R^{1a} и R^{2b} независимо выбраны из группы, состоящей из водорода, галогена, C_1 - C_6 алкила, C_1 - C_6 галогеналкила, $-OH$, $-OR^7$, $-OR^{15a}$, $-NH_2$, $-NHR^7$, $-NHR^{15a}$, $-N(R^6)CHO$, $-NR^{7b}R^{7c}$ и $-S(O)_tR^{15}$; или

20

каждые R^{1a} и R^{2b} вместе с атомом углерода, к которому они присоединены, образуют C_3 - C_6 циклоалкильное кольцо или 3-6-членный гетероцикл, который содержит 1 или 2 гетероатома, по отдельности выбранные из N и O; и

25

R^3 , R^4 и R^5 независимо выбраны из группы, состоящей из водорода, галогена, циано, нитро, $-S(O)_tR^{15}$, C_1 - C_6 алкила, C_1 - C_6 фторалкила, C_1 - C_6 фторалкокси, C_1 - C_6 алкокси, C_3 - C_6 циклоалкила и $-N(R^6)_2$;

30

каждый R^6 независимо выбран из водорода и C_1 - C_6 алкила;

каждый R^7 независимо выбран из группы, состоящей из C_1 - C_6 алкила, $-S(O)_2R^{15}$, $-C(O)R^{15}$, $-C(O)OR^{15}$ и $-C(O)NR^{16}R^{17}$;

каждый R^{7a} независимо выбран из группы, состоящей из $-S(O)_2R^{15}$, $-C(O)R^{15}$, $-C(O)OR^{15}$, $-C(O)NR^{16}R^{17}$ и $-C(O)NR^{6}R^{15a}$;

R^{7b} и R^{7c} независимо выбраны из группы, состоящей из C_1 - C_6 алкила, $-S(O)_2R^{15}$, $-C(O)R^{15}$, $-C(O)OR^{15}$, $-C(O)NR^{16}R^{17}$ и фенила, и где указанный фенил необязательно замещен 1, 2 или 3 заместителями R^9 , которые могут быть одинаковыми или различными; или

5 R^{7b} и R^{7c} вместе с атомом азота, к которому они присоединены, образуют 4-6-членное гетероциклическое кольцо, которое необязательно содержит один дополнительный гетероатом, отдельно выбранный из N, O и S; и

10 A представляет собой 5-членный гетероарил, присоединенный к остальной части молекулы посредством атома углерода в кольце, который содержит 1, 2, 3 или 4 гетероатома, независимо выбранные из группы, состоящей из N, O и S, и при этом гетероарил необязательно замещен 1, 2 или 3 заместителями R^8 , которые могут быть одинаковыми или различными,

15 и при этом, если A замещен по одному или нескольким атомам углерода в кольце, каждый R^8 независимо выбран из группы, состоящей из галогена, нитро, циано, $-NH_2$, $-NHR^7$, $-N(R^7)_2$, $-OH$, $-OR^7$, $-S(O)_tR^{15}$, $-NR^6S(O)_2R^{15}$, $-C(O)OR^{10}$, $-C(O)R^{15}$, $-C(O)NR^{16}R^{17}$, $-S(O)_2NR^{16}R^{17}$, C_1 - C_6 алкила, C_1 - C_6 галогеналкила, C_3 - C_6 циклоалкила, C_3 - C_6 галогенциклоалкила, C_3 - C_6 циклоалкокси, C_2 - C_6 алкенила, C_2 - C_6 галогеналкенила, C_2 - C_6 алкинила, C_1 - C_3 алкокси, C_1 - C_3 алкил-, гидроксигруппы, C_6 алкил-, C_1 - C_3 алкокси, C_1 - C_3 алкокси-, C_1 - C_6 галогеналкокси, C_1 - C_3 галогеналкокси, C_1 - C_3 алкил-, C_3 - C_6 алкенилокси, C_3 - C_6 алкинилокси, N- C_3 - C_6 циклоалкиламино, $-C(R^6)=NOR^6$, фенила, 3-6-членного гетероциклила, который содержит 1 или 2 гетероатома, по отдельности выбранные из N и O, и 5- или 6-членного гетероарила, который содержит 1, 2, 3 или 4 гетероатома, независимо выбранные из N, O и S, и при этом указанные фенил, гетероциклил или гетероарил необязательно замещены 1, 2 или 3 заместителями R^9 , которые могут быть одинаковыми или различными;

25

и/или

30 если A замещен по атому азота в кольце, R^8 выбран из группы, состоящей из $-OR^7$, C_1 - C_6 алкила, C_1 - C_6 галогеналкила, C_3 - C_6 циклоалкила, C_3 - C_6 галогенциклоалкила, C_3 - C_6 циклоалкокси, C_2 - C_6 алкенила, C_2 - C_6 галогеналкенила, C_2 - C_6 алкинила, C_1 - C_3 алкокси, C_1 - C_3 алкил-, гидроксигруппы.

C_6 алкил-, C_1 - C_3 алкокси C_1 - C_3 алкокси-, C_1 - C_6 галогеналкокси, C_1 - C_3 галогеналкокси C_1 - C_3 алкил-, C_3 - C_6 алкенилокси и C_3 - C_6 алкинилокси; и

каждый R^9 независимо выбран из группы, состоящей из галогена, циано, -ОН, - $N(R^6)_2$, C_1 - C_4 алкила, C_1 - C_4 алкокси, C_1 - C_4 галогеналкила и C_1 - C_4 галогеналкокси;

X независимо выбран из группы, состоящей из C_3 - C_6 циклоалкила, фенила, 5- или 6-членного гетероарила, который содержит 1, 2, 3 или 4 гетероатома, независимо выбранные из N, O и S, и 4-6-членного гетероциклила, который содержит 1, 2 или 3 гетероатома, независимо выбранные из N, O и S, и при этом указанные циклоалкильные, фенильные, гетероарильные или гетероциклильные фрагменты необязательно замещены 1 или 2 заместителями, которые могут быть одинаковыми или различными, выбранными из R^9 , и при этом вышеуказанные фрагменты CR^1R^2 и Z или Q и Z могут быть присоединены в любом положении указанных циклоалкильных, фенильных, гетероарильных или гетероциклильных фрагментов;

n равняется 0 или 1;

Z выбран из группы, состоящей из $-C(O)OR^{10}$, $-CH_2OH$, $-CHO$, $-C(O)NHOR^{11}$, $-C(O)NHCN$, $-OC(O)NHOR^{11}$, $-OC(O)NHCN$, $-NR^6C(O)NHOR^{11}$, $-NR^6C(O)NHCN$, $-C(O)NHS(O)_2R^{12}$, $-OC(O)NHS(O)_2R^{12}$, $-NR^6C(O)NHS(O)_2R^{12}$, $-S(O)_2OR^{10}$, $-OS(O)_2OR^{10}$, $-NR^6S(O)_2OR^{10}$, $-NR^6S(O)OR^{10}$, $-NHS(O)_2R^{14}$, $-S(O)OR^{10}$, $-OS(O)OR^{10}$, $-S(O)_2NHCN$, $-S(O)_2NHC(O)R^{18}$, $-S(O)_2NHS(O)_2R^{12}$, $-OS(O)_2NHCN$, $-OS(O)_2NHS(O)_2R^{12}$, $-OS(O)_2NHC(O)R^{18}$, $-NR^6S(O)_2NHCN$, $-NR^6S(O)_2NHC(O)R^{18}$, $-N(OH)C(O)R^{15}$, $-ONHC(O)R^{15}$, $-NR^6S(O)_2NHS(O)_2R^{12}$, $-P(O)(R^{13})(OR^{10})$, $-P(O)H(OR^{10})$, $-OP(O)(R^{13})(OR^{10})$, $-NR^6P(O)(R^{13})(OR^{10})$ и тетразола;

R^{10} выбран из группы, состоящей из водорода, C_1 - C_6 алкила, фенила и бензила, и где указанные фенил или бензил необязательно замещены 1, 2 или 3 заместителями R^9 , которые могут быть одинаковыми или различными;

R^{11} выбран из группы, состоящей из водорода, C_1 - C_6 алкила и фенила, и где указанный фенил необязательно замещен 1, 2 или 3 заместителями R^9 , которые могут быть одинаковыми или различными;

5 R^{12} выбран из группы, состоящей из C_1 - C_6 алкила, C_1 - C_6 галогеналкила, C_1 - C_6 алкокси, -ОН, $-N(R^6)_2$ и фенила, и где указанный фенил необязательно замещен 1, 2 или 3 заместителями R^9 , которые могут быть одинаковыми или различными;

10 R^{13} выбран из группы, состоящей из -ОН, C_1 - C_6 алкила, C_1 - C_6 алкокси и фенила;

R^{14} представляет собой C_1 - C_6 галогеналкил;

15 R^{15} выбран из группы, состоящей из C_1 - C_6 алкила и фенила, и где указанный фенил необязательно замещен 1, 2 или 3 заместителями R^9 , которые могут быть одинаковыми или различными;

R^{15a} представляет собой фенил, где указанный фенил необязательно замещен 1, 2 или 3 заместителями R^9 , которые могут быть одинаковыми или различными;

20 R^{16} и R^{17} независимо выбраны из группы, состоящей из водорода и C_1 - C_6 алкила; или

25 R^{16} и R^{17} вместе с атомом азота, к которому они присоединены, образуют 4-6-членное гетероциклическое кольцо, которое необязательно содержит один дополнительный гетероатом, независимо выбранный из N, O и S;

30 R^{18} выбран из группы, состоящей из водорода, C_1 - C_6 алкила, C_1 - C_6 галогеналкила, C_1 - C_6 алкокси, $-N(R^6)_2$ и фенила, и где указанный фенил необязательно замещен 1, 2 или 3 заместителями R^9 , которые могут быть одинаковыми или различными;

и

r равняется 0, 1 или 2.

В соответствии со вторым аспектом настоящего изобретения представлена гербицидная композиция, содержащая гербицидно эффективное количество соединения формулы (I) и агрохимически приемлемый разбавитель или носитель. Такая композиция, предназначенная для применения в сельском хозяйстве, может
 5 дополнительно содержать по меньшей мере один дополнительный активный ингредиент.

В соответствии с третьим аспектом настоящего изобретения представлен способ контроля или предупреждения роста нежелательных растений, где гербицидно
 10 эффективное количество соединения формулы (I) или композицию, содержащую данное соединение в качестве активного ингредиента, применяют в отношении растений, их частей или места их произрастания.

В соответствии с четвертым аспектом настоящего изобретения представлено
 15 применение соединения формулы (I) в качестве гербицида.

Применяемый в данном документе термин "галоген" или "галогено" относится ко фтору (фтор), хлору (хлор), бром (бром) или йоду (йод), предпочтительно фтору, хлору или бром.

20 Применяемый в данном документе термин "циано" означает группу -CN.

Применяемый в данном документе термин "гидрокси" означает группу -OH.

Применяемый в данном документе термин "нитро" означает группу -NO₂.

Применяемый в данном документе термин "C₁-C₆алкил" относится к углеводородному радикалу с прямой или разветвленной цепью, состоящему
 25 исключительно из атомов углерода и водорода, не содержащему ненасыщенных связей, имеющему от одного до шести атомов углерода, и который присоединен к остальной части молекулы одинарной связью. C₁-C₄алкил и C₁-C₂алкил следует истолковывать соответствующим образом. Примеры C₁-C₆алкила включают без ограничения метил (Me), этил (Et), *n*-пропил, 1-метилэтил (изопропил), *n*-бутил и 1-диметилэтил (*трет*-
 30 бутил).

Применяемый в данном документе термин "C₁-C₆алкокси" относится к радикалу формулы -OR_a, где R_a представляет собой C₁-C₆алкильный радикал, который в целом определен выше. C₁-C₄алкокси следует истолковывать соответствующим образом.

Примеры C_{1-4} алкокси включают без ограничения метокси, этокси, пропокси, изопропокси и *трет*-бутокси.

Применяемый в данном документе термин " C_1 - C_6 галогеналкил" относится к C_1 - C_6 алкильному радикалу, который в целом определен выше, замещенному одним или несколькими одинаковыми или различными атомами галогена. C_1 - C_4 галогеналкил следует истолковывать соответствующим образом. Примеры C_1 - C_6 галогеналкила включают без ограничения хлорметил, фторметил, фторэтил, дифторметил, трифторметил и 2,2,2-трифторэтил.

Применяемый в данном документе термин " C_1 - C_6 фторалкил" относится к C_1 - C_6 алкильному радикалу, который в целом определен выше, замещенному одним или несколькими атомами фтора. Примеры C_1 - C_6 фторалкила включают без ограничения фторметил, фторэтил, дифторметил, трифторметил и 2,2,2-трифторэтил.

Применяемый в данном документе термин " C_2 - C_6 алкенил" относится к углеводородному радикалу с прямой или разветвленной цепью, состоящему исключительно из атомов углерода и водорода, содержащему по меньшей мере одну двойную связь, которая может находиться либо в (*E*)-, либо в (*Z*)-конфигурации, имеющей от двух до шести атомов углерода, которая присоединена к остальной части молекулы одинарной связью. C_2 - C_4 алкенил следует истолковывать соответствующим образом. Примеры C_2 - C_6 алкенила включают без ограничения проп-1-енил, аллил (проп-2-енил) и бут-1-енил.

Применяемый в данном документе термин " C_2 - C_6 галогеналкенил" относится к C_2 - C_6 алкенильному радикалу, который в целом определен выше, замещенному одним или несколькими одинаковыми или различными атомами галогена. Примеры C_2 - C_6 галогеналкенила включают без ограничения хлорэтилен, фторэтилен, 1,1-дифторэтилен, 1,1-дихлорэтилен и 1,1,2-трихлорэтилен.

Применяемый в данном документе термин " C_2 - C_6 алкинил" относится к группе, представляющей собой углеводородный радикал с прямой или разветвленной цепью, состоящей исключительно из атомов углерода и водорода, содержащей по меньшей мере одну тройную связь, имеющей от двух до шести атомов углерода, и которая присоединена к остальной части молекулы одинарной связью. C_2 - C_4 алкинил следует истолковывать соответствующим образом. Примеры C_2 - C_6 алкинила включают без ограничения, проп-1-инил, пропаргил (проп-2-инил) и бут-1-инил.

Применяемый в данном документе термин " C_1 - C_6 галогеналкокси" относится к C_1 - C_6 алкоксигруппе, определенной выше, замещенной одним или несколькими

одинаковыми или различными атомами галогена. C_1 - C_4 галогеналкокси следует истолковывать соответствующим образом. Примеры C_1 - C_6 галогеналкокси включают без ограничения фторметокси, дифторметокси, фторэтокси, трифторметокси и трифторэтокси.

5 Применяемый в данном документе термин " C_1 - C_6 фторалкокси" относится к C_1 - C_6 алкоксигруппе, определенной выше, замещенной одним или несколькими атомами фтора. Примеры C_1 - C_6 фторалкокси включают без ограничения фторметокси, дифторметокси, фторэтокси, трифторметокси и трифторэтокси.

10 Применяемый в данном документе термин " C_1 - C_3 галогеналкокси C_1 - C_3 алкил" относится к радикалу формулы R_b-O-R_a -, где R_b представляет собой C_1 - C_3 галогеналкильный радикал, который в целом определен выше, и R_a представляет собой C_1 - C_3 алкиленовый радикал, который в целом определен выше.

15 Применяемый в данном документе термин " C_1 - C_3 алкокси C_1 - C_3 алкил" относится к радикалу формулы R_b-O-R_a -, где R_b представляет собой C_1 - C_3 алкильный радикал, который в целом определен выше, и R_a представляет собой C_1 - C_3 алкиленовый радикал, который в целом определен выше.

20 Применяемый в данном документе термин " C_1 - C_3 алкокси C_1 - C_3 алкокси-" относится к радикалу формулы R_b-O-R_a-O -, где R_b представляет собой C_1 - C_3 алкильный радикал, который в целом определен выше, и R_a представляет собой C_1 - C_3 алкиленовый радикал, который в целом определен выше.

Применяемый в данном документе термин " C_3 - C_6 алкенилокси" относится к радикалу формулы $-OR_a$ -, где R_a представляет собой C_3 - C_6 алкенильный радикал, который в целом определен выше.

25 Применяемый в данном документе термин " C_3 - C_6 алкинилокси" относится к радикалу формулы $-OR_a$ -, где R_a представляет собой C_3 - C_6 алкинильный радикал, который в целом определен выше.

Применяемый в данном документе термин "гидрокси C_1 - C_6 алкил" относится к C_1 - C_6 алкильному радикалу, который в целом определен выше, замещенному одной или несколькими гидроксигруппами.

30 Применяемый в данном документе термин " C_3 - C_6 циклоалкил" относится к стабильному моноциклическому кольцевому радикалу, который является насыщенным или частично ненасыщенным и содержит от 3 до 6 атомов углерода. C_3 - C_4 циклоалкил следует истолковывать соответствующим образом. Примеры C_3 - C_6 циклоалкила включают без ограничения циклопропил, циклобутил, циклопентил и циклогексил.

Применяемый в данном документе термин "C₃-C₆галогенциклоалкил" относится к C₃-C₆циклоалкильному радикалу, который в целом определен выше, замещенному одним или несколькими одинаковыми или различными атомами галогена. C₃-C₄галогенциклоалкил следует истолковывать соответствующим образом.

5 Применяемый в данном документе термин "C₃-C₆циклоалкокси" относится к радикалу формулы -OR_a, где R_a представляет собой C₃-C₆циклоалкильный радикал, который в целом определен выше.

10 Применяемый в данном документе термин "N-C₃-C₆циклоалкиламино" относится к радикалу формулы -NHR_a, где R_a представляет собой C₃-C₆циклоалкильный радикал, который в целом определен выше.

За исключением случаев, когда явно указано иное, применяемый в данном документе термин "гетероарил" относится к 5- или 6-членному моноциклическому ароматическому кольцу, которое содержит 1, 2, 3 или 4 гетероатома, по отдельности выбранные и N, O и S. Гетероарильный радикал может быть присоединен к остальной части молекулы посредством атома углерода или гетероатома. Примеры гетероарила включают фурил, пирролил, имидазолил, тиенил, пиразолил, тиазолил, изотиазолил, оксазолил, изоксазолил, триазолил, тетразолил, пиразинил, пиридазинил, пиримидил или пиридил.

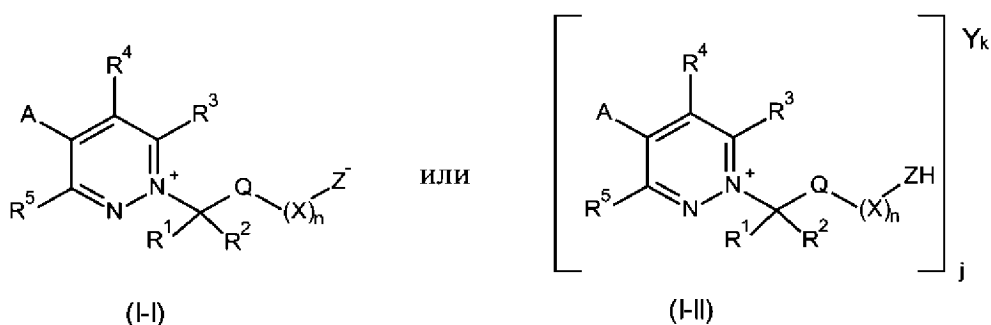
20 За исключением случаев, когда явно указано иное, применяемый в данном документе термин "гетероциклил" или "гетероциклический" относится к устойчивому 4-6-членному неароматическому моноциклическому кольцевому радикалу, который содержит 1, 2, или 3 гетероатома, по отдельности выбранные из N, O и S. Гетероциклильный радикал может быть связан с остальной частью молекулы посредством атома углерода или гетероатома. Примеры гетероциклила включают без 25 ограничения пирролинил, пирролидил, тетрагидрофурил, тетрагидротиенил, тетрагидротиопиранил, пиперидил, пиперазинил, тетрагидропиранил, дигидроизоксазолил, диоксоланил, морфолинил или δ-лактадил.

30 Наличие одного или нескольких возможных асимметричных атомов углерода в соединении формулы (I) означает, что соединения могут встречаться в хиральных изомерных формах, т.е. энантиомерных или диастереомерных формах. Также атропоизомеры могут возникать в результате ограниченного вращения вокруг одинарной связи. Предполагается, что соединение формулы (I) включает все такие возможные изомерные формы и их смеси. Настоящее изобретение включает все такие

возможные изомерные формы соединения формулы (I) и их смеси. Аналогичным образом предполагается, что формула (I) включает все возможные таутомеры (включая лактам-лактимную таутомерию и кето-енольную таутомерию), если они присутствуют. Настоящее изобретение включает все возможные таутомерные формы соединения формулы (I). Аналогично, в случае дизамещенных алкенов, они могут быть представлены в *E*- или *Z*-форме или в виде смесей обоих в любой пропорции. Настоящее изобретение включает все такие возможные изомерные формы соединения формулы (I) и их смеси.

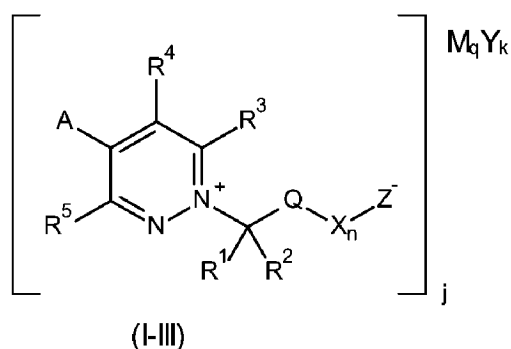
Соединения формулы (I) будут, как правило, представлены в форме агрономически приемлемой соли, цвиттер-иона или агрономически приемлемой соли цвиттер-иона. Настоящее изобретение охватывает все такие агрономически приемлемые соли, цвиттер-ионы и их смеси во всех пропорциях.

Например, соединение формулы (I), где Z предусматривает кислотный протон, может существовать в виде цвиттер-иона, что соответствует соединению формулы (I-I), или в виде агрономически приемлемой соли, что соответствует соединению формулы (I-II), как показано ниже:



где Y представляет собой агрономически приемлемый анион, и j и k представляют собой целые числа, которые могут быть выбраны из 1, 2 или 3 в зависимости от заряда соответствующего аниона Y.

Соединение формулы (I) может также существовать в виде агрономически приемлемой соли цвиттер-иона, что соответствует соединению формулы (I-III), как показано ниже:



где Y представляет собой агрономически приемлемый анион, M представляет собой агрономически приемлемый катион (в дополнение к катиону пиридазиния), и целые числа j, k и q могут быть выбраны из 1, 2 или 3 в зависимости от заряда соответствующего аниона Y и соответствующего катиона M.

Таким образом, если соединение формулы (I) изображено в данном документе в протонированной форме, специалисту в данной области будет понятно, что оно может быть одинаково представлено в непротонированной или солевой форме с одним или несколькими соответствующими противоионами.

В одном варианте осуществления настоящего изобретения представлено соединение формулы (I-II), где k равняется 2, j равняется 1, и Y выбран из группы, состоящей из галогена, трифторацетата и пентафторпропионата. В данном варианте осуществления атом азота в кольце A может быть протонированным, или атом азота, содержащийся в R¹, R², Q или X, может быть протонированным. Предпочтительно в соединении формулы (I-II) k равняется 2, j равняется 1, и Y представляет собой хлорид, где атом азота в кольце A является протонированным (например, азот пиррола или имидазола является протонированным).

Подходящие агрономически приемлемые соли по настоящему изобретению, представленные анионом Y, включают без ограничения хлорид, бромид, иодид, фторид, 2-нафталинсульфонат, ацетат, адипат, метоксид, этоксид, пропоксид, бутоксид, аспартат, бензолсульфонат, бензоат, бикарбонат, бисульфат, битартрат, бутилсульфат, бутилсульфонат, бутират, камфорат, камсилат, капрат, капроат, каприлат, карбонат, цитрат, дифосфат, эдетат, эдисилат, энантат, этандисульфонат, этансульфонат, этилсульфат, формиат, фумарат, глюцептат, глюконат, глюкоронат, глутамат, глицерофосфат, гептадеканат, гексадеканат, гидросульфат, гидроксид,

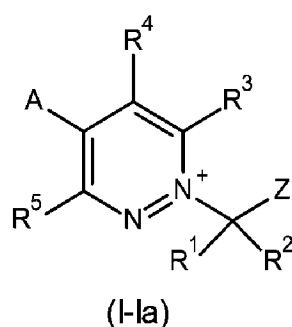
гидроксинафтоат, изетионат, лактат, лактобионат, лаурат, малат, малеат, манделат, мезилат, метандисульфонат, метилсульфат, мукат, миристат, напсилат, нитрат, нонадеканоат, октадеканоат, оксалат, пеларгонат, пентадеканоат, пентафторпропионат, перхлорат, фосфат, пропионат, пропилсульфат, пропилсульфонат, сукцинат, сульфат, тартрат, тозилат, тридецилат, трифлат, трифторацетат, ундецилинат и валерат.

Подходящие катионы, представленные в виде М, включают без ограничения металлы, сопряженные с аминами кислоты и органические катионы. Примеры подходящих металлов включают алюминий, кальций, цезий, медь, литий, магний, марганец, калий, натрий, железо и цинк. Примеры подходящих аминов включают аллиламин, аммиак, амиламин, аргинин, бенетамин, бензатин, бутенил-2-амин, бутиламин, бутилэтанолламин, циклогексиламин, дециламин, диамиламин, дибутиламин, диэтанолламин, диэтиламин, диэтилентриамин, дигептиламин, дигексиламин, диизоамиламин, диизопропиламин, диметиламин, диоктиламин, дипропанолламин, дипропаргиламин, дипропиламин, додециламин, этанолламин, этиламин, этилбутиламин, этилендиамин, этилгептиламин, этилоктиламин, этилпропанолламин, гептадециламин, гептиламин, гексадециламин, гексенил-2-амин, гексиламин, гексилгептиламин, гексиллактиламин, гистидин, индолин, изоамиламин, изобутанолламин, изобутиламин, изопропанолламин, изопропиламин, лизин, меглюмин, метоксиэтиламин, метиламин, метилбутиламин, метилэтиламин, метилгексиламин, метилизопропиламин, метилнониламин, метилоктадециламин, метилпентадециламин, морфолин, N,N-диэтилэтанолламин, N-метилпиперазин, нониламин, октадециламин, октиламин, олеиламин, пентадециламин, пентенил-2-амин, феноксиэтиламин, пиколин, пиперазин, пиперидин, пропанолламин, пропиламин, пропилендиамин, пиридин, пирролидин, втор-бутиламин, стеариламин, талловый амин, тетрадециламин, трибутиламин, тридециламин, триметиламин, тригептиламин, тригексиламин, триизобутиламин, триизодециламин, триизопропиламин, триметиламин, трипентиламин, трипропиламин, трис(гидроксиметил)аминометан и ундециламин. Примеры подходящих органических катионов включают бензилтрибутиламмоний, бензилтриметиламмоний, бензилтрифенилфосфоний, холин, тетрабутиламмоний, тетрабутилфосфоний, тетраэтиламмоний, тетраэтилфосфоний, тетраметиламмоний, тетраметилфосфоний, тетрапропиламмоний, тетрапропилфосфоний, трибутилсульфоний, трибутилсульфоксоний, триэтилсульфоний, триэтилсульфоксоний, триметилсульфоний, триметилсульфоксоний, трипропилсульфоний и трипропилсульфоксоний.

Предпочтительные соединения формулы (I), где Z предусматривает кислотный протон, могут быть представлены в виде либо (I-I), либо (I-II). В случае соединений формулы (I-II) отмечают соли, если Y представляет собой хлорид, бромид, иодид, гидроксид, бикарбонат, ацетат, пентафторпропионат, трифлат, трифторацетат, гидросульфат, метилсульфат, тозилат и нитрат, где каждый из j и k независимо равняются 1 или 2. Предпочтительно Y представляет собой хлорид, бромид, йодид, гидроксид, бикарбонат, ацетат, трифторацетат, метилсульфат, тозилат и нитрат, где j и k равняются 1. В случае соединений формулы (I-II) выделяют также соли, если Y представляет собой карбонат и сульфат, где j равняется 2, и k равняется 1, и если Y представляет собой фосфат, где j равняется 3, и k равняется 1.

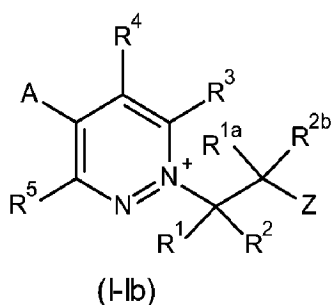
В соответствующем случае, соединения формулы (I) также могут находиться в форме (и/или применяться в виде) N-оксида.

Соединения формулы (I), где m равняется 0, и n равняется 0, могут быть представлены соединением формулы (I-Ia), как показано ниже:



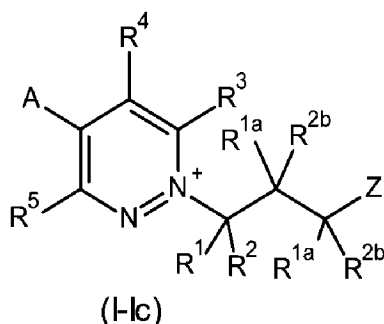
где R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , A и Z определены для соединений формулы (I).

Соединения формулы (I), где m равняется 1, и n равняется 0, могут быть представлены соединением формулы (I-Ib), как показано ниже:



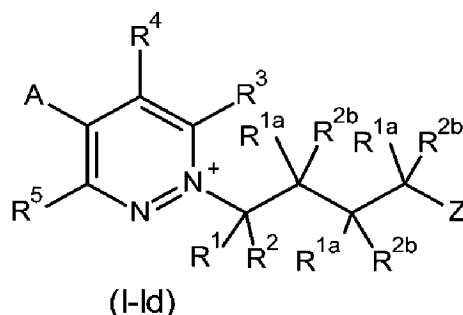
где R^1 , R^2 , R^{1a} , R^{2b} , R^3 , R^4 , R^5 , A и Z определены для соединений формулы (I).

Соединения формулы (I), где m равняется 2, и n равняется 0, могут быть представлены соединением формулы (I-Ic), как показано ниже:



5 где $R^1, R^2, R^{1a}, R^{2b}, R^3, R^4, R^5, A$ и Z определены для соединений формулы (I).

Соединения формулы (I), где m равняется 3, и n равняется 0, могут быть представлены соединением формулы (I-Id), как показано ниже:



10 где $R^1, R^2, R^{1a}, R^{2b}, R^3, R^4, R^5, A$ и Z определены для соединений формулы (I).

В следующем перечне представлены определения, включающие предпочтительные определения для заместителей $n, m, r, A, Q, X, Z, R^1, R^2, R^{1a}, R^{2b}, R^3, R^4, R^5, R^6, R^7, R^{7a}, R^{7b}, R^{7c}, R^8, R^{8a}, R^{8b}, R^{8c}, R^{8d}, R^9, R^{10}, R^{11}, R^{12}, R^{13}, R^{14}, R^{15}, R^{15a}, R^{16}, R^{17}$ и R^{18} со ссылкой на соединения формулы (I) в соответствии с настоящим изобретением. Применительно к любому из этих заместителей любое из определений, приведенных ниже, можно комбинировать с любым определением любого другого заместителя, приведенным ниже или в других частях данного документа.

20

R^1 выбран из группы, состоящей из водорода, галогена, C_1 - C_6 алкила, C_2 - C_6 алкенила, C_2 - C_6 алкинила, C_3 - C_6 циклоалкила, C_1 - C_6 галогеналкила, $-OR^7$, $-OR^{15a}$, $-N(R^6)S(O)_2R^{15}$, $-N(R^6)C(O)R^{15}$, $-N(R^6)C(O)OR^{15}$, $-N(R^6)C(O)NR^{16}R^{17}$, $-N(R^6)CHO$, $-N(R^{7a})_2$ и $-S(O)_rR^{15}$.

- Предпочтительно R^1 выбран из группы, состоящей из водорода, галогена, C_1 - C_6 алкила, C_1 - C_6 фторалкила, $-OR^7$, $-NHS(O)_2R^{15}$, $-NHC(O)R^{15}$, $-NHC(O)OR^{15}$, $-NHC(O)NR^{16}R^{17}$, $-N(R^{7a})_2$ и $-S(O)_tR^{15}$. Более предпочтительно R^1 выбран из группы, состоящей из водорода, галогена, C_1 - C_6 алкила, C_1 - C_6 фторалкила, $-OR^7$ и $-N(R^{7a})_2$. Еще более предпочтительно R^1 выбран из группы, состоящей из водорода, C_1 - C_6 алкила, $-OR^7$ и $-N(R^{7a})_2$. Еще более предпочтительно R^1 представляет собой водород или C_1 - C_6 алкил. Даже еще более предпочтительно R^1 представляет собой водород или метил. Наиболее предпочтительно R^1 представляет собой водород.
- 10 R^2 выбран из группы, состоящей из водорода, галогена, C_1 - C_6 алкила и C_1 - C_6 галогеналкила. Предпочтительно R^2 выбран из группы, состоящей из водорода, галогена, C_1 - C_6 алкила и C_1 - C_6 фторалкила. Более предпочтительно R^2 представляет собой водород или C_1 - C_6 алкил. Еще более предпочтительно R^2 представляет собой водород или метил. Наиболее предпочтительно R^2 представляет собой водород.
- 15 При этом если R^1 выбран из группы, состоящей из $-OR^7$, $-OR^{15a}$, $-N(R^6)S(O)_2R^{15}$, $-N(R^6)C(O)R^{15}$, $-N(R^6)C(O)OR^{15}$, $-N(R^6)C(O)NR^{16}R^{17}$, $-N(R^6)CHO$, $-N(R^{7a})_2$ и $-S(O)_tR^{15}$, R^2 выбран из группы, состоящей из водорода и C_1 - C_6 алкила. Предпочтительно, если R^1 выбран из группы, состоящей из $-OR^7$, $-NHS(O)_2R^{15}$, $-NHC(O)R^{15}$, $-NHC(O)OR^{15}$, $-NHC(O)NR^{16}R^{17}$, $-N(R^{7a})_2$ и $-S(O)_tR^{15}$, R^2 выбран из группы, состоящей из водорода и метила.
- 20
- Альтернативно R^1 и R^2 вместе с атомом углерода, к которому они присоединены, образуют C_3 - C_6 циклоалкильное кольцо или 3-6-членный гетероцикл, который содержит 1 или 2 гетероатома, по отдельности выбранные из N и O. Предпочтительно R^1 и R^2 вместе с атомом углерода, к которому они присоединены, образуют C_3 - C_6 циклоалкильное кольцо. Более предпочтительно R^1 и R^2 вместе с атомом углерода, к которому они присоединены, образуют циклопропильное кольцо.
- 25
- 30 В одном варианте осуществления R^1 и R^2 представляют собой водород.
- В другом варианте осуществления R^1 представляет собой метил, и R^2 представляет собой водород.

В другом варианте осуществления R^1 представляет собой метил, и R^2 представляет собой метил.

Q представляет собой $(CR^{1a}R^{2b})_m$.

5

m равняется 0, 1, 2 или 3. Предпочтительно m равняется 0, 1 или 2. Более предпочтительно m равняется 1 или 2. Наиболее предпочтительно m равняется 1.

10

Каждые R^{1a} и R^{2b} независимо выбраны из группы, состоящей из водорода, галогена, C_1 - C_6 алкила, C_1 - C_6 галогеналкила, -ОН, -OR⁷, -OR^{15a}, -NH₂, -NHR⁷, -NHR^{15a}, -N(R⁶)CHO, -NR^{7b}R^{7c} и -S(O)_tR¹⁵. Предпочтительно каждые R^{1a} и R^{2b} независимо выбраны из группы, состоящей из водорода, галогена, C_1 - C_6 алкила, C_1 - C_6 фторалкила, -ОН, -NH₂ и -NHR⁷. Более предпочтительно каждые R^{1a} и R^{2b} независимо выбраны из группы, состоящей из водорода, C_1 - C_6 алкила, -ОН и -NH₂. Еще более предпочтительно каждые R^{1a} и R^{2b} независимо выбраны из группы, состоящей из водорода, метила, -ОН и -NH₂. Еще более предпочтительно каждые R^{1a} и R^{2b} независимо выбраны из группы, состоящей из водорода и метила. Наиболее предпочтительно R^{1a} и R^{2b} представляют собой водород.

15

20

В другом варианте осуществления каждые R^{1a} и R^{2b} независимо выбраны из группы, состоящей из водорода и C_1 - C_6 алкила.

25

Альтернативно каждые R^{1a} и R^{2b} вместе с атомом углерода, к которому они присоединены, образуют C_3 - C_6 циклоалкильное кольцо или 3-6-членный гетероциклический, который содержит 1 или 2 гетероатома, по отдельности выбранные из N и O. Предпочтительно каждые R^{1a} и R^{2b} вместе с атомом углерода, к которому они присоединены, образуют C_3 - C_6 циклоалкильное кольцо. Более предпочтительно каждые R^{1a} и R^{2b} вместе с атомом углерода, к которому они присоединены, образуют циклопропильное кольцо.

30

R^3 , R^4 и R^5 независимо выбраны из группы, состоящей из водорода, галогена, циано, нитро, -S(O)_tR¹⁵, C_1 - C_6 алкила, C_1 - C_6 фторалкила, C_1 - C_6 фторалкокси, C_1 - C_6 алкокси, C_3 - C_6 циклоалкила и -N(R⁶)₂. Предпочтительно R^3 , R^4 и R^5 независимо выбраны из группы, состоящей из водорода, C_1 - C_6 алкила, C_1 - C_6 фторалкила, C_1 - C_6 фторалкокси, C_1 -

С₆алкокси, С₃-С₆циклоалкила и $-N(R^6)_2$. Более предпочтительно R³, R⁴ и R⁵ независимо выбраны из группы, состоящей из водорода, С₁-С₆алкила и С₁-С₆алкокси. Еще более предпочтительно R³, R⁴ и R⁵ независимо выбраны из группы, состоящей из водорода и С₁-С₆алкила. Еще более предпочтительно R³, R⁴ и R⁵ независимо выбраны из группы, состоящей из водорода и метила. Наиболее предпочтительно R³, R⁴ и R⁵ представляют собой водород.

Каждый R⁶ независимо выбран из водорода и С₁-С₆алкила. Предпочтительно каждый R⁶ независимо выбран из водорода и метила.

10

Каждый R⁷ независимо выбран из группы, состоящей из С₁-С₆алкила, $-S(O)_2R^{15}$, $-C(O)R^{15}$, $-C(O)OR^{15}$ и $-C(O)NR^{16}R^{17}$. Предпочтительно каждый R⁷ независимо выбран из группы, состоящей из С₁-С₆алкила, $-C(O)R^{15}$ и $-C(O)NR^{16}R^{17}$. Более предпочтительно каждый R⁷ представляет собой С₁-С₆алкил. Наиболее предпочтительно каждый R⁷ представляет собой метил.

15

Каждый R^{7a} независимо выбран из группы, состоящей из $-S(O)_2R^{15}$, $-C(O)R^{15}$, $-C(O)OR^{15}$, $-C(O)NR^{16}R^{17}$ и $-C(O)NR^{6}R^{15a}$. Предпочтительно каждый R^{7a} независимо представляет собой $-C(O)R^{15}$ или $-C(O)NR^{16}R^{17}$.

20

R^{7b} и R^{7c} независимо выбраны из группы, состоящей из С₁-С₆алкила, $-S(O)_2R^{15}$, $-C(O)R^{15}$, $-C(O)OR^{15}$, $-C(O)NR^{16}R^{17}$ и фенила, и где указанный фенил необязательно замещен 1, 2 или 3 заместителями R⁹, которые могут быть одинаковыми или различными. Предпочтительно R^{7b} и R^{7c} независимо выбраны из группы, состоящей из С₁-С₆алкила, $-C(O)R^{15}$ и $-C(O)NR^{16}R^{17}$. Более предпочтительно R^{7b} и R^{7c} представляют собой С₁-С₆алкил. Наиболее предпочтительно R^{7b} и R^{7c} представляют собой метил.

25

Альтернативно R^{7b} и R^{7c} вместе с атомом азота, к которому они присоединены, образуют 4-6-членное гетероциклическое кольцо, которое необязательно содержит один дополнительный гетероатом, отдельно выбранный из N, O и S. Предпочтительно R^{7b} и R^{7c} вместе с атомом азота, к которому они присоединены, образуют 5-6-членное гетероциклическое кольцо, которое необязательно содержит один дополнительный гетероатом, отдельно выбранный из N и O. Более предпочтительно R^{7b} и R^{7c} вместе с атомом азота, к которому они присоединены, образуют пирролидинную,

30

оксазолидинильную, имидазолидинильную, пиперидильную, пиперазинильную или морфолинийную группу.

А представляет собой 5-членный гетероарил, присоединенный к остальной части молекулы посредством атома углерода в кольце, который содержит 1, 2, 3 или 4 гетероатома, независимо выбранные из группы, состоящей из N, O и S, и при этом гетероарил необязательно замещен 1, 2 или 3 заместителями R⁸, которые могут быть одинаковыми или различными.

Предпочтительно А представляет собой гетероарил, выбранный из группы, состоящей из 1,2,3,5-оксатриазолила, 1,2,3,5-тиатриазолила, 1,2,4-оксадиазолила, 1,2,4-тиадиазолила, 1,2,4-триазолила, 1,2,5-оксадиазолила, 1,2,5-тиадиазолила, 1,3,4-оксадиазолила, 1,3,4-тиадиазолила, фурила, тиенила, имидазолила, изотиазолила, изоксазолила, 1,2,3-оксадиазолила, 1,2,3,4-оксатриазолила, оксазолила, пиразолила, пирролила, тетразолила, 1,2,3-тиадиазолила, 1,2,3,4-тиатриазолила, тиазолила и 1,2,3-триазолила, при этом гетероарил необязательно замещен 1, 2 или 3 заместителями R⁸, которые могут быть одинаковыми или различными.

Более предпочтительно А представляет собой гетероарил, выбранный из группы, состоящей из 1,2,3,5-оксатриазол-4-ила, 1,2,3,5-тиатриазол-4-ила, 1,2,4-оксадиазол-3-ила, 1,2,4-оксадиазол-5-ила, 1,2,4-тиадиазол-3-ила, 1,2,4-тиадиазол-5-ила, 1,2,4-триазол-3-ила, 1,2,4-триазол-5-ила, 1,2,5-оксадиазол-3-ила, 1,2,5-тиадиазол-3-ила, 1,3,4-оксадиазол-2-ила, 1,3,4-тиадиазол-2-ила, 2-фурила, 2-тиенила, 3-фурила, 3-тиенила, имидазол-2-ила, имидазол-4-ила, имидазол-5-ила, изотиазол-3-ила, изотиазол-4-ила, изотиазол-5-ила, изоксазол-3-ила, изоксазол-4-ила, изоксазол-5-ила, 1,2,3-оксадиазол-4-ила, 1,2,3-оксадиазол-5-ила, 1,2,3,4-оксатриазол-5-ила, оксазол-2-ила, оксазол-4-ила, оксазол-5-ила, пиразол-3-ила, пиразол-4-ила, пиразол-5-ила, пиррол-2-ила, пиррол-3-ила, тетразол-5-ила, 1,2,3-тиадиазол-4-ила, 1,2,3-тиадиазол-5-ила, 1,2,3,4-тиатриазол-5-ила, тиазол-2-ила, тиазол-4-ила, тиазол-5-ила, триазол-4-ила и триазол-5-ила, при этом гетероарил необязательно замещен 1, 2 или 3 заместителями R⁸, которые могут быть одинаковыми или различными.

В одном варианте осуществления А представляет собой гетероарил, выбранный из группы, состоящей из тетразолила, 1,2,4-триазолила, изоксазолила, оксазолила,

тиазолила, 1,3,4-тиадиазолила, 1,2,3-триазолила, пиразолила, 1,3,4-оксадиазолила, 1,2,4-тиадиазолила, имидазолила, изотиазолила, тиенила, фурила, 1,2,4-оксадиазолила, 1,2,3-тиадиазолила и 1,2,5-тиадиазолила, при этом гетероарил необязательно замещен 1, 2 или 3 заместителями R^8 , которые могут быть одинаковыми или различными.

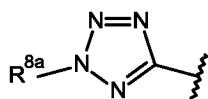
5

Еще более предпочтительно А представляет собой гетероарил, выбранный из группы, состоящей из тетразол-5-ила, 1,2,4-триазол-3-ила, 1,2,4-триазол-5-ила, изоксазол-3-ила, оксазол-2-ила, тиазол-2-ила, 1,3,4-тиадиазол-2-ила, триазол-4-ила, триазол-5-ила, пиразол-3-ила, пиразол-5-ила, 1,3,4-оксадиазол-2-ила, 1,2,4-тиадиазол-5-ила, оксазол-4-ила, имидазол-2-ила, изотиазол-5-ила, 2-тиенила, 3-фурила, 2-фурила, изотиазол-4-ила, тиазол-4-ила, 3-тиенила, имидазол-5-ила, изоксазол-5-ила, 1,2,4-оксадиазол-5-ила, 1,2,4-тиадиазол-3-ила, изотиазол-3-ила, 1,2,3-тиадиазол-5-ила, 1,2,5-тиадиазол-3-ила, тиазол-5-ила и 1,2,3-тиадиазол-4-ила, при этом гетероарил необязательно замещен 1, 2 или 3 заместителями R^8 , которые могут быть одинаковыми или различными.

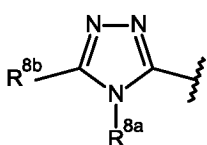
10

15

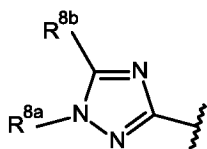
Еще более предпочтительно А выбран из группы, состоящей из формул А-I - А-XXXIV, указанных ниже,



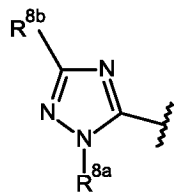
A-I



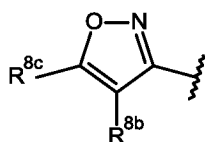
A-II



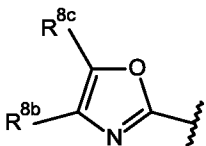
A-III



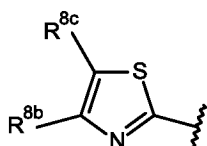
A-IV



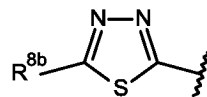
A-V



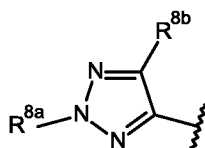
A-VI



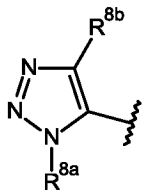
A-VII



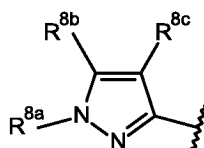
A-VIII



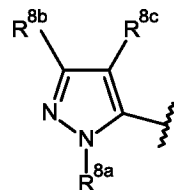
A-IX



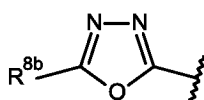
A-X



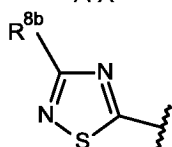
A-XI



A-XII



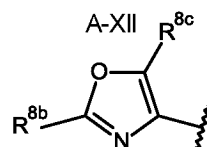
A-XIII



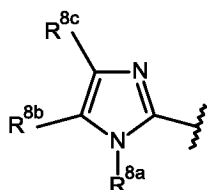
A-XIV



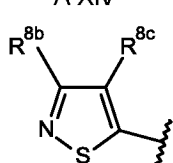
A-XV



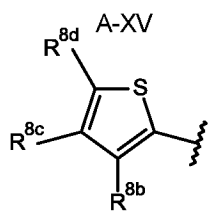
A-XVI



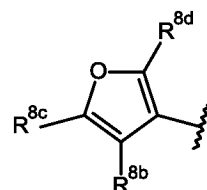
A-XVII



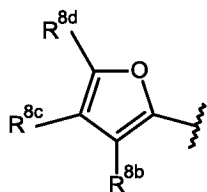
A-XVIII



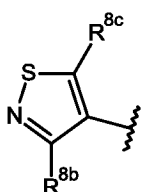
A-XIX



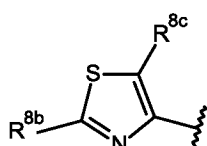
A-XX



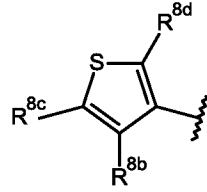
A-XXI



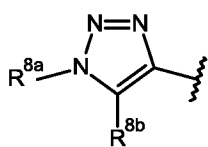
A-XXII



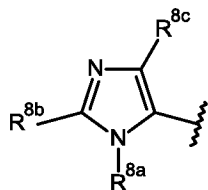
A-XXIII



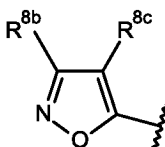
A-XXIV



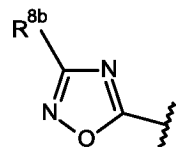
A-XXV



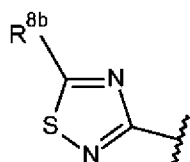
A-XXVI



A-XXVII



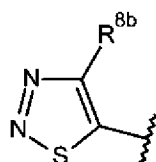
A-XXVIII



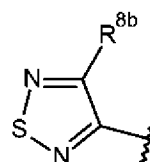
A-XXIX



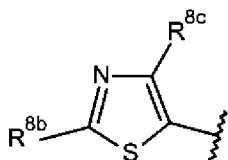
A-XXX



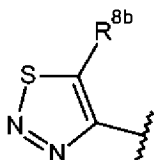
A-XXXI



A-XXXII



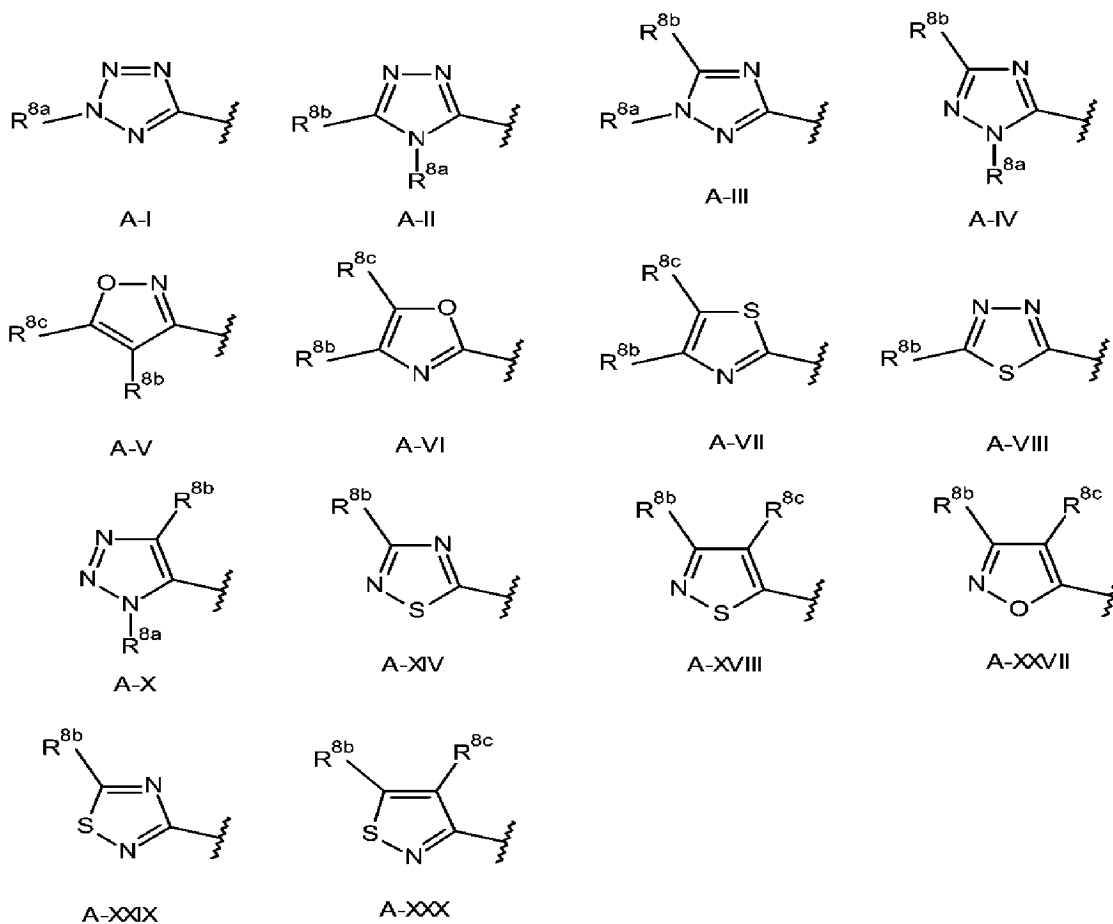
A-XXXIII



A-XXXIV

где волнистая линия обозначает точку присоединения к остальной части соединения формулы (I), и R^{8a} , R^{8b} , R^{8c} , R^{8d} , R^6 , R^7 , R^{10} , R^{15} , R^{16} и R^{17} определены в данном документе. R^{8a} , R^{8b} , R^{8c} , R^{8d} представляют собой примеры R^8 , где применяются надстрочные буквы a, b, c и d для обозначения положений в отдельных гетероциклах (A-I - A-XXXIV).

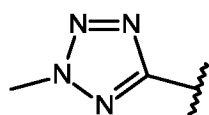
Еще более предпочтительно A выбран из группы, состоящей из формул A-I - A-VIII, A-X, A-XIV, A-XVIII, A-XXVII, A-XXIX и A-XXX, указанных ниже,



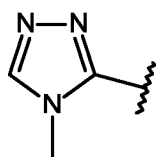
где волнистая линия обозначает точку присоединения к остальной части соединения формулы (I), и R^{8a} , R^{8b} , R^{8c} , R^{8d} и R^7 определены в данном документе.

5

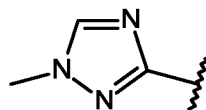
Еще более предпочтительно A выбран из группы, состоящей из формул A-Ia, A-IIa, A-IIIa, A-IVa, A-Va, A-VIa, A-VIb, A-VIc, A-VIIa, A-VIIb, A-VIIIa, A-VIIIb, A-Xa, A-XIVa, A-XVIIIa, A-XVIIIb, A-XXVIIa, A-XXIXa и A-XXXa, указанных ниже,



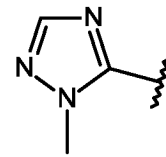
A-Ia



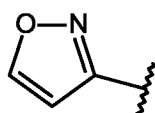
A-IIa



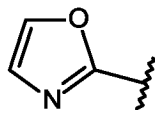
A-IIIa



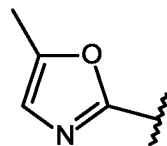
A-IVa



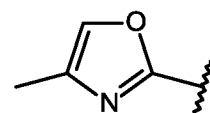
A-Va



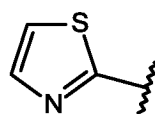
A-VIa



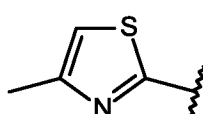
A-VIb



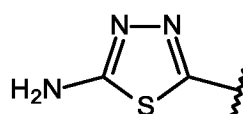
A-VIc



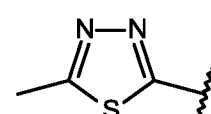
A-VIIa



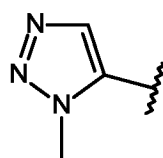
A-VIIb



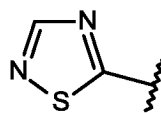
A-VIIIa



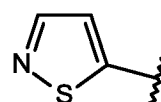
A-VIIIb



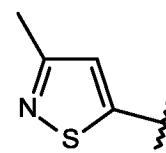
A-Xa



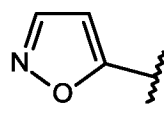
A-XIVa



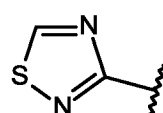
A-XVIIIa



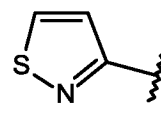
A-XVIIIb



A-XXVIIa



A-XXIXa



A-XXXa

где волнистая линия обозначает точку присоединения к остальной части соединения формулы (I).

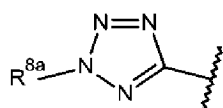
5

В одном варианте осуществления А представляет собой гетероарил, выбранный из группы, состоящей из тетразол-5-ила, 1,2,4-триазол-3-ила, 1,2,4-триазол-5-ила, изоксазол-3-ила, оксазол-2-ила, тиазол-2-ила, 1,3,4-тиадиазол-2-ила, триазол-4-ила, триазол-5-ила, пиразол-3-ила, пиразол-5-ила, 1,3,4-оксадиазол-2-ила, 1,2,4-тиадиазол-5-ила, оксазол-4-ила, имидазол-2-ила, изотиазол-5-ила, 2-тиенила, 3-фурила, 2-фурила, изотиазол-4-ила, тиазол-4-ила, 3-тиенила, имидазол-5-ила, изоксазол-5-ила и 1,2,4-оксадиазол-5-ила, при этом гетероарил, если это возможно, может быть необязательно

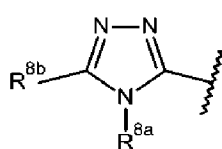
10

замещен 1, 2 или 3 заместителями R^8 , которые могут быть одинаковыми или различными.

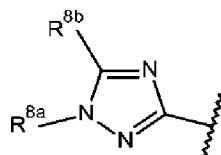
В другом предпочтительном варианте осуществления А выбран из группы, состоящей
5 из формул А-I - А-XXVIII, указанных ниже,



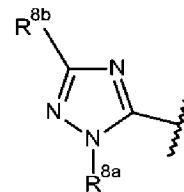
A-I



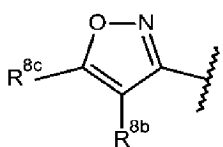
A-II



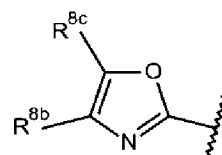
A-III



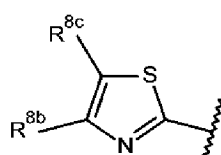
A-IV



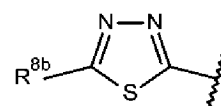
A-V



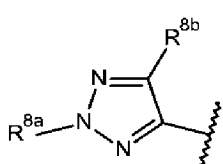
A-VI



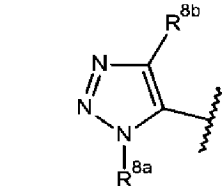
A-VII



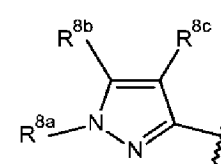
A-VIII



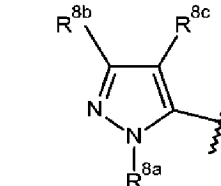
A-IX



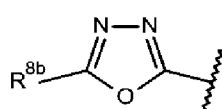
A-X



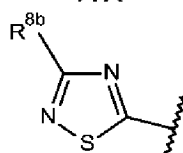
A-XI



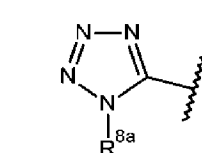
A-XII



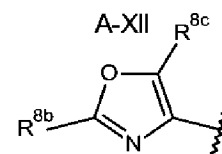
A-XIII



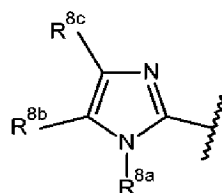
A-XIV



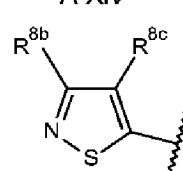
A-XV



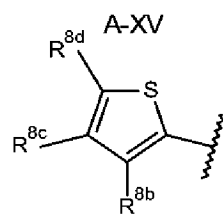
A-XVI



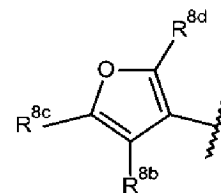
A-XVII



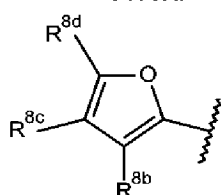
A-XVIII



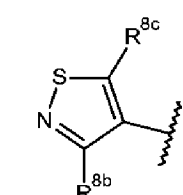
A-XIX



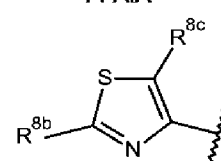
A-XX



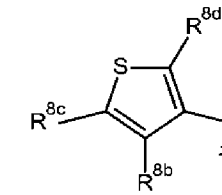
A-XXI



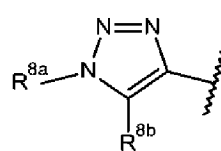
A-XXII



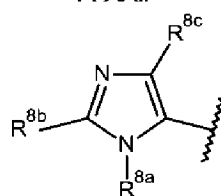
A-XXIII



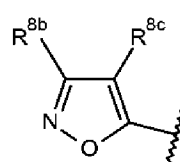
A-XXIV



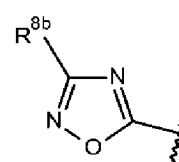
A-XXV



A-XXVI



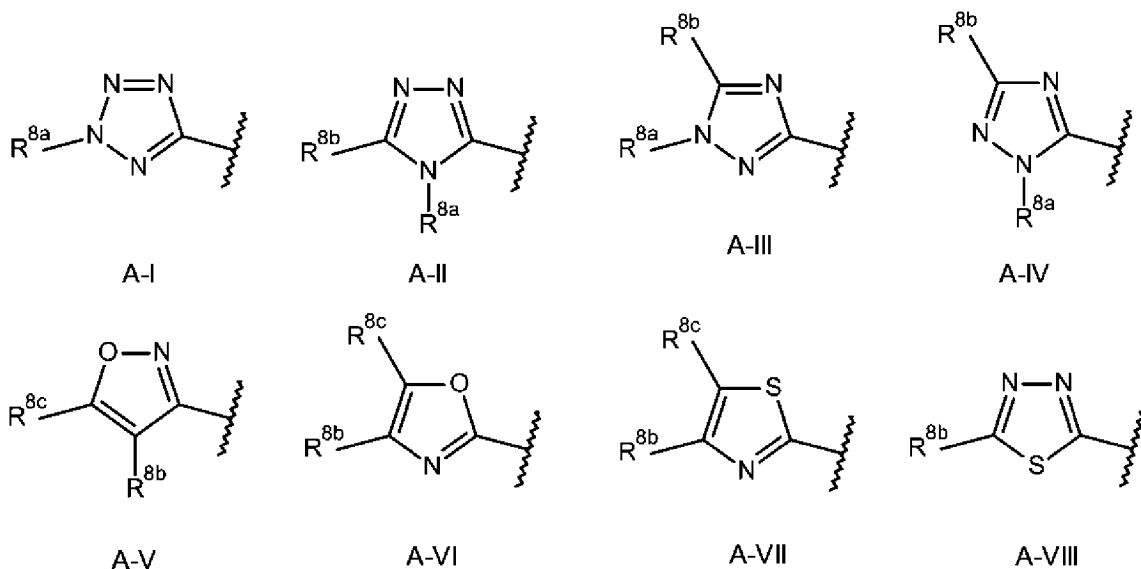
A-XXVII



A-XXVIII

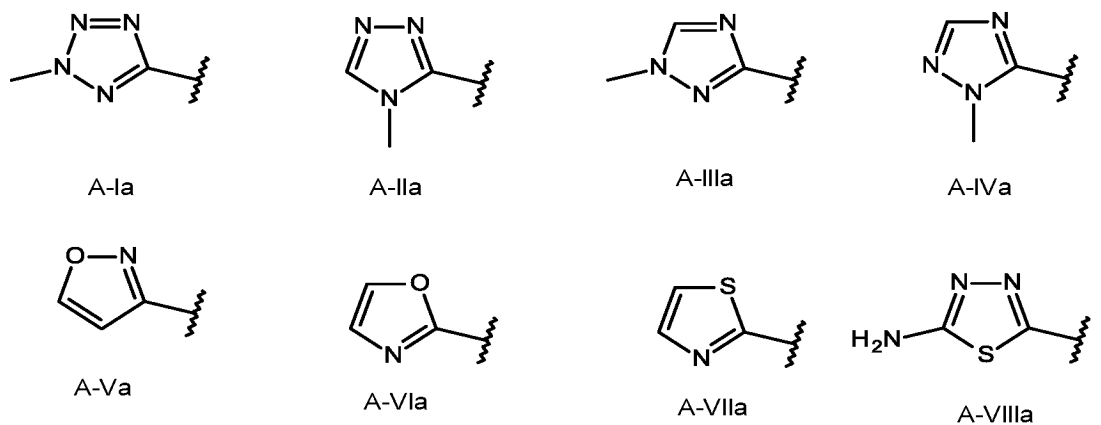
где волнистая линия обозначает точку присоединения к остальной части соединения формулы (I), и R^{8a} , R^{8b} , R^{8c} , R^{8d} , R^6 , R^7 , R^{10} , R^{15} , R^{16} и R^{17} определены в данном документе. R^{8a} , R^{8b} , R^{8c} , R^{8d} представляют собой примеры R^8 , где применяются надстрочные буквы a, b, c и d для обозначения положений в отдельных гетероциклах (A-I - A-XXVIII).

В другом более предпочтительном варианте осуществления А выбран из группы, состоящей из формул A-I - A-VIII, указанных ниже,



где волнистая линия обозначает точку присоединения к остальной части соединения формулы (I), и R^{8a} , R^{8b} , R^{8c} , R^{8d} и R^7 определены в данном документе.

В еще более предпочтительном варианте осуществления А выбран из группы, состоящей из формул A-Ia - A-VIIIa, указанных ниже,



где волнистая линия обозначает точку присоединения к остальной части соединения формулы (I).

5

Если А замещен по одному или нескольким атомам углерода в кольце, каждый R^8 независимо выбран из группы, состоящей из галогена, нитро, циано, $-NH_2$, $-NHR^7$, $-N(R^7)_2$, $-OH$, $-OR^7$, $-S(O)_rR^{15}$, $-NR^6S(O)_2R^{15}$, $-C(O)OR^{10}$, $-C(O)R^{15}$, $-C(O)NR^{16}R^{17}$, $-S(O)_2NR^{16}R^{17}$, C_1 - C_6 алкила, C_1 - C_6 галогеналкила, C_3 - C_6 циклоалкила, C_3 - C_6 галогенциклоалкила, C_3 - C_6 циклоалкокси, C_2 - C_6 алкенила, C_2 - C_6 галогеналкенила, C_2 - C_6 алкинила, C_1 - C_3 алкокси C_1 - C_3 алкил-, гидроксиг C_1 - C_6 алкил-, C_1 - C_3 алкокси C_1 - C_3 алкокси-, C_1 - C_6 галогеналкокси, C_1 - C_3 галогеналкокси C_1 - C_3 алкил-, C_3 - C_6 алкенилокси, C_3 - C_6 алкинилокси, N - C_3 - C_6 циклоалкиламино, $-C(R^6)=NOR^6$, фенила, 3-6-членного гетероциклила, который содержит 1 или 2 гетероатома, по отдельности выбранные из N и O, и 5- или 6-членного гетероарила, который содержит 1, 2, 3 или 4 гетероатома, независимо выбранные из N, O и S, и при этом указанные фенил, гетероциклил или гетероарил необязательно замещены 1, 2 или 3 заместителями R^9 , которые могут быть одинаковыми или различными.

Предпочтительно, если А замещен по одному или нескольким атомам углерода в кольце, каждый R^8 независимо выбран из группы, состоящей из галогена, нитро, циано, $-NH_2$, $-NHR^7$, $-N(R^7)_2$, $-OH$, $-OR^7$, $-S(O)_rR^{15}$, $-NR^6S(O)_2R^{15}$, $-C(O)OR^{10}$, $-C(O)R^{15}$, $-C(O)NR^{16}R^{17}$, $-S(O)_2NR^{16}R^{17}$, C_1 - C_6 алкила, C_1 - C_6 галогеналкила, C_3 - C_6 циклоалкила, C_3 - C_6 галогенциклоалкила, C_3 - C_6 циклоалкокси, C_2 - C_6 алкенила, C_2 - C_6 галогеналкенила, C_2 - C_6 алкинила, C_1 - C_3 алкокси C_1 - C_3 алкил-, гидроксиг C_1 - C_6 алкил-, C_1 - C_3 алкокси C_1 - C_3 алкокси-, C_1 - C_6 галогеналкокси, C_1 - C_3 галогеналкокси C_1 - C_3 алкил-, C_3 - C_6 алкенилокси,

C_3 - C_6 алкинилокси, $-C(R^6)=NOR^6$, фенила и 5- или 6-членного гетероарила, который содержит 1, 2, 3 или 4 гетероатома, независимо выбранные из N, O и S, и при этом указанные фенил или гетероарил необязательно замещены 1, 2 или 3 заместителями R^9 , которые могут быть одинаковыми или различными.

5

Более предпочтительно, если А замещен по одному или нескольким атомам углерода в кольце, каждый R^8 независимо выбран из группы, состоящей из галогена, нитро, циано, $-NH_2$, $-NHR^7$, $-N(R^7)_2$, $-OH$, $-OR^7$, $-S(O)_rR^{15}$, $-NR^6S(O)_2R^{15}$, $-C(O)OR^{10}$, $-C(O)R^{15}$, $-C(O)NR^{16}R^{17}$, $-S(O)_2NR^{16}R^{17}$, C_1 - C_6 алкила, C_1 - C_6 галогеналкила, C_3 - C_6 циклоалкила, C_1 - C_3 алкокси C_1 - C_3 алкил-, гидроксиг C_1 - C_6 алкил-, C_1 - C_3 алкокси C_1 - C_3 алкокси-, C_1 - C_6 галогеналкокси, фенила и 6-членного гетероарила, который содержит 1 или 2 атома азота, и при этом указанные фенил или гетероарил необязательно замещены 1 или 2 заместителями R^9 , которые могут быть одинаковыми или различными.

10

Еще более предпочтительно, если А замещен по одному или нескольким атомам углерода в кольце, каждый R^8 независимо выбран из группы, состоящей из галогена, нитро, циано, $-NH_2$, $-NHR^7$, $-N(R^7)_2$, $-OH$, $-OR^7$, $-S(O)_rR^{15}$, $-NR^6S(O)_2R^{15}$, $-C(O)OR^{10}$, $-C(O)R^{15}$, $-C(O)NR^{16}R^{17}$, $-S(O)_2NR^{16}R^{17}$, C_1 - C_6 алкила, C_1 - C_6 галогеналкила, C_3 - C_6 циклоалкила, гидроксиг C_1 - C_6 алкил-, C_1 - C_6 галогеналкокси и 6-членного гетероарила, который содержит 1 или 2 атома азота, и при этом указанный гетероарил необязательно замещен 1 заместителем R^9 .

20

Еще более предпочтительно, если А замещен по одному или нескольким атомам углерода в кольце, каждый R^8 независимо выбран из группы, состоящей из галогена, циано, $-NH_2$, $-NHR^7$, $-N(R^7)_2$, $-OH$, $-OR^7$, $-S(O)_rR^{15}$, $-C(O)OR^{10}$, $-C(O)R^{15}$, $-C(O)NR^{16}R^{17}$, C_1 - C_6 алкила и C_1 - C_6 галогеналкила.

25

Кроме того, еще более предпочтительно, если А замещен по одному или нескольким атомам углерода в кольце, каждый R^8 независимо выбран из группы, состоящей из хлора, фтора, циано, $-NH_2$, $-NHMe$, $-N(Me)_2$, $-OH$, $-OMe$, $-S(O)_2Me$, $-C(O)OMe$, $-C(O)OEt$, $-C(O)OH$, $-C(O)Me$, $-C(O)NH_2$, $-C(O)NHMe$, $-C(O)N(Me)_2$, метила, изопропила и трифторметила.

30

Кроме того, даже еще более предпочтительно, если А замещен по одному или нескольким атомам углерода в кольце, каждый R^8 независимо выбран из группы, состоящей из хлора, циано, $-NH_2$, $-NHMe$, $-OMe$, $-C(O)OEt$, $-C(O)NHMe$, метила, изопропила и трифторметила.

5

Наиболее предпочтительно, если А замещен по одному или нескольким атомам углерода в кольце, каждый R^8 независимо выбран из группы, состоящей из хлора, $-NH_2$, $-NHMe$, $-OMe$, метила, изопропила и трифторметила.

- 10 Если А замещен по атому азота в кольце, R^8 выбран из группы, состоящей из $-OR^7$, C_1 - C_6 алкила, C_1 - C_6 галогеналкила, C_3 - C_6 циклоалкила, C_3 - C_6 галогенциклоалкила, C_3 - C_6 циклоалкокси, C_2 - C_6 алкенила, C_2 - C_6 галогеналкенила, C_2 - C_6 алкинила, C_1 - C_3 алкокси C_1 - C_3 алкил-, гидроксид C_1 - C_6 алкил-, C_1 - C_3 алкокси C_1 - C_3 алкокси-, C_1 - C_6 галогеналкокси, C_1 - C_3 галогеналкокси C_1 - C_3 алкил-, C_3 - C_6 алкенилокси и C_3 - C_6 алкинилокси. Предпочтительно R^8 выбран из группы, состоящей из $-OR^7$, C_1 - C_6 алкила и C_1 - C_6 галогеналкила. Более предпочтительно R^8 представляет собой $-OR^7$ или C_1 - C_6 алкил. Еще более предпочтительно R^8 представляет собой C_1 - C_6 алкил. Наиболее предпочтительно R^8 представляет собой метил.
- 15
- 20 Если А выбран из группы, состоящей из формул A-I - A-XXXIV, R^{8a} (замещенный по атому азота в кольце) выбран из группы, состоящей из водорода, C_1 - C_6 алкила и C_1 - C_6 галогеналкила, и каждый из R^{8b} , R^{8c} и R^{8d} (замещенных по атому углерода в кольце) независимо выбран из группы, состоящей из водорода, галогена, нитро, циано, $-NH_2$, $-NHR^7$, $-N(R^7)_2$, $-OH$, $-OR^7$, $-S(O)_tR^{15}$, $-NR^6S(O)_2R^{15}$, $-C(O)OR^{10}$, $-C(O)R^{15}$, $-C(O)NR^{16}R^{17}$, $-S(O)_2NR^{16}R^{17}$, C_1 - C_6 алкила и C_1 - C_6 галогеналкила. Предпочтительно R^{8a} представляет собой водород или C_1 - C_6 алкил, и каждый из R^{8b} , R^{8c} и R^{8d} независимо выбран из группы, состоящей из водорода, галогена, циано, $-NH_2$, $-NHR^7$, $-N(R^7)_2$, $-OH$, $-OR^7$, $-S(O)_tR^{15}$, $-C(O)OR^{10}$, $-C(O)R^{15}$, $-C(O)NR^{16}R^{17}$, C_1 - C_6 алкила и C_1 - C_6 галогеналкила. Более предпочтительно R^{8a} представляет собой водород или метил, и каждый из R^{8b} , R^{8c} и R^{8d} независимо выбран из группы, состоящей из водорода, хлора, циано, $-NH_2$, $-NHMe$, $-OMe$, $-C(O)OEt$, $-C(O)NHMe$, метила, изопропила и трифторметила. Еще более предпочтительно R^{8a} представляет собой водород или метил, и каждый из R^{8b} , R^{8c} и R^{8d} независимо выбран из группы, состоящей из водорода, хлора, $-NH_2$, $-NHMe$, $-OMe$, метила, изопропила и трифторметила.
- 25
- 30

- В одном варианте осуществления, если А выбран из группы, состоящей из формул А-I - А-XXVIII, R^{8a} (замещенный по атому азота в кольце) выбран из группы, состоящей из водорода, C_1 - C_6 алкила и C_1 - C_6 галогеналкила, и каждый из R^{8b} , R^{8c} и R^{8d} (замещенных по атому углерода в кольце) независимо выбран из группы, состоящей из водорода, галогена, нитро, циано, $-NH_2$, $-NHR^7$, $-N(R^7)_2$, $-OH$, $-OR^7$, $-S(O)_tR^{15}$, $-NR^6S(O)_2R^{15}$, $-C(O)OR^{10}$, $-C(O)R^{15}$, $-C(O)NR^{16}R^{17}$, $-S(O)_2NR^{16}R^{17}$, C_1 - C_6 алкила и C_1 - C_6 галогеналкила. Предпочтительно R^{8a} представляет собой водород или C_1 - C_6 алкил, и каждый из R^{8b} , R^{8c} и R^{8d} независимо выбран из группы, состоящей из водорода, галогена, $-NH_2$, $-NHR^7$, $-N(R^7)_2$, $-OR^7$, C_1 - C_6 алкила и C_1 - C_6 галогеналкила. Более предпочтительно R^{8a} представляет собой водород или метил, и каждый из R^{8b} , R^{8c} и R^{8d} независимо выбран из группы, состоящей из водорода, хлора, $-NH_2$, $-NHMe$, $-OMe$, метила, изопропила и трифторметила.
- Если А выбран из группы, состоящей из формул А-I - А-VIII, А-X, А-XIV, А-XVIII, А-XXVII, А-XXIX и А-XXX, R^{8a} (замещенный по атому азота в кольце) представляет собой водород или C_1 - C_6 алкил, и каждый из R^{8b} , R^{8c} и R^{8d} (замещенных по атому углерода в кольце) независимо выбран из группы, состоящей из водорода, галогена, циано, $-NH_2$, $-NHR^7$, $-N(R^7)_2$, $-OH$, $-OR^7$, $-S(O)_tR^{15}$, $-C(O)OR^{10}$, $-C(O)R^{15}$, $-C(O)NR^{16}R^{17}$, C_1 - C_6 алкила и C_1 - C_6 галогеналкила. Предпочтительно R^{8a} представляет собой водород или метил, и каждый из R^{8b} , R^{8c} и R^{8d} независимо выбран из группы, состоящей из водорода, хлора, циано, $-NH_2$, $-NHMe$, $-OMe$, $-C(O)OEt$, $-C(O)NHMe$, метила, изопропила и трифторметила. Еще более предпочтительно R^{8a} представляет собой водород или метил, и каждый из R^{8b} , R^{8c} и R^{8d} независимо выбран из группы, состоящей из водорода, хлора, $-NH_2$, $-NHMe$, $-OMe$, метила, изопропила и трифторметила.

- В одном варианте осуществления, если А выбран из группы, состоящей из формул А-I - А-VIII, R^{8a} (замещенный по атому азота в кольце) представляет собой водород или C_1 - C_6 алкил, и каждый из R^{8b} , R^{8c} и R^{8d} (замещенных по атому углерода в кольце) независимо выбран из группы, состоящей из водорода, галогена, $-NH_2$, $-NHR^7$, $-N(R^7)_2$, $-OR^7$, C_1 - C_6 алкила и C_1 - C_6 галогеналкила. Предпочтительно R^{8a} представляет собой водород или метил, и каждый из R^{8b} , R^{8c} и R^{8d} независимо выбран из группы,

состоящей из водорода, хлора, $-NH_2$, $-NHMe$, $-OMe$, метила, изопропила и трифторметила.

Каждый R^9 независимо выбран из группы, состоящей из галогена, циано, $-OH$, $-N(R^6)_2$, C_1-C_4 алкила, C_1-C_4 алкокси, C_1-C_4 галогеналкила и C_1-C_4 галогеналкокси. Предпочтительно каждый R^9 независимо выбран из группы, состоящей из галогена, циано, $-N(R^6)_2$, C_1-C_4 алкила, C_1-C_4 алкокси, C_1-C_4 галогеналкила и C_1-C_4 галогеналкокси. Более предпочтительно каждый R^9 независимо выбран из группы, состоящей из галогена, C_1-C_4 алкила, C_1-C_4 алкокси и C_1-C_4 галогеналкила. Еще более предпочтительно каждый R^9 независимо выбран из группы, состоящей из галогена и C_1-C_4 алкила.

X независимо выбран из группы, состоящей из C_3-C_6 циклоалкила, фенила, 5- или 6-членного гетероарила, который содержит 1, 2, 3 или 4 гетероатома, независимо выбранные из N, O и S, и 4-6-членного гетероциклила, который содержит 1, 2 или 3 гетероатома, независимо выбранные из N, O и S, и при этом указанные циклоалкильные, фенильные, гетероарильные или гетероциклильные фрагменты необязательно замещены 1 или 2 заместителями, которые могут быть одинаковыми или различными, выбранными из R^9 , и при этом вышеуказанные фрагменты CR^1R^2 и Z или Q и Z могут быть присоединены в любом положении указанных циклоалкильных, фенильных, гетероарильных или гетероциклильных фрагментов.

Предпочтительно X независимо выбран из группы, состоящей из фенила и 4-6-членного гетероциклила, который содержит 1 или 2 гетероатома, независимо выбранные из N и O, и при этом указанные фенильные или гетероциклильные фрагменты необязательно замещены 1 или 2 заместителями, которые могут быть одинаковыми или различными, выбранными из R^9 , и при этом вышеуказанные фрагменты CR^1R^2 , Q и Z могут быть присоединены в любом положении указанных гетероциклильных или фенильных фрагментов.

Более предпочтительно X независимо выбран из группы, состоящей из фенила и 5-членного гетероциклила, который содержит 1 гетероатом, где указанный гетероатом представляет собой N, и при этом указанные фенильные или гетероциклильные фрагменты необязательно замещены 1 или 2 заместителями, которые могут быть одинаковыми или различными, выбранными из R^9 , и при этом вышеуказанные

фрагменты CR^1R^2 , Q и Z могут быть присоединены в любом положении указанных гетероциклических или фенильных фрагментов.

5 Еще более предпочтительно X представляет собой 5-членный гетероцикл, который содержит 1 гетероатом, где указанный гетероатом представляет собой N, и при этом вышеуказанные фрагменты CR^1R^2 и Q присоединены рядом с атомом N, и фрагмент Z присоединен к атому N, или X представляет собой фенил, и вышеуказанные фрагменты CR^1R^2 и Q присоединены в орто- или метоположении к фрагменту Z.

10 В одном варианте осуществления X представляет собой 4-6-членный гетероцикл, который содержит 1 или 2 гетероатома, независимо выбранные из N и O, и при этом указанные гетероциклические фрагменты необязательно замещены 1 или 2 заместителями, которые могут быть одинаковыми или различными, выбранными из R^9 .

15 n равняется 0 или 1. Предпочтительно n равняется 0.

Z выбран из группы, состоящей из $-C(O)OR^{10}$, $-CH_2OH$, $-CHO$, $-C(O)NHOR^{11}$, $-C(O)NHCN$, $-OC(O)NHOR^{11}$, $-OC(O)NHCN$, $-NR^6C(O)NHOR^{11}$, $-NR^6C(O)NHCN$, $-C(O)NHS(O)_2R^{12}$, $-OC(O)NHS(O)_2R^{12}$, $-NR^6C(O)NHS(O)_2R^{12}$, $-S(O)_2OR^{10}$, $-OS(O)_2OR^{10}$, $-NR^6S(O)_2OR^{10}$, $-NR^6S(O)OR^{10}$, $-NHS(O)_2R^{14}$, $-S(O)OR^{10}$, $-OS(O)OR^{10}$, $-S(O)_2NHCN$, $-S(O)_2NHC(O)R^{18}$, $-S(O)_2NHS(O)_2R^{12}$, $-OS(O)_2NHCN$, $-OS(O)_2NHS(O)_2R^{12}$, $-OS(O)_2NHC(O)R^{18}$, $-NR^6S(O)_2NHCN$, $-NR^6S(O)_2NHC(O)R^{18}$, $-N(OH)C(O)R^{15}$, $-ONHC(O)R^{15}$, $-NR^6S(O)_2NHS(O)_2R^{12}$, $-P(O)(R^{13})(OR^{10})$, $-P(O)H(OR^{10})$, $-OP(O)(R^{13})(OR^{10})$, $-NR^6P(O)(R^{13})(OR^{10})$ и тетразола.

25 Предпочтительно Z выбран из группы, состоящей из $-C(O)OR^{10}$, $-C(O)NHOR^{11}$, $-OC(O)NHOR^{11}$, $-NR^6C(O)NHOR^{11}$, $-C(O)NHS(O)_2R^{12}$, $-OC(O)NHS(O)_2R^{12}$, $-NR^6C(O)NHS(O)_2R^{12}$, $-S(O)_2OR^{10}$, $-OS(O)_2OR^{10}$, $-NR^6S(O)_2OR^{10}$, $-NR^6S(O)OR^{10}$, $-NHS(O)_2R^{14}$, $-S(O)OR^{10}$, $-OS(O)OR^{10}$, $-S(O)_2NHC(O)R^{18}$, $-S(O)_2NHS(O)_2R^{12}$, $-OS(O)_2NHS(O)_2R^{12}$, $-OS(O)_2NHC(O)R^{18}$, $-NR^6S(O)_2NHC(O)R^{18}$, $-N(OH)C(O)R^{15}$, $-ONHC(O)R^{15}$, $-NR^6S(O)_2NHS(O)_2R^{12}$, $-P(O)(R^{13})(OR^{10})$, $-P(O)H(OR^{10})$, $-OP(O)(R^{13})(OR^{10})$ и $-NR^6P(O)(R^{13})(OR^{10})$.

Более предпочтительно Z выбран из группы, состоящей из $-C(O)OR^{10}$, $-C(O)NHOR^{11}$, $-C(O)NHS(O)_2R^{12}$, $-S(O)_2OR^{10}$, $-OS(O)_2OR^{10}$, $-NR^6S(O)_2OR^{10}$, $-NHS(O)_2R^{14}$, $-S(O)OR^{10}$ и $-P(O)(R^{13})(OR^{10})$.

- 5 Еще более предпочтительно Z выбран из группы, состоящей из $-C(O)OR^{10}$, $-C(O)NHS(O)_2R^{12}$, $-S(O)_2OR^{10}$, $-OS(O)_2OR^{10}$ и $-P(O)(R^{13})(OR^{10})$.

Еще более предпочтительно Z выбран из группы, состоящей из $-C(O)OR^{10}$, $-S(O)_2OR^{10}$ и $-OS(O)_2OR^{10}$.

10

Даже еще более предпочтительно Z выбран из группы, состоящей из $-C(O)OH$, $-C(O)OCH_2CH_3$, $-S(O)_2OH$, $-S(O)_2OCH_2C(CH_3)_3$ и $-OS(O)_2OH$.

Наиболее предпочтительно Z представляет собой $-C(O)OH$ или $-S(O)_2OH$.

15

В одном варианте осуществления Z выбран из группы, состоящей из $-C(O)OR^{10}$, $-CH_2OH$, $-C(O)NHS(O)_2R^{12}$, $-S(O)_2OR^{10}$, $-OS(O)_2OR^{10}$, $-NR^6S(O)_2OR^{10}$ и $-P(O)(R^{13})(OR^{10})$.
Предпочтительно Z выбран из группы, состоящей из $-C(O)OH$, $-C(O)OCH_3$, $-C(O)OCH_2CH_3$, $-CH_2OH$, $-C(O)NHS(O)_2CH_3$, $-S(O)_2OH$, $-S(O)_2OCH_2C(CH_3)_3$, $-OS(O)_2OH$,
20 $-NHS(O)_2OH$, $-P(O)(OH)(OH)$, $-P(O)(OCH_3)(OCH_3)$, $-P(O)(OH)(OCH_3)$, $-P(O)(OH)(OCH_2CH_3)$ и $-P(O)(OCH_2CH_3)(OCH_2CH_3)$.

25

R^{10} выбран из группы, состоящей из водорода, C_1 - C_6 алкила, фенила и бензила, и где указанные фенил или бензил необязательно замещены 1, 2 или 3 заместителями R^9 ,
которые могут быть одинаковыми или различными. Предпочтительно R^{10} выбран из группы, состоящей из водорода, C_1 - C_6 алкила, фенила и бензила. Более предпочтительно R^{10} выбран из группы, состоящей из водорода и C_1 - C_6 алкила. Наиболее предпочтительно R^{10} представляет собой водород.

30

R^{11} выбран из группы, состоящей из водорода, C_1 - C_6 алкила и фенила, и где указанный фенил необязательно замещен 1, 2 или 3 заместителями R^9 , которые могут быть одинаковыми или различными. Предпочтительно R^{11} выбран из группы, состоящей из водорода, C_1 - C_6 алкила и фенила. Более предпочтительно R^{11} выбран из группы,

состоящей из водорода и C_1 - C_6 алкила. Еще более предпочтительно R^{11} представляет собой C_1 - C_6 алкил. Наиболее предпочтительно R^{11} представляет собой метил.

R^{12} выбран из группы, состоящей из C_1 - C_6 алкила, C_1 - C_6 галогеналкила, C_1 - C_6 алкокси, -ОН, $-N(R^6)_2$ и фенила, и где указанный фенил необязательно замещен 1, 2 или 3 заместителями R^9 , которые могут быть одинаковыми или различными. Предпочтительно R^{12} выбран из группы, состоящей из C_1 - C_6 алкила, C_1 - C_6 галогеналкила, C_1 - C_6 алкокси, -ОН, $-N(R^6)_2$ и фенила. Более предпочтительно R^{12} выбран из группы, состоящей из C_1 - C_6 алкила, C_1 - C_6 галогеналкила и $-N(R^6)_2$. Еще более предпочтительно R^{12} выбран из группы, состоящей из метила, $-N(Me)_2$ и трифторметила. Наиболее предпочтительно R^{12} представляет собой метил.

R^{13} выбран из группы, состоящей из -ОН, C_1 - C_6 алкила, C_1 - C_6 алкокси и фенила. Предпочтительно R^{13} выбран из группы, состоящей из -ОН, C_1 - C_6 алкила и C_1 - C_6 алкокси. Более предпочтительно R^{13} выбран из группы, состоящей из -ОН и C_1 - C_6 алкокси. Еще более предпочтительно R^{13} выбран из группы, состоящей из -ОН, метокси и этокси. Наиболее предпочтительно R^{13} представляет собой -ОН.

R^{14} представляет собой C_1 - C_6 галогеналкил. Предпочтительно R^{14} представляет собой трифторметил.

R^{15} выбран из группы, состоящей из C_1 - C_6 алкила и фенила, и где указанный фенил необязательно замещен 1, 2 или 3 заместителями R^9 , которые могут быть одинаковыми или различными. Предпочтительно R^{15} выбран из группы, состоящей из C_1 - C_6 алкила и фенила. Более предпочтительно R^{15} представляет собой C_1 - C_6 алкил. Наиболее предпочтительно R^{15} представляет собой метил.

R^{15a} представляет собой фенил, где указанный фенил необязательно замещен 1, 2 или 3 заместителями R^9 , которые могут быть одинаковыми или различными. Предпочтительно R^{15a} представляет собой фенил, необязательно замещенный 1 заместителем R^9 . Более предпочтительно R^{15a} представляет собой фенил.

R^{16} и R^{17} независимо выбраны из группы, состоящей из водорода и C_1 - C_6 алкила. Предпочтительно R^{16} и R^{17} независимо выбраны из группы, состоящей из водорода и метила.

- 5 Альтернативно R^{16} и R^{17} вместе с атомом азота, к которому они присоединены, образуют 4-6-членное гетероциклическое кольцо, которое необязательно содержит один дополнительный гетероатом, независимо выбранный из N, O и S. Предпочтительно R^{16} и R^{17} вместе с атомом азота, к которому они присоединены, образуют 5-6-членное гетероциклическое кольцо, которое необязательно содержит один дополнительный гетероатом, независимо выбранный из N и O. Более предпочтительно R^{16} и R^{17} вместе с атомом азота, к которому они присоединены, образуют пирролидинильную, оксазолидинильную, имидазолидинильную, пиперидильную, пиперазинильную или морфолинийную группу.
- 10
- 15 R^{18} выбран из группы, состоящей из водорода, C_1 - C_6 алкила, C_1 - C_6 галогеналкила, C_1 - C_6 алкокси, $-N(R^6)_2$ и фенила, и где указанный фенил необязательно замещен 1, 2 или 3 заместителями R^9 , которые могут быть одинаковыми или различными. Предпочтительно R^{18} выбран из группы, состоящей из водорода, C_1 - C_6 алкила, C_1 - C_6 галогеналкила, C_1 - C_6 алкокси, $-N(R^6)_2$ и фенила. Более предпочтительно R^{18} выбран из группы, состоящей из водорода, C_1 - C_6 алкила и C_1 - C_6 галогеналкила. Кроме того, более предпочтительно R^{18} выбран из группы, состоящей из C_1 - C_6 алкила и C_1 - C_6 галогеналкила. Наиболее предпочтительно R^{18} представляет собой метил или трифторметил.
- 20
- 25 г равняется 0, 1 или 2. Предпочтительно г равняется 0 или 2.

В группе предпочтительных вариантов осуществления в соединении в соответствии с формулой (I) по настоящему изобретению,

R^1 представляет собой водород или C_1 - C_6 алкил;

- 30 R^2 представляет собой водород или метил;

Q представляет собой $(CR^{1a}R^{2b})_m$;

m равняется 0, 1 или 2;

R^{1a} и R^{2b} независимо выбраны из группы, состоящей из водорода, C_1 - C_6 алкила, $-OH$ и $-NH_2$;

R^3 , R^4 и R^5 независимо выбраны из группы, состоящей из водорода и C_1 - C_6 алкила;
 каждый R^6 независимо выбран из водорода и метила;
 каждый R^7 представляет собой C_1 - C_6 алкил;

А представляет собой 5-членный гетероарил, присоединенный к остальной части
 5 молекулы посредством атома углерода в кольце, который содержит 1, 2, 3 или 4
 гетероатома, независимо выбранные из группы, состоящей из N, O и S, и при этом
 гетероарил, если это возможно, может быть необязательно замещен 1, 2 или 3
 заместителями R^8 , которые могут быть одинаковыми или различными;

если А замещен по одному или нескольким атомам углерода в кольце, каждый R^8
 10 независимо выбран из группы, состоящей из галогена, нитро, циано, $-NH_2$, $-NHR^7$, $-N(R^7)_2$, $-OH$, $-OR^7$, $-S(O)_tR^{15}$, $-NR^6S(O)_2R^{15}$, $-C(O)OR^{10}$, $-C(O)R^{15}$, $-C(O)NR^{16}R^{17}$, $-S(O)_2NR^{16}R^{17}$, C_1 - C_6 алкила и C_1 - C_6 галогеналкила;

и/или

если А замещен по атому азота в кольце, R^8 выбран из группы, состоящей из $-OR^7$, C_1 -
 15 C_6 алкила и C_1 - C_6 галогеналкила; и

n равняется 0;

Z выбран из группы, состоящей из $-C(O)OR^{10}$, $-C(O)NHS(O)_2R^{12}$, $-S(O)_2OR^{10}$, $-OS(O)_2OR^{10}$ и $-P(O)(R^{13})(OR^{10})$;

R^{10} выбран из группы, состоящей из водорода, C_1 - C_6 алкила, фенила и бензила;

20 R^{12} выбран из группы, состоящей из C_1 - C_6 алкила, C_1 - C_6 галогеналкила и $-N(R^6)_2$;

R^{13} выбран из группы, состоящей из $-OH$ и C_1 - C_6 алкокси;

R^{15} представляет собой C_1 - C_6 алкил;

R^{16} и R^{17} независимо выбраны из группы, состоящей из водорода и метила; и

г равняется 0 или 2.

25 Более предпочтительно:

R^1 представляет собой водород или метил;

R^2 представляет собой водород или метил;

Q представляет собой $(CR^{1a}R^{2b})_m$;

30 m равняется 1 или 2;

R^{1a} и R^{2b} независимо выбраны из группы, состоящей из водорода и метила;

R^3 , R^4 и R^5 независимо выбраны из группы, состоящей из водорода и метила;

А представляет собой гетероарил, выбранный из группы, состоящей из тетразол-5-ила, 1,2,4-триазол-3-ила, 1,2,4-триазол-5-ила, изоксазол-3-ила, оксазол-2-ила, тиазол-2-ила,

- 1,3,4-тиадиазол-2-ила, триазол-4-ила, триазол-5-ила, пиразол-3-ила, пиразол-5-ила, 1,3,4-оксадиазол-2-ила, 1,2,4-тиадиазол-5-ила, оксазол-4-ила, имидазол-2-ила, изотиазол-5-ила, 2-тиенила, 3-фурила, 2-фурила, изотиазол-4-ила, тиазол-4-ила, 3-тиенила, имидазол-5-ила, изоксазол-5-ила и 1,2,4-оксадиазол-5-ила, при этом
- 5 гетероарил, если это возможно, может быть необязательно замещен 1, 2 или 3 заместителями R^8 , которые могут быть одинаковыми или различными;
- если А замещен по одному или нескольким атомам углерода в кольце, каждый R^8 независимо выбран из группы, состоящей из хлора, $-NH_2$, $-NHMe$, $-OMe$, метила, изопропила и трифторметила;
- 10 и/или
- если А замещен по атому азота в кольце, R^8 представляет собой C_1-C_6 алкил; и
- n равняется 0; и
- Z выбран из группы, состоящей из $-C(O)OR^{10}$, $-S(O)_2OR^{10}$ и $-OS(O)_2OR^{10}$;
- R^{10} представляет собой водород или C_1-C_6 алкил.
- 15 В другой более предпочтительной группе предпочтительных вариантов осуществления в соединении в соответствии с формулой (I) по настоящему изобретению,
- R^1 представляет собой водород или метил;
- R^2 представляет собой водород или метил;
- 20 Q представляет собой $(CR^{1a}R^{2b})_m$;
- m равняется 1 или 2;
- R^{1a} и R^{2b} независимо выбраны из группы, состоящей из водорода и метила;
- R^3 , R^4 и R^5 независимо выбраны из группы, состоящей из водорода и метила;
- каждый R^6 независимо выбран из водорода и метила;
- 25 каждый R^7 представляет собой C_1-C_6 алкил;
- А представляет собой гетероарил, выбранный из группы, состоящей из тетразолила, 1,2,4-триазолила, изоксазолила, оксазолила, тиазолила, 1,3,4-тиадиазолила, 1,2,3-триазолила, пиразолила, 1,3,4-оксадиазолила, 1,2,4-тиадиазолила, имидазолила, изотиазолила, тиенила, фурила, 1,2,4-оксадиазолила, 1,2,3-тиадиазолила и 1,2,5-тиадиазолила, при этом гетероарил необязательно замещен 1, 2 или 3 заместителями R^8 ,
- 30 которые могут быть одинаковыми или различными;
- если А замещен по одному или нескольким атомам углерода в кольце, каждый R^8 независимо выбран из группы, состоящей из галогена, циано, $-NH_2$, $-NHR^7$, $-N(R^7)_2$, -

ОН, $-OR^7$, $-S(O)_rR^{15}$, $-C(O)OR^{10}$, $-C(O)R^{15}$, $-C(O)NR^{16}R^{17}$, C_1 - C_6 алкила и C_1 - C_6 галогеналкила;

и/или

если А замещен по атому азота в кольце, R^8 представляет собой C_1 - C_6 алкил; и

5 n равняется 0; и

Z выбран из группы, состоящей из $-C(O)OR^{10}$, $-CH_2OH$, $-C(O)NHS(O)_2R^{12}$, $-S(O)_2OR^{10}$, $-OS(O)_2OR^{10}$, $-NR^6S(O)_2OR^{10}$ и $-P(O)(R^{13})(OR^{10})$;

R^{10} представляет собой водород или C_1 - C_6 алкил;

R^{12} выбран из группы, состоящей из C_1 - C_6 алкила, C_1 - C_6 галогеналкила и $-N(R^6)_2$; и

10 R^{13} выбран из группы, состоящей из $-OH$ и C_1 - C_6 алкокси;

R^{15} представляет собой C_1 - C_6 алкил;

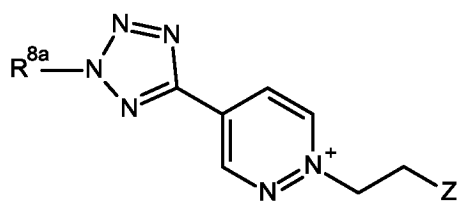
R^{16} и R^{17} независимо выбраны из группы, состоящей из водорода и метила; и

r равняется 0 или 2.

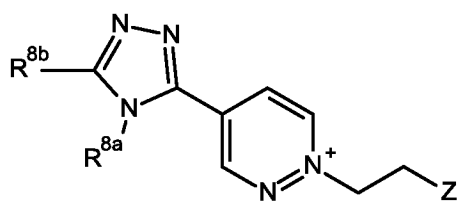
15

В дополнительной группе предпочтительных вариантов осуществления соединение в соответствии с формулой (I) выбрано из группы, состоящей из соединения формул (I-a), (I-b), (I-c), (I-d), (I-e), (I-f), (I-g), (I-h), (I-j), (I-k), (I-m), (I-n), (I-p), (I-q), (I-r), (I-s), (I-t), (I-u), (I-v), (I-w), (I-x), (I-y), (I-z), (I-a'), (I-b'), (I-c'), (I-d') и (I-e'), указанных ниже,

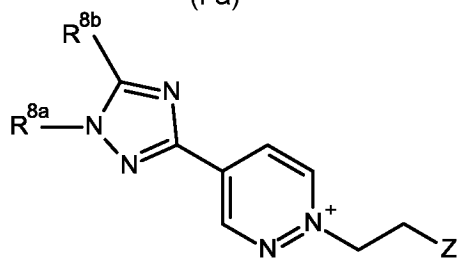
20



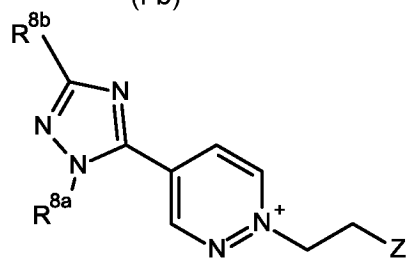
(I-a)



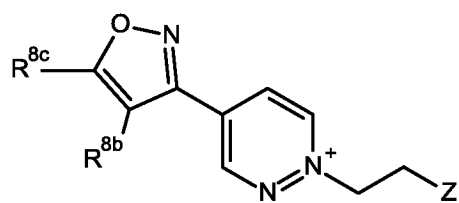
(I-b)



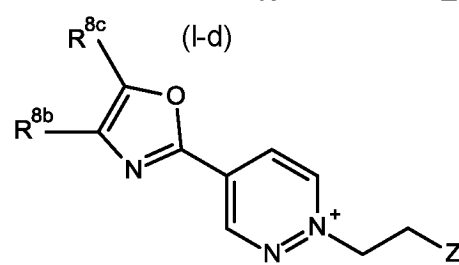
(I-c)



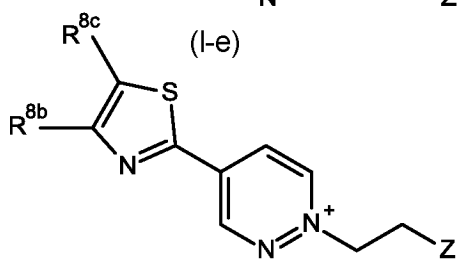
(I-d)



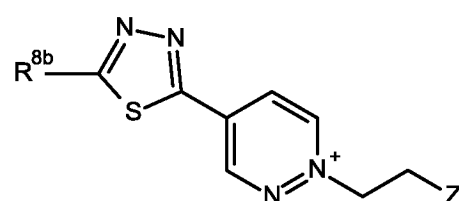
(I-e)



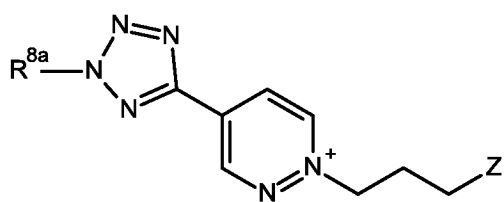
(I-f)



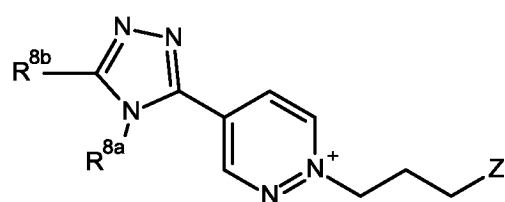
(I-g)



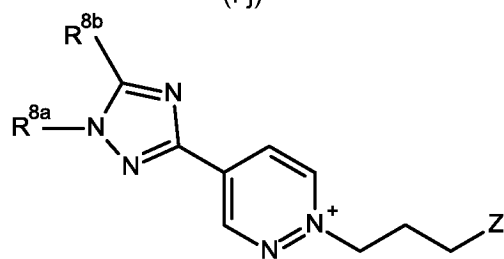
(I-h)



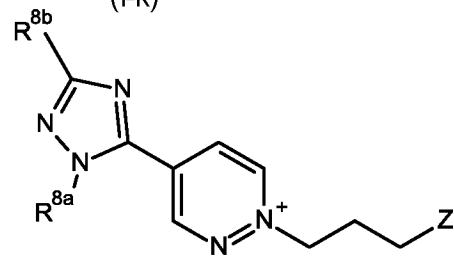
(I-j)



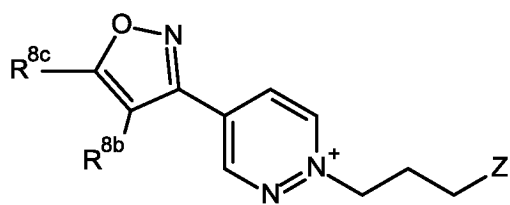
(I-k)



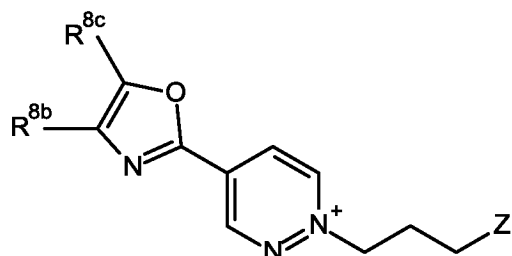
(I-m)



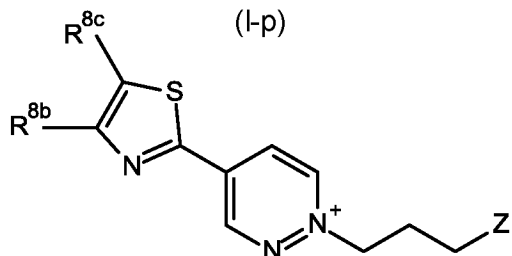
(I-n)



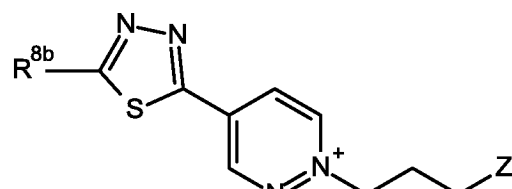
(l-p)



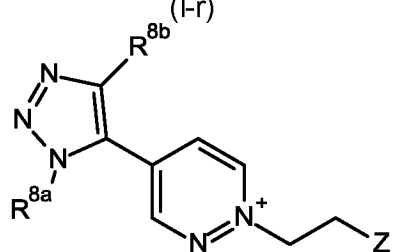
(l-q)



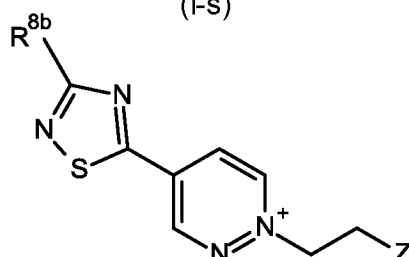
(l-r)



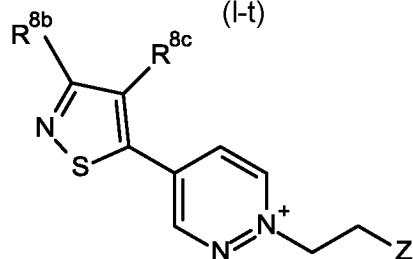
(l-s)



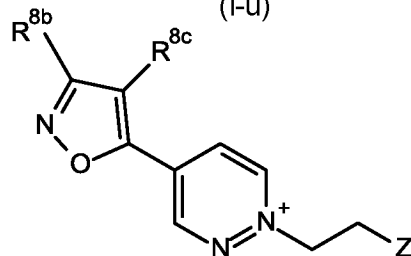
(l-t)



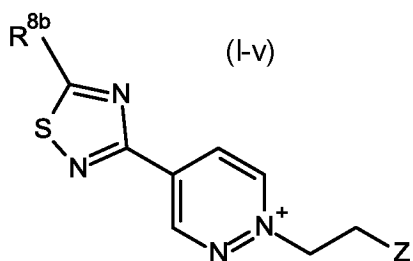
(l-u)



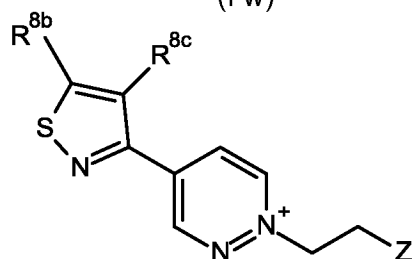
(l-v)



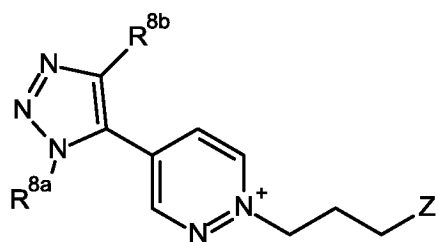
(l-w)



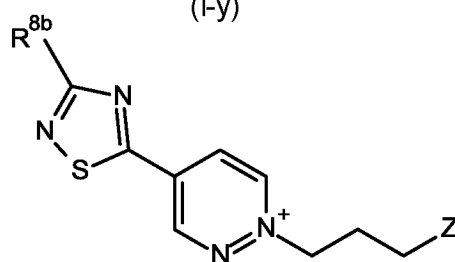
(l-x)



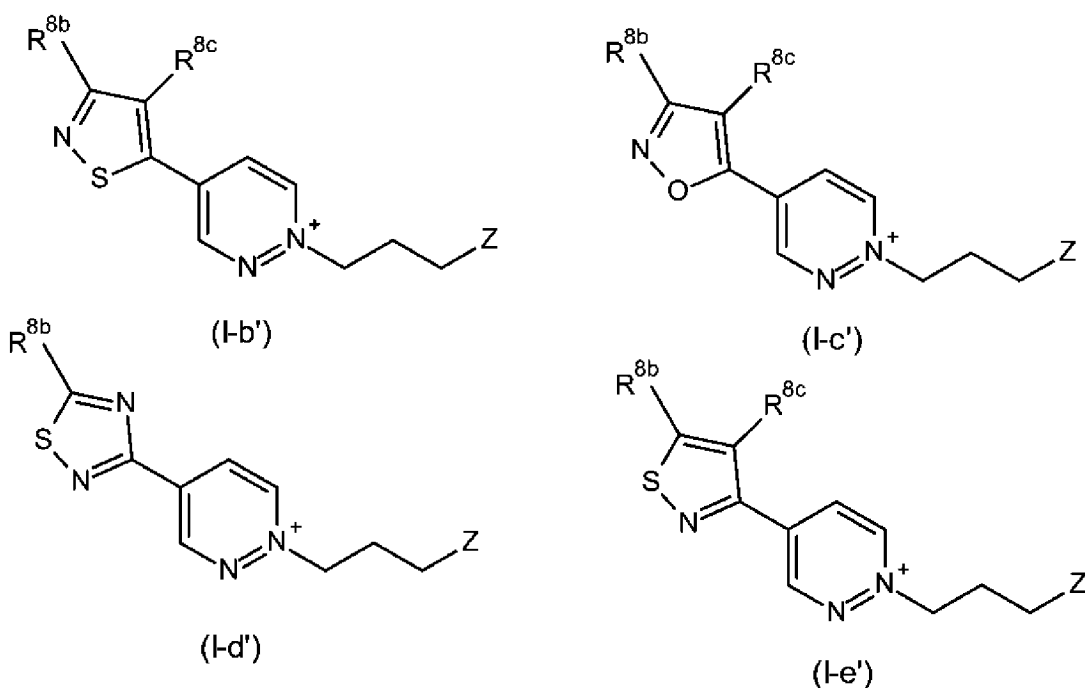
(l-y)



(l-z)



(l-a')



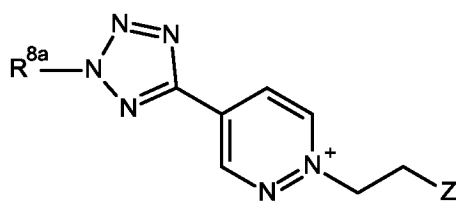
где в соединении формул (I-a), (I-b), (I-c), (I-d), (I-e), (I-f), (I-g), (I-h), (I-j), (I-k), (I-m), (I-n), (I-p), (I-q), (I-r), (I-s), (I-t), (I-u), (I-v), (I-w), (I-x), (I-y), (I-z), (I-a'), (I-b'), (I-c'), (I-d') и (I-e')

R^{8a} представляет собой водород или C_1 - C_6 алкил;

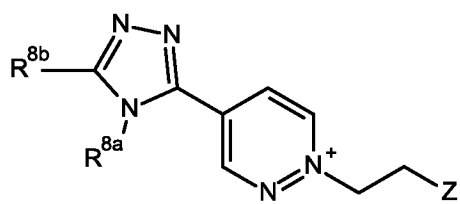
каждый из R^{8b} , R^{8c} и R^{8d} независимо выбран из группы, состоящей из водорода, хлора, циано, $-NH_2$, $-NHMe$, $-OMe$, $-C(O)OEt$, $-C(O)NHMe$, метила, изопропила и трифторметила; и

Z выбран из группы, состоящей из $-C(O)OH$, $-C(O)OCH_3$, $-C(O)OCH_2CH_3$, $-CH_2OH$, $-C(O)NHS(O)_2CH_3$, $-S(O)_2OH$, $-S(O)_2OCH_2C(CH_3)_3$, $-OS(O)_2OH$, $-NHS(O)_2OH$, $-P(O)(OH)(OH)$, $-P(O)(OCH_3)(OCH_3)$, $-P(O)(OH)(OCH_3)$, $-P(O)(OH)(OCH_2CH_3)$ и $-P(O)(OCH_2CH_3)(OCH_2CH_3)$.

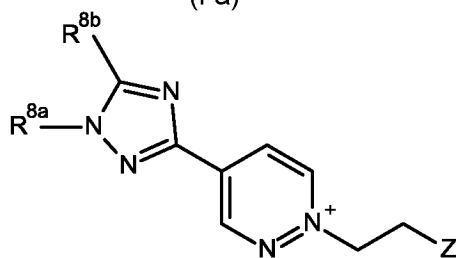
В другой группе предпочтительных вариантов осуществления соединение в соответствии с формулой (I) выбрано из соединений формул (I-a), (I-b), (I-c), (I-d), (I-e), (I-f), (I-g), (I-h), (I-j), (I-k), (I-m), (I-n), (I-p), (I-q), (I-r) или (I-s),



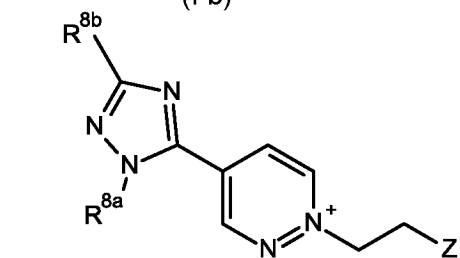
(I-a)



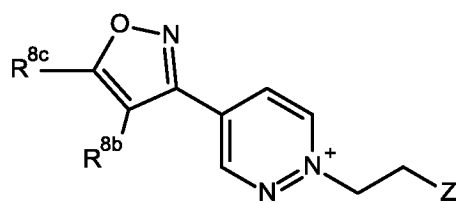
(I-b)



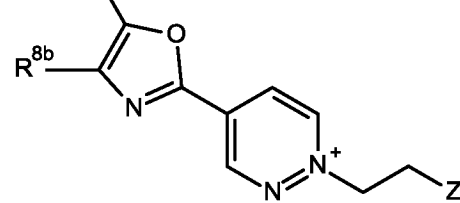
(I-c)



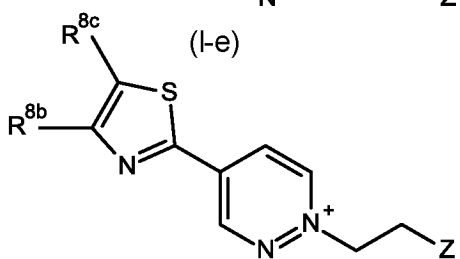
(I-d)



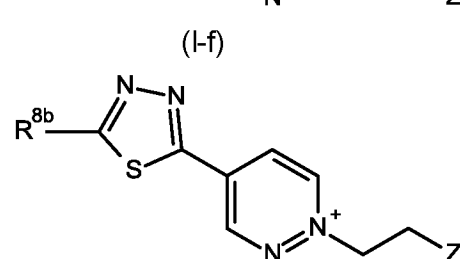
(I-e)



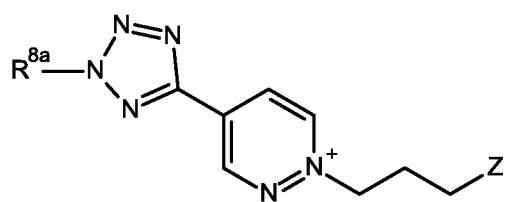
(I-f)



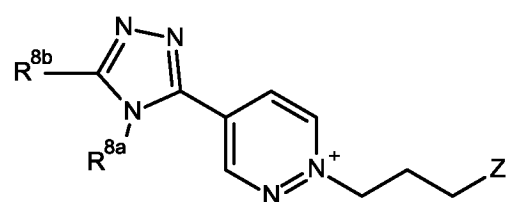
(I-g)



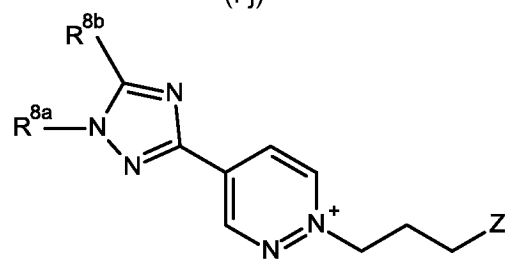
(I-h)



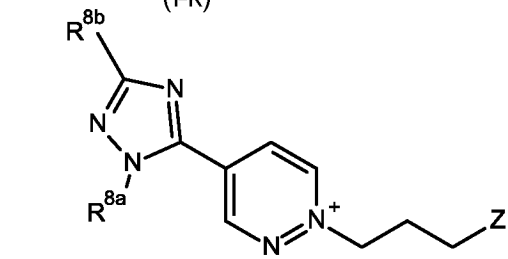
(I-j)



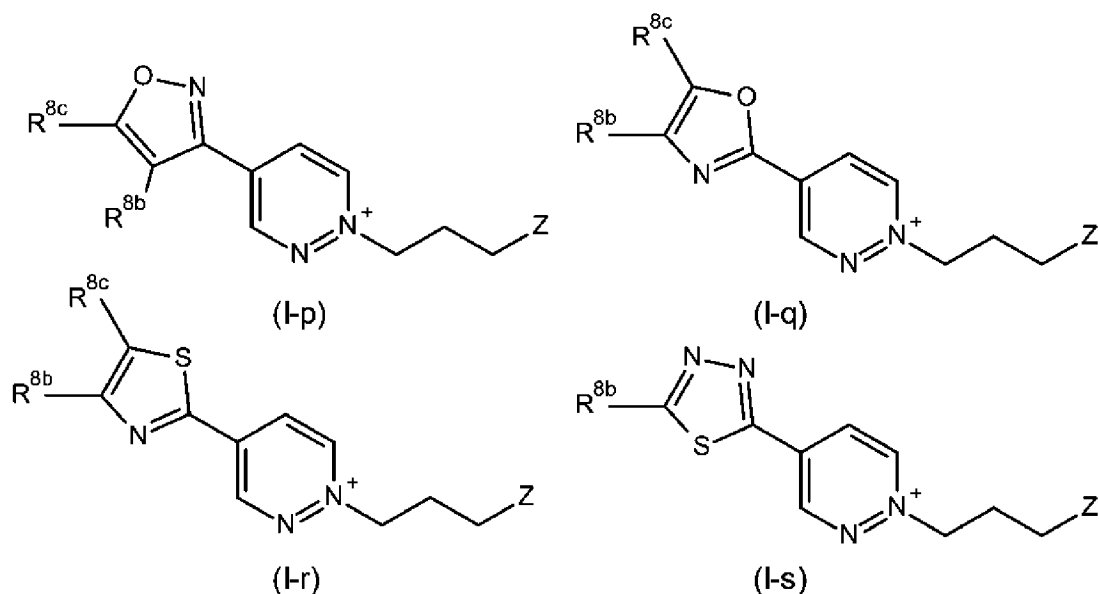
(I-k)



(I-m)



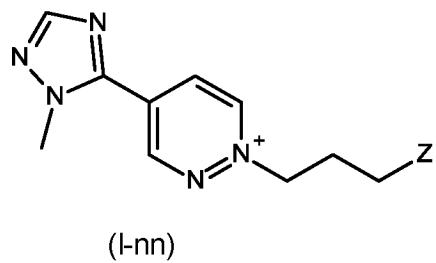
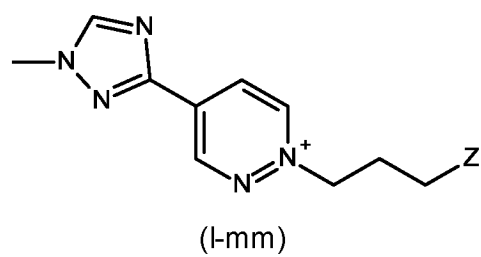
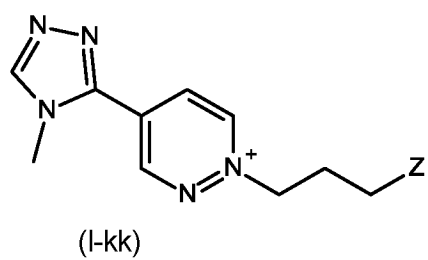
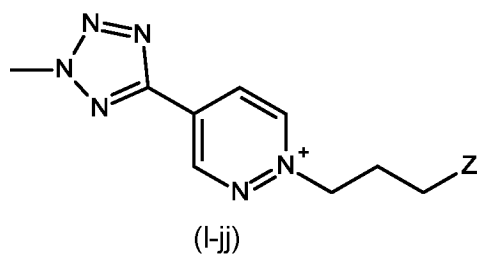
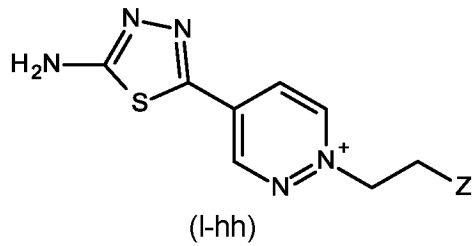
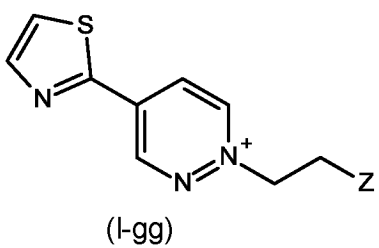
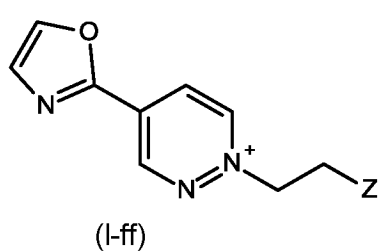
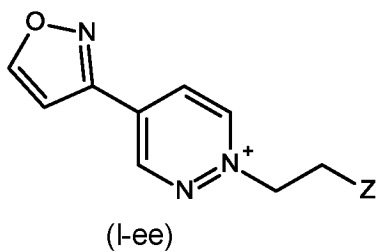
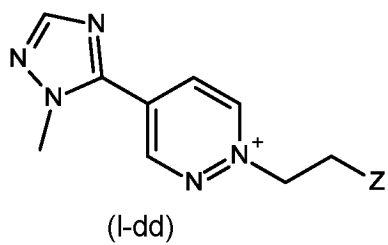
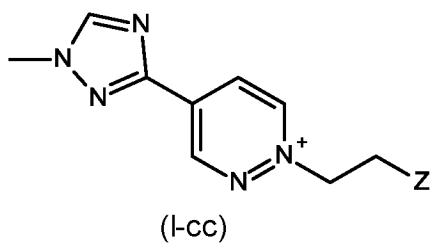
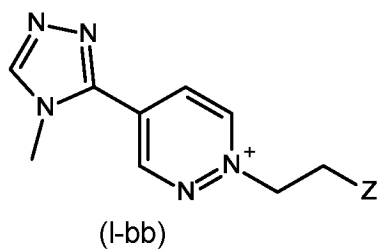
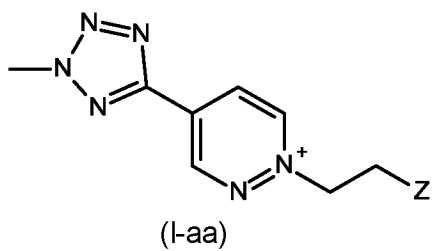
(I-n)

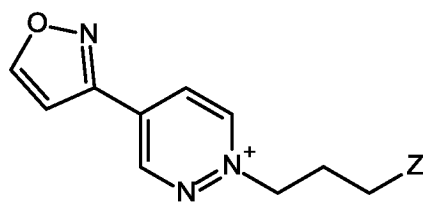


где в соединениях формул (I-a), (I-b), (I-c), (I-d), (I-e), (I-f), (I-g), (I-h), (I-j), (I-k), (I-m), (I-n), (I-p), (I-q), (I-r) или (I-s)

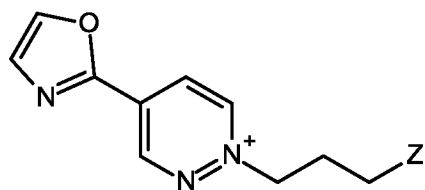
- 5 R^{8a} представляет собой водород или C_1 - C_6 алкил;
 каждый из R^{8b} , R^{8c} и R^{8d} независимо выбран из группы, состоящей из водорода, галогена, $-NH_2$, $-NHR^7$, $-N(R^7)_2$, $-OR^7$, C_1 - C_6 алкила и C_1 - C_6 галогеналкила; и
 Z представляет собой $-C(O)OH$ или $-S(O)_2OH$.

- 10 В дополнительной более предпочтительной группе вариантов осуществления соединение в соответствии с формулой (I) выбрано из группы, состоящей из соединений формул (I-aa), (I-bb), (I-cc), (I-dd), (I-ee), (I-ff), (I-gg), (I-hh), (I-jj), (I-kk), (I-mm), (I-nn), (I-pp), (I-qq), (I-rr), (I-ss), (I-tt), (I-uu), (I-vv), (I-ww), (I-xx), (I-yy), (I-zz), (I-aa'), (I-bb'), (I-cc'), (I-dd'), (I-ee'), (I-ff'), (I-gg'), (I-hh'), (I-jj'), (I-kk'), (I-mm'), (I-nn'), (I-pp'), (I-qq') и (I-rr'), указанных ниже,
- 15

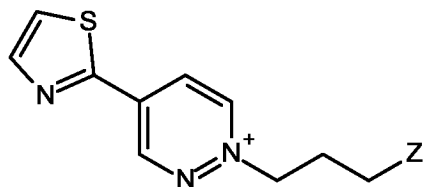




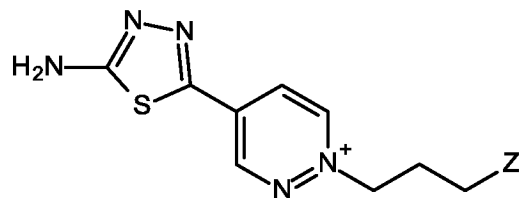
(l-pp)



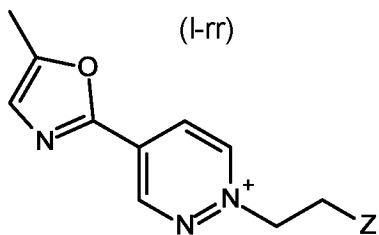
(l-qq)



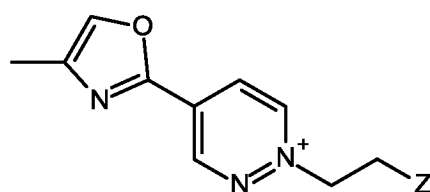
(l-rr)



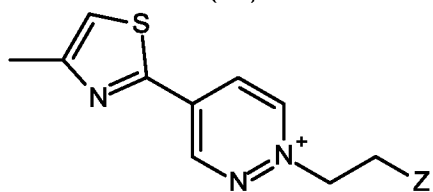
(l-ss)



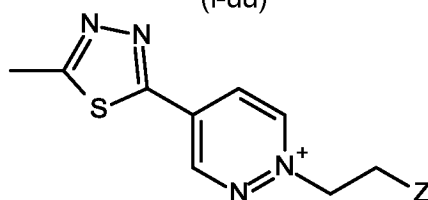
(l-tt)



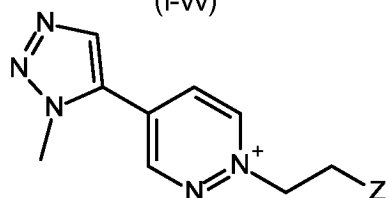
(l-uu)



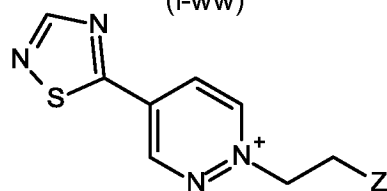
(l-vv)



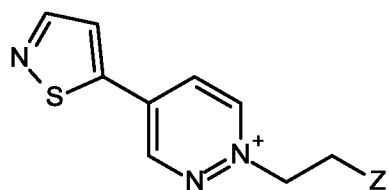
(l-ww)



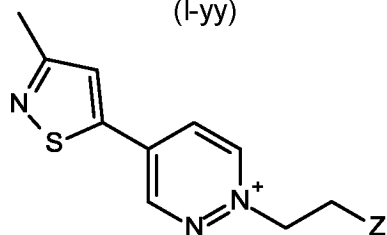
(l-xx)



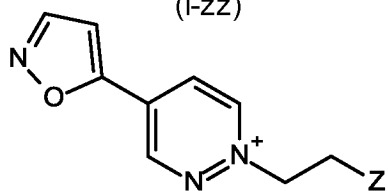
(l-yy)



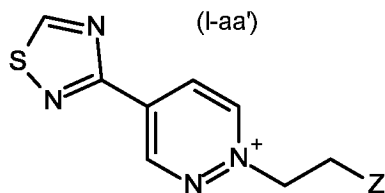
(l-zz)



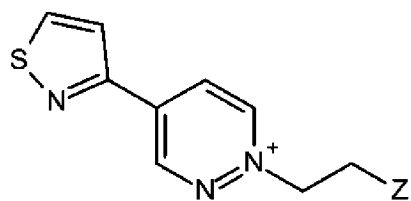
(l-aa')



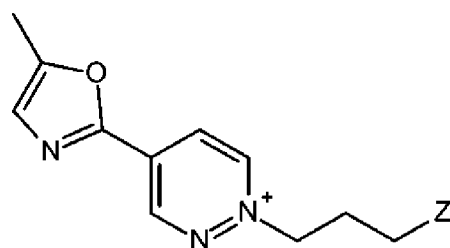
(l-bb')



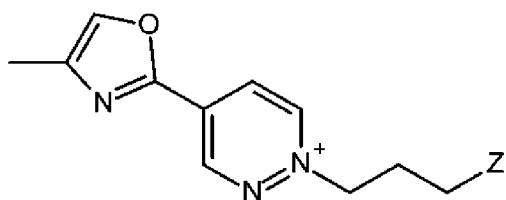
(l-cc')



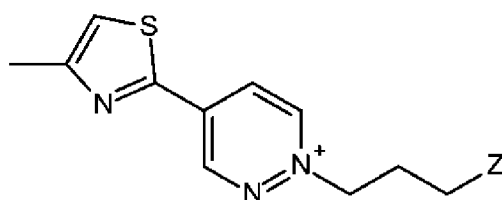
(I-dd'')



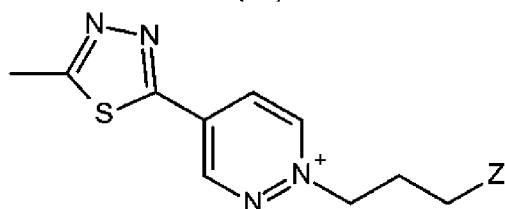
(I-ee')



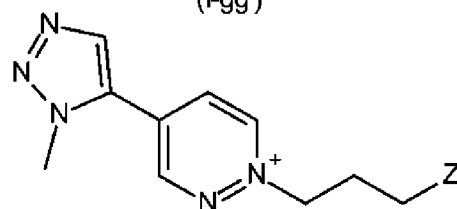
(I-ff')



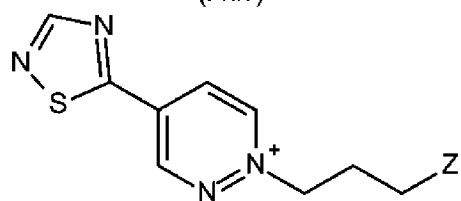
(I-gg')



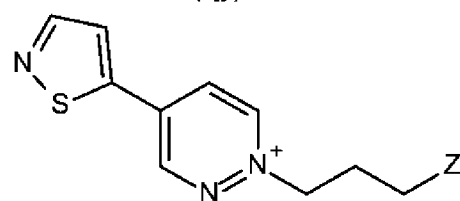
(I-hh')



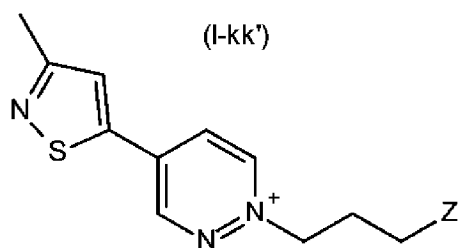
(I-ij')



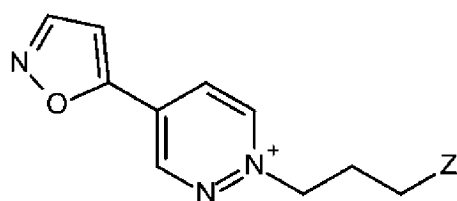
(I-kk')



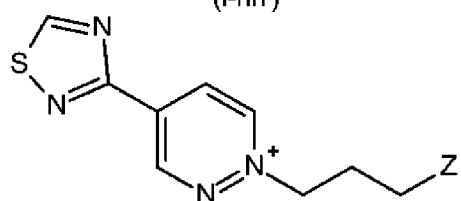
(I-mm')



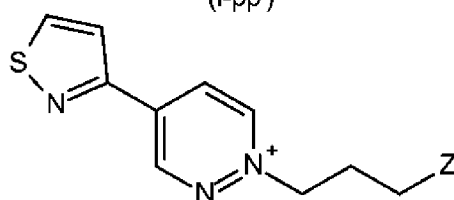
(I-nn')



(I-pp')



(I-qq')



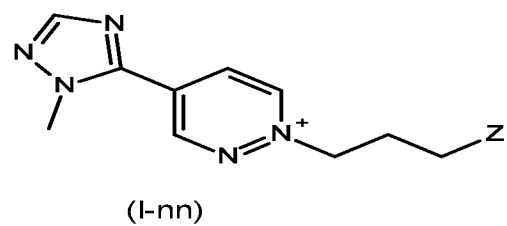
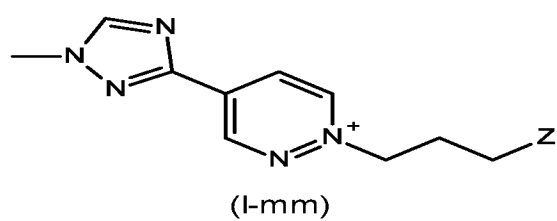
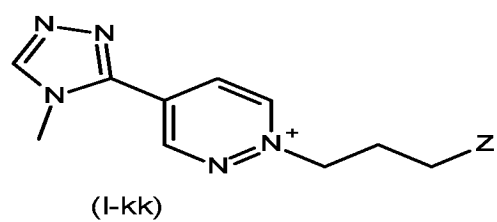
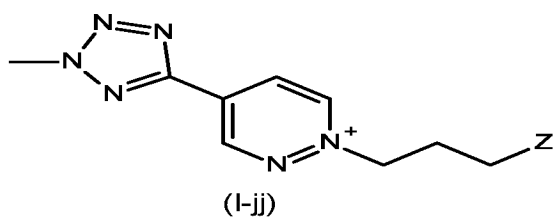
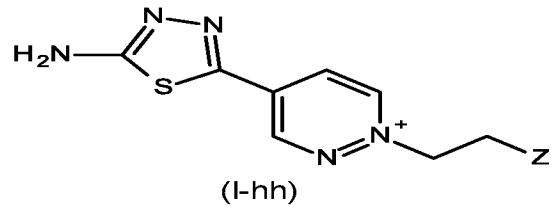
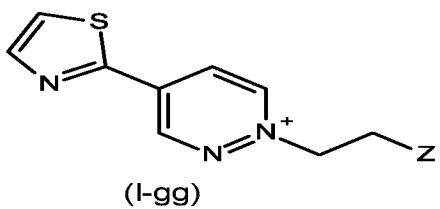
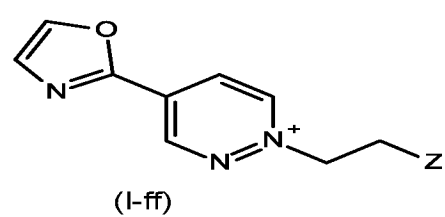
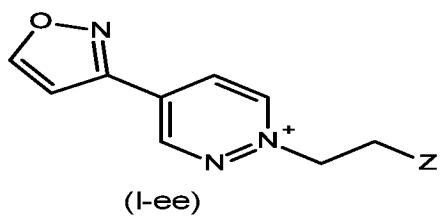
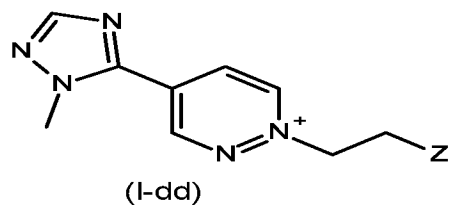
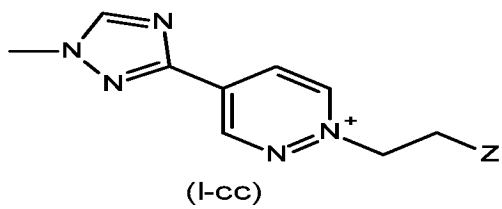
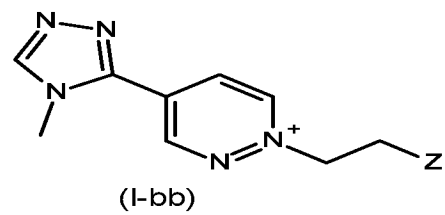
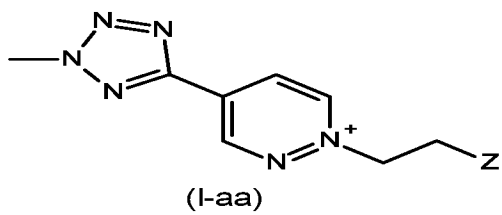
(I-rr')

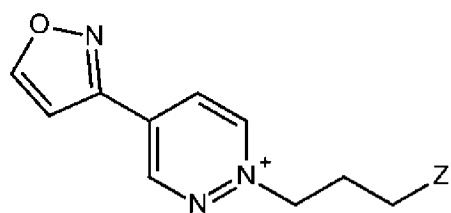
где в соединениях формулы (I-aa), (I-bb), (I-cc), (I-dd), (I-ee), (I-ff), (I-gg), (I-hh), (I-ij), (I-kk), (I-mm), (I-nn), (I-pp), (I-qq), (I-rr), (I-ss), (I-tt), (I-uu), (I-vv), (I-ww), (I-xx), (I-yy), (I-

zz), (I-aa'), (I-bb'), (I-cc'), (I-dd'), (I-ee'), (I-ff'), (I-gg'), (I-hh'), (I-jj'), (I-kk'), (I-mm'), (I-nn'), (I-pp'), (I-qq') и (I-rr')

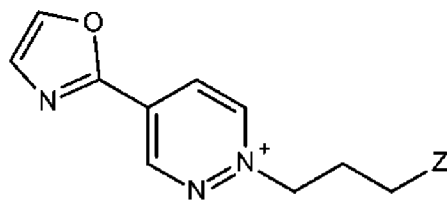
Z представляет собой $-C(O)OH$ или $-S(O)_2OH$.

- 5 В другой дополнительной более предпочтительной группе вариантов осуществления соединение в соответствии с формулой (I) выбрано из соединений формул (I-aa), (I-bb), (I-cc), (I-dd), (I-ee), (I-ff), (I-gg), (I-hh), (I-jj), (I-kk), (I-mm), (I-nn), (I-pp), (I-qq), (I-rr) или (I-ss),

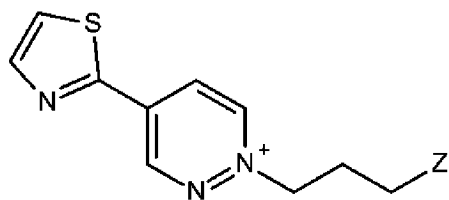




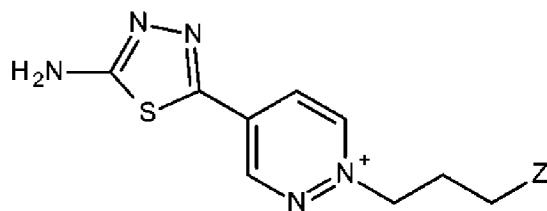
(I-pp)



(I-qq)



(I-rr)



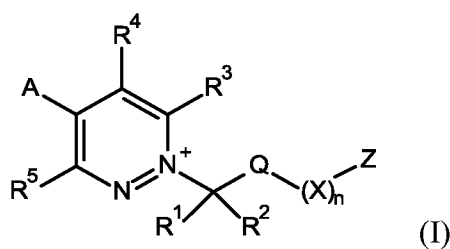
(I-ss)

где в соединении формул (I-aa), (I-bb), (I-cc), (I-dd), (I-ee), (I-ff), (I-gg), (I-hh), (I-jj), (I-kk), (I-mm), (I-nn), (I-pp), (I-qq), (I-rr) или (I-ss)

- 5 Z представляет собой $-C(O)OH$ или $-S(O)_2OH$.

В одной группе вариантов осуществления соединение в соответствии с формулой (I) выбрано из соединений A1 - A147, перечисленных в таблице A.

- 10 Также представлен способ получения соединений формулы (I):

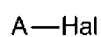


(I)

где Q, Z, X, n, R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 и A определены в данном документе;

включающий

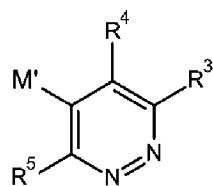
- 15 (i) либо
(а) осуществление реакции соединения формулы (H),



формула (H) ,

где

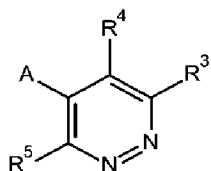
А определен в данном документе, и Hal представляет собой галоген или псевдогалоген, с соединением формулы (J),



формула (J) ,

где

- 5 R³, R⁴ и R⁵ определены в данном документе, и M' представляет собой органостаннан или органоборан (например, органобороновая кислота, сложный эфир органобороновой кислоты или органотрифторборат), в присутствии палладиевого катализатора с получением соединения формулы (X),

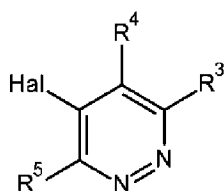


формула (X) ,

10

или

- (b) осуществление реакции соединения формулы (K),



формула (K) ,

где R³, R⁴ и R⁵ определены в данном документе, и Hal представляет собой галоген или псевдогалоген, с соединением формулы (L),

15



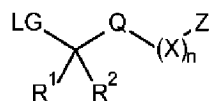
формула (L) ,

где

А определен в данном документе, и M' представляет собой органостаннан или органоборан (например, органобороновая кислота, сложный эфир

органобороновой кислоты или органотрифторборат), в присутствии палладиевого катализатора с получением соединения формулы (X),

(ii) осуществление реакции соединения формулы (X) с алкилирующим средством формулы (W),



формула (W) ,

где R^1 , R^2 , Q, X, Z и n определены в данном документе, и LG представляет собой подходящую уходящую группу (например, галогенид или псевдогалогенид, такой как трифлат, мезилат или тозилат), в инертном растворителе или смеси инертных растворителей при температуре от -78°C до 150°C с получением соединения формулы (I);

(iii) необязательно

осуществление частичного или полного гидролиза соединения формулы (I) в присутствии подходящей кислоты.

В соответствии с настоящим изобретением также представлено применение соединения формулы (J), определенного в данном документе, в способе изготовления соединения формулы (I), определенного в данном документе. Предпочтительно в соединении формулы (J) M' представляет собой трибутилстаннан.

В другом варианте осуществления настоящего изобретения также представлено применение соединения формулы (X), определенного в данном документе, в способе изготовления соединения формулы (I), определенного в данном документе.

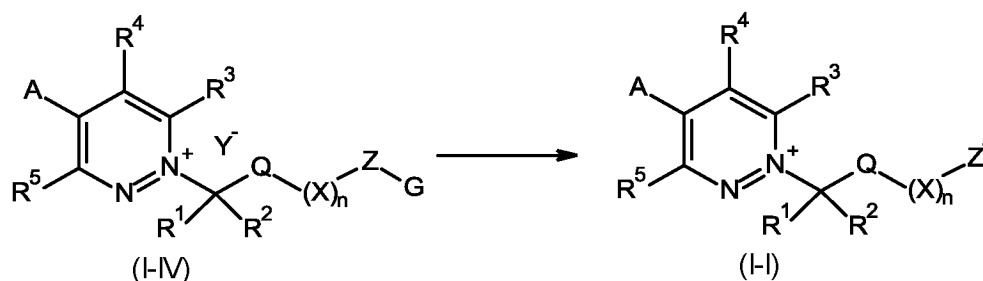
Предпочтительно соединение формулы (X) выбрано из группы, состоящей из 4-(2-метилтетразол-5-ил)пиридазина, 4-(4-метил-1,2,4-триазол-3-ил)пиридазина, 4-(1-метил-1,2,4-триазол-3-ил)пиридазина, 4-(2-метил-1,2,4-триазол-3-ил)пиридазина, 3-пиридазин-4-илизоксазола, 2-пиридазин-4-илоксазола, 5-метил-2-пиридазин-4-илоксазола, 4-метил-2-пиридазин-4-илоксазола, 2-пиридазин-4-илтиазола, 4-метил-2-пиридазин-4-илтиазола, 5-пиридазин-4-ил-1,3,4-тиадиазол-2-амин, 2-метил-5-пиридазин-4-ил-1,3,4-тиадиазола, 4-(3-метилтриазол-4-ил)пиридазина, 5-пиридазин-4-

ил-1,2,4-тиадиазола, 5-пиридазин-4-илизотиазола, 3-метил-5-пиридазин-4-илизотиазола, 5-пиридазин-4-илизоксазола, 3-пиридазин-4-ил-1,2,4-тиадиазола и 3-пиридазин-4-илизотиазола.

5 В соответствии с настоящим изобретением также представлены новые промежуточные соединения формулы (X), где соединение формулы (X) выбрано из группы, состоящей из 4-(2-метилтетразол-5-ил)пиридазина, 4-(1-метил-1,2,4-триазол-3-ил)пиридазина, 4-(2-метил-1,2,4-триазол-3-ил)пиридазина, 3-пиридазин-4-илизоксазола, 5-метил-2-пиридазин-4-илоксазола, 4-метил-2-пиридазин-4-илоксазола, 2-метил-5-пиридазин-4-ил-1,3,4-тиадиазола, 4-(3-метилтриазол-4-ил)пиридазина, 5-пиридазин-4-ил-1,2,4-тиадиазола, 5-пиридазин-4-илизотиазола, 3-метил-5-пиридазин-4-илизотиазола, 5-пиридазин-4-илизоксазола, 3-пиридазин-4-ил-1,2,4-тиадиазола и 3-пиридазин-4-илизотиазола.

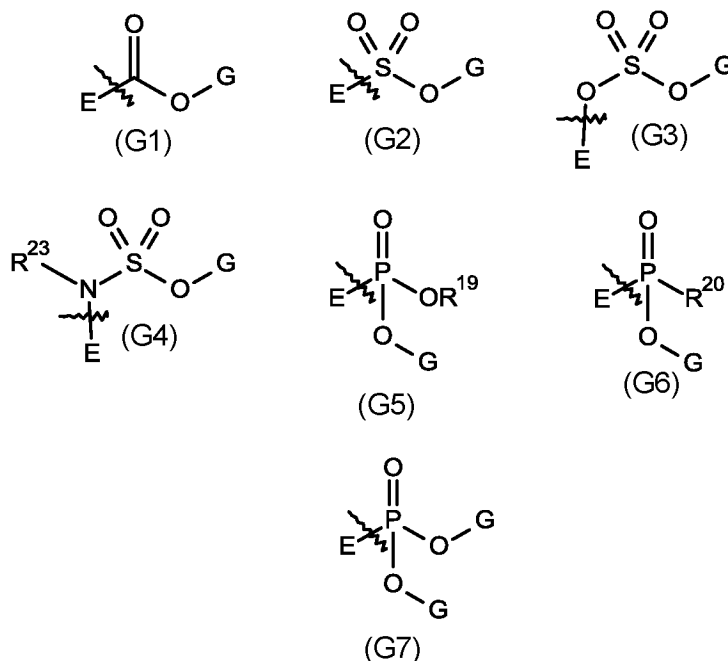
15 Следует понимать, что соединения формулы (I) могут существовать/быть изготовленными в "форме-предшественнике гербицида", в которой они *содержат группу "G"*. Такие соединения называют в данном документе соединениями формул (I-IV).

20 G представляет собой группу, которая может быть удалена в растении путем любого соответствующего механизма, в том числе без ограничения метаболизма и химического расщепления, с получением соединений формул (I-I), (I-II) или (I-III), где Z содержит кислотный протон, например, см. схему ниже.



25 Тогда как такие группы G могут рассматриваться как "предшествующие гербицидам", и, таким образом, обеспечивают получение активных гербицидных

соединений после удаления, соединения, содержащие такие группы, могут также проявлять гербицидную активность сами по себе. В таких случаях в соединении формулы (I-IV) Z-G может включать без ограничения любую из (G1) - (G7), указанных ниже, и E указывает на точку присоединения к остальной части соединения формулы (I).



В вариантах осуществления, где Z-G предусматривает (G1) - (G7), G, R¹⁹, R²⁰, R²¹, R²² и R²³ определяются следующим образом:

G представляет собой C₁-C₆алкил, C₂-C₆алкенил, C₂-C₆алкинил, -C(R²¹R²²)OC(O)R¹⁹, фенил или фенил-C₁-C₄алкил-, где указанный фенильный фрагмент необязательно замещен 1-5 заместителями, независимо выбранными из галогена, циано, нитро, C₁-C₆алкила, C₁-C₆галогеналкила или C₁-C₆алкокси.

R¹⁹ представляет собой C₁-C₆алкил или фенил,

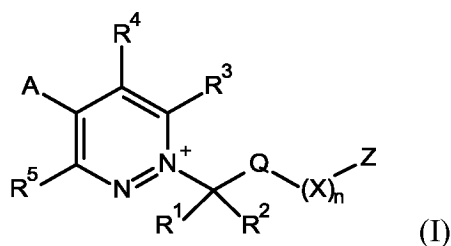
R²⁰ представляет собой гидроксильную, C₁-C₆алкил, C₁-C₆алкокси или фенил,

R²¹ представляет собой водород или метил,

R²² представляет собой водород или метил,

R²³ представляет собой водород или C₁-C₆алкил.

В одном варианте осуществления представлено соединение формулы (I) или его агрономически приемлемая соль или цвиттер-ионные формы:



где

R^1 выбран из группы, состоящей из водорода, галогена, C_1 - C_6 алкила, C_1 - C_6 фторалкила, $-OR^7$, $-NHS(O)_2R^{15}$, $-NHC(O)R^{15}$, $-NHC(O)OR^{15}$, $-NHC(O)NR^{16}R^{17}$, $-N(R^7)_2$ и $-S(O)_tR^{15}$;

R^2 выбран из группы, состоящей из водорода, галогена, C_1 - C_6 алкила и C_1 - C_6 фторалкила;

и при этом, если R^1 выбран из группы, состоящей из $-OR^7$, $-NHS(O)_2R^{15}$, $-NHC(O)R^{15}$, $-NHC(O)OR^{15}$, $-NHC(O)NR^{16}R^{17}$, $-N(R^7)_2$ и $-S(O)_tR^{15}$, R^2 выбран из группы, состоящей из водорода и C_1 - C_6 алкила; или

R^1 и R^2 вместе с атомом углерода, к которому они присоединены, образуют C_3 - C_6 циклоалкильное кольцо;

Q представляет собой $(CR^{1a}R^{2b})_m$;

m равняется 0, 1, 2 или 3;

каждые R^{1a} и R^{2b} независимо выбраны из группы, состоящей из водорода, галогена, C_1 - C_6 алкила, C_1 - C_6 фторалкила, $-OH$, $-OR^7$, $-NH_2$, $-NHR^7$, $-N(R^7)_2$ и $-S(O)_tR^{15}$; или

каждые R^{1a} и R^{2b} вместе с атомом углерода, к которому они присоединены, образуют C_3 - C_6 циклоалкильное кольцо;

R^3 , R^4 и R^5 независимо выбраны из группы, состоящей из водорода, галогена, циано, нитро, $-S(O)_tR^{15}$, C_1 - C_6 алкила, C_1 - C_6 фторалкила, C_1 - C_6 фторалкокси, C_1 - C_6 алкокси, C_3 - C_6 циклоалкила и $-N(R^6)_2$;

каждый R^6 независимо выбран из водорода и C_1 - C_6 алкила;

каждый R^7 независимо выбран из группы, состоящей из C_1 - C_6 алкила, $-S(O)_2R^{15}$, $-C(O)R^{15}$, $-C(O)OR^{15}$ и $-C(O)NR^{16}R^{17}$;

5

A представляет собой 5-членный гетероарил, присоединенный к остальной части молекулы посредством атома углерода в кольце, который содержит 1, 2, 3 или 4 гетероатома, независимо выбранные из группы, состоящей из N, O и S, и при этом гетероарил, если это возможно, может быть необязательно замещен 1, 2 или 3

- 10 заместителями R^8 , которые могут быть одинаковыми или различными, и при этом, если A замещен по одному или нескольким атомам углерода в кольце, каждый R^8 независимо выбран из группы, состоящей из галогена, нитро, циано, $-NH_2$, $-NHR^7$, $-N(R^7)_2$, $-OH$, $-OR^7$, $-S(O)_tR^{15}$, $-NR^6S(O)_2R^{15}$, $-C(O)OR^{10}$, $-C(O)R^{15}$, $-C(O)NR^{16}R^{17}$, $-S(O)_2NR^{16}R^{17}$, C_1 - C_6 алкила, C_1 - C_6 галогеналкила, C_3 - C_6 циклоалкила, C_3 - C_6 галогенциклоалкила, C_3 - C_6 циклоалкокси, C_2 - C_6 алкенила, C_2 - C_6 галогеналкенила, C_2 - C_6 алкинила, C_1 - C_3 алкокси C_1 - C_3 алкил-, гидроксид C_1 - C_6 алкил-, C_1 - C_3 алкокси C_1 - C_3 алкокси-, C_1 - C_6 галогеналкокси, C_1 - C_3 галогеналкокси C_1 - C_3 алкил-, C_3 - C_6 алкенилокси, C_3 - C_6 алкинилокси, $-C(R^6)=NOR^6$, фенила и 5- или 6-членного гетероарила, который содержит 1, 2, 3 или 4 гетероатома, независимо выбранные из N, O и S, и при этом
- 20 указанные фенил или гетероарил необязательно замещены 1, 2 или 3 заместителями R^9 , которые могут быть одинаковыми или различными;

и/или

- 25 если A замещен по атому азота в кольце, R^8 выбран из группы, состоящей из $-OR^7$, C_1 - C_6 алкила, C_1 - C_6 галогеналкила, C_3 - C_6 циклоалкила, C_3 - C_6 галогенциклоалкила, C_3 - C_6 циклоалкокси, C_2 - C_6 алкенила, C_2 - C_6 галогеналкенила, C_2 - C_6 алкинила, C_1 - C_3 алкокси C_1 - C_3 алкил-, гидроксид C_1 - C_6 алкил-, C_1 - C_3 алкокси C_1 - C_3 алкокси-, C_1 - C_6 галогеналкокси, C_1 - C_3 галогеналкокси C_1 - C_3 алкил-, C_3 - C_6 алкенилокси и C_3 - C_6 алкинилокси; и
- 30

каждый R^9 независимо выбран из группы, состоящей из галогена, циано, $-N(R^6)_2$, C_1 - C_4 алкила, C_1 - C_4 алкокси, C_1 - C_4 галогеналкила и C_1 - C_4 галогеналкокси;

X независимо выбран из группы, состоящей из C₃-C₆циклоалкила, фенила, 5- или 6-членного гетероарила, который содержит 1, 2, 3 или 4 гетероатома, независимо выбранные из N, O и S, и 4-6-членного гетероциклила, который содержит 1, 2 или 3 гетероатома, независимо выбранные из N, O и S, и при этом указанные циклоалкильные, фенильные, гетероарильные или гетероциклильные фрагменты
 5 обязательно замещены 1 или 2 заместителями, которые могут быть одинаковыми или различными, выбранными из R⁹, и при этом вышеуказанные фрагменты CR¹R² и Z или Q и Z могут быть присоединены в любом положении указанных циклоалкильных, фенильных, гетероарильных или гетероциклильных фрагментов;

10

n равняется 0 или 1;

15

Z выбран из группы, состоящей из -C(O)OR¹⁰, -CH₂OH, -CHO, -C(O)NHOR¹¹, -C(O)NHCN, -OC(O)NHOR¹¹, -OC(O)NHCN, -NR⁶C(O)NHOR¹¹, -NR⁶C(O)NHCN, -C(O)NHS(O)₂R¹², -OC(O)NHS(O)₂R¹², -NR⁶C(O)NHS(O)₂R¹², -S(O)₂OR¹⁰, -OS(O)₂OR¹⁰, -NR⁶S(O)₂OR¹⁰, -NR⁶S(O)OR¹⁰, -NHS(O)₂R¹⁴, -S(O)OR¹⁰, -OS(O)OR¹⁰, -S(O)₂NHCN, -S(O)₂NHC(O)R¹⁸, -S(O)₂NHS(O)₂R¹², -OS(O)₂NHCN, -OS(O)₂NHS(O)₂R¹², -OS(O)₂NHC(O)R¹⁸, -NR⁶S(O)₂NHCN, -NR⁶S(O)₂NHC(O)R¹⁸, -N(OH)C(O)R¹⁵, -ONHC(O)R¹⁵, -NR⁶S(O)₂NHS(O)₂R¹², -P(O)(R¹³)(OR¹⁰), -P(O)H(OR¹⁰), -OP(O)(R¹³)(OR¹⁰),
 20 -NR⁶P(O)(R¹³)(OR¹⁰) и тетразола;

25

R¹⁰ выбран из группы, состоящей из водорода, C₁-C₆алкила, фенила и бензила, и где указанные фенил или бензил обязательно замещены 1, 2 или 3 заместителями R⁹, которые могут быть одинаковыми или различными;

30

R¹¹ выбран из группы, состоящей из водорода, C₁-C₆алкила и фенила, и где указанный фенил обязательно замещен 1, 2 или 3 заместителями R⁹, которые могут быть одинаковыми или различными;

R¹² выбран из группы, состоящей из C₁-C₆алкила, C₁-C₆галогеналкила, C₁-C₆алкокси, -ОН, -N(R⁶)₂ и фенила, и где указанный фенил обязательно замещен 1, 2 или 3 заместителями R⁹, которые могут быть одинаковыми или различными;

R¹³ выбран из группы, состоящей из -ОН, C₁-C₆алкила, C₁-C₆алкокси и фенила;

R^{14} представляет собой C_1 - C_6 галогеналкил;

R^{15} выбран из группы, состоящей из C_1 - C_6 алкила и фенила, и где указанный фенил
5 необязательно замещен 1, 2 или 3 заместителями R^9 , которые могут быть одинаковыми или различными;

R^{16} и R^{17} независимо выбраны из группы, состоящей из водорода и C_1 - C_6 алкила; или
10 R^{16} и R^{17} вместе с атомом азота, к которому они присоединены, образуют 4-6-членное гетероциклическое кольцо, которое необязательно содержит один дополнительный гетероатом, независимо выбранный из N, O и S;

R^{18} выбран из группы, состоящей из водорода, C_1 - C_6 алкила, C_1 - C_6 галогеналкила, C_1 -
15 C_6 алкокси, $-N(R^6)_2$ и фенила, и где указанный фенил необязательно замещен 1, 2 или 3 заместителями R^9 , которые могут быть одинаковыми или различными;

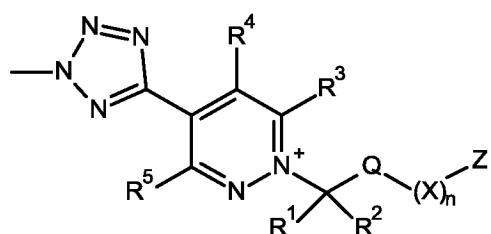
и

г равняется 0, 1 или 2.

20 Соединения в таблицах 1-57 ниже иллюстрируют соединения по настоящему изобретению. Специалисту в данной области техники будет понятно, что соединения формулы (I) могут существовать в виде агрономически приемлемой соли, цвиттер-иона или агрономически приемлемой соли цвиттер-иона, как описано в данном документе
25 ранее.

Таблица 1

В данной таблице раскрыты 53 конкретные соединения формулы (T-1),



(T-1),

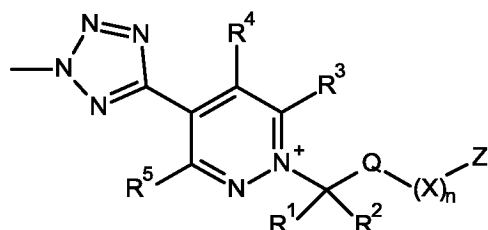
где m , Q , R^3 , R^4 , R^5 и Z определены в таблице 1, R^1 и R^2 представляют собой водород, и n равняется 0.

Номер соединения	R^3	R^4	R^5	Z	m	Q
1.001	H	H	H	-C(O)OH	0	-
1.002	H	H	H	-C(O)OMe	0	-
1.003	H	H	H	-C(O)NHOMe	0	-
1.004	H	H	H	-OC(O)NHOMe	0	-
1.005	H	H	H	-NHC(O)NHOMe	0	-
1.006	H	H	H	-NMeC(O)NHOMe	0	-
1.007	H	H	H	-C(O)NHS(O) ₂ Me	0	-
1.008	H	H	H	-OC(O)NHS(O) ₂ Me	0	-
1.009	H	H	H	-NHC(O)NHS(O) ₂ Me	0	-
1.010	H	H	H	-NMeC(O)NHS(O) ₂ Me	0	-
1.011	H	H	H	-S(O) ₂ OH	0	-
1.012	H	H	H	-OS(O) ₂ OH	0	-
1.013	H	H	H	-NHS(O) ₂ OH	0	-
1.014	H	H	H	-NMeS(O) ₂ OH	0	-
1.015	H	H	H	-S(O)OH	0	-
1.016	H	H	H	-OS(O)OH	0	-
1.017	H	H	H	-NHS(O)OH	0	-
1.018	H	H	H	-NMeS(O)OH	0	-
1.019	H	H	H	-NHS(O) ₂ CF ₃	0	-
1.020	H	H	H	-S(O) ₂ NHC(O)Me	0	-
1.021	H	H	H	-OS(O) ₂ NHC(O)Me	0	-
1.022	H	H	H	-NHS(O) ₂ NHC(O)Me	0	-
1.023	H	H	H	-NMeS(O) ₂ NHC(O)Me	0	-
1.024	H	H	H	-P(O)(OH)(OMe)	0	-
1.025	H	H	H	-P(O)(OH)(OH)	0	-
1.026	H	H	H	-OP(O)(OH)(OMe)	0	-
1.027	H	H	H	-OP(O)(OH)(OH)	0	-
1.028	H	H	H	-NHP(O)(OH)(OMe)	0	-
1.029	H	H	H	-NHP(O)(OH)(OH)	0	-
1.030	H	H	H	-NMeP(O)(OH)(OMe)	0	-
1.031	H	H	H	-NMeP(O)(OH)(OH)	0	-
1.032	H	H	H	-тетразол	0	-
1.033	H	H	H	-S(O) ₂ OH	1	CH(NH ₂)
1.034	H	H	H	-C(O)OH	1	CH(NH ₂)
1.035	H	H	H	-S(O) ₂ OH	2	CH(OH)CH ₂
1.036	H	H	H	-C(O)OH	2	CH(OH)CH ₂
1.037	H	H	H	-S(O) ₂ OH	1	CH(OH)
1.038	H	H	H	-C(O)OH	1	CH(OH)
1.039	H	H	H	-C(O)NHCN	0	-
1.040	H	H	H	-OC(O)NHCN	0	-
1.041	H	H	H	-NHC(O)NHCN	0	-
1.042	H	H	H	-NMeC(O)NHCN	0	-

Номер соединения	R ³	R ⁴	R ⁵	Z	m	Q
1.043	H	H	H	-S(O) ₂ NHCN	0	-
1.044	H	H	H	-OS(O) ₂ NHCN	0	-
1.045	H	H	H	-NHS(O) ₂ NHCN	0	-
1.046	H	H	H	-NMeS(O) ₂ NHCN	0	-
1.047	H	H	H	-S(O) ₂ NHS(O) ₂ Me	0	-
1.048	H	H	H	-OS(O) ₂ NHS(O) ₂ Me	0	-
1.049	H	H	H	-NHS(O) ₂ NHS(O) ₂ Me	0	-
1.050	H	H	H	-NMeS(O) ₂ NHS(O) ₂ Me	0	-
1.051	H	H	H	-P(O)H(OH)	0	-
1.052	H	H	H	-N(OH)C(O)Me	0	-
1.053	H	H	H	-ONHC(O)Me	0	-

Таблица 2

В данной таблице раскрыты 49 конкретных соединений формулы (Т-2),



5 (Т-2),

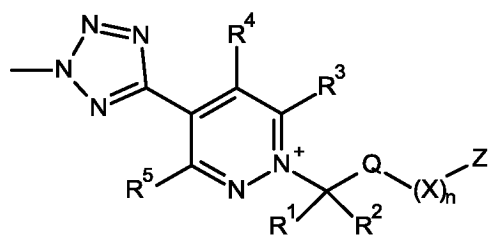
где m, Q, R³, R⁴, R⁵ и Z определены в таблице 2, R¹ и R² представляют собой водород, и n равняется 0.

Номер соединения	R ³	R ⁴	R ⁵	Z	m	Q
2.001	H	H	H	-C(O)OH	1	CH ₂
2.002	H	H	H	-C(O)OMe	1	CH ₂
2.003	H	H	H	-C(O)NHOMe	1	CH ₂
2.004	H	H	H	-OC(O)NHOMe	1	CH ₂
2.005	H	H	H	-NHC(O)NHOMe	1	CH ₂
2.006	H	H	H	-NMeC(O)NHOMe	1	CH ₂
2.007	H	H	H	-C(O)NHS(O) ₂ Me	1	CH ₂
2.008	H	H	H	-OC(O)NHS(O) ₂ Me	1	CH ₂
2.009	H	H	H	-NHC(O)NHS(O) ₂ Me	1	CH ₂
2.010	H	H	H	-NMeC(O)NHS(O) ₂ Me	1	CH ₂
2.011	H	H	H	-S(O) ₂ OH	1	CH ₂
2.012	H	H	H	-OS(O) ₂ OH	1	CH ₂
2.013	H	H	H	-NHS(O) ₂ OH	1	CH ₂
2.014	H	H	H	-NMeS(O) ₂ OH	1	CH ₂
2.015	H	H	H	-S(O)OH	1	CH ₂
2.016	H	H	H	-OS(O)OH	1	CH ₂

Номер соединения	R ³	R ⁴	R ⁵	Z	m	Q
2.017	H	H	H	-NHS(O)OH	1	CH ₂
2.018	H	H	H	-NMeS(O)OH	1	CH ₂
2.019	H	H	H	-NHS(O) ₂ CF ₃	1	CH ₂
2.020	H	H	H	-S(O) ₂ NHC(O)Me	1	CH ₂
2.021	H	H	H	-OS(O) ₂ NHC(O)Me	1	CH ₂
2.022	H	H	H	-NHS(O) ₂ NHC(O)Me	1	CH ₂
2.023	H	H	H	-NMeS(O) ₂ NHC(O)Me	1	CH ₂
2.024	H	H	H	-P(O)(OH)(OMe)	1	CH ₂
2.025	H	H	H	-P(O)(OH)(OH)	1	CH ₂
2.026	H	H	H	-OP(O)(OH)(OMe)	1	CH ₂
2.027	H	H	H	-OP(O)(OH)(OH)	1	CH ₂
2.028	H	H	H	-NHP(O)(OH)(OMe)	1	CH ₂
2.029	H	H	H	-NHP(O)(OH)(OH)	1	CH ₂
2.030	H	H	H	-NMeP(O)(OH)(OMe)	1	CH ₂
2.031	H	H	H	-NMeP(O)(OH)(OH)	1	CH ₂
2.032	H	H	H	-тетразол	1	CH ₂
2.033	H	H	H	-S(O) ₂ OH	2	CH ₂ CH(NH ₂)
2.034	H	H	H	-C(O)OH	2	CH ₂ CH(NH ₂)
2.035	H	H	H	-C(O)NHCN	1	CH ₂
2.036	H	H	H	-OC(O)NHCN	1	CH ₂
2.037	H	H	H	-NHC(O)NHCN	1	CH ₂
2.038	H	H	H	-NMeC(O)NHCN	1	CH ₂
2.039	H	H	H	-S(O) ₂ NHCN	1	CH ₂
2.040	H	H	H	-OS(O) ₂ NHCN	1	CH ₂
2.041	H	H	H	-NHS(O) ₂ NHCN	1	CH ₂
2.042	H	H	H	-NMeS(O) ₂ NHCN	1	CH ₂
2.043	H	H	H	-S(O) ₂ NHS(O) ₂ Me	1	CH ₂
2.044	H	H	H	-OS(O) ₂ NHS(O) ₂ Me	1	CH ₂
2.045	H	H	H	-NHS(O) ₂ NHS(O) ₂ Me	1	CH ₂
2.046	H	H	H	- NMeS(O) ₂ NHS(O) ₂ Me	1	CH ₂
2.047	H	H	H	-P(O)H(OH)	1	CH ₂
2.048	H	H	H	-N(OH)C(O)Me	1	CH ₂
2.049	H	H	H	-ONHC(O)Me	1	CH ₂

Таблица 3

В данной таблице раскрыты 49 конкретных соединений формулы (Т-3),



(Т-3),

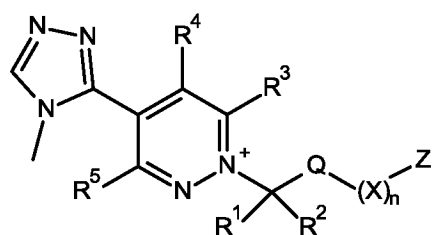
где m , Q , R^3 , R^4 , R^5 и Z определены в таблице 3, R^1 и R^2 представляют собой водород, и n равняется 0.

Номер соединения	R^3	R^4	R^5	Z	m	Q
3.001	H	H	H	-C(O)OH	2	CH ₂ CH ₂
3.002	H	H	H	-C(O)OMe	2	CH ₂ CH ₂
3.003	H	H	H	-C(O)NHOMe	2	CH ₂ CH ₂
3.004	H	H	H	-OC(O)NHOMe	2	CH ₂ CH ₂
3.005	H	H	H	-NHC(O)NHOMe	2	CH ₂ CH ₂
3.006	H	H	H	-NMeC(O)NHOMe	2	CH ₂ CH ₂
3.007	H	H	H	-C(O)NHS(O) ₂ Me	2	CH ₂ CH ₂
3.008	H	H	H	-OC(O)NHS(O) ₂ Me	2	CH ₂ CH ₂
3.009	H	H	H	-NHC(O)NHS(O) ₂ Me	2	CH ₂ CH ₂
3.010	H	H	H	-NMeC(O)NHS(O) ₂ Me	2	CH ₂ CH ₂
3.011	H	H	H	-S(O) ₂ OH	2	CH ₂ CH ₂
3.012	H	H	H	-OS(O) ₂ OH	2	CH ₂ CH ₂
3.013	H	H	H	-NHS(O) ₂ OH	2	CH ₂ CH ₂
3.014	H	H	H	-NMeS(O) ₂ OH	2	CH ₂ CH ₂
3.015	H	H	H	-S(O)OH	2	CH ₂ CH ₂
3.016	H	H	H	-OS(O)OH	2	CH ₂ CH ₂
3.017	H	H	H	-NHS(O)OH	2	CH ₂ CH ₂
3.018	H	H	H	-NMeS(O)OH	2	CH ₂ CH ₂
3.019	H	H	H	-NHS(O) ₂ CF ₃	2	CH ₂ CH ₂
3.020	H	H	H	-S(O) ₂ NHC(O)Me	2	CH ₂ CH ₂
3.021	H	H	H	-OS(O) ₂ NHC(O)Me	2	CH ₂ CH ₂
3.022	H	H	H	-NHS(O) ₂ NHC(O)Me	2	CH ₂ CH ₂
3.023	H	H	H	-NMeS(O) ₂ NHC(O)Me	2	CH ₂ CH ₂
3.024	H	H	H	-P(O)(OH)(OMe)	2	CH ₂ CH ₂
3.025	H	H	H	-P(O)(OH)(OH)	2	CH ₂ CH ₂
3.026	H	H	H	-OP(O)(OH)(OMe)	2	CH ₂ CH ₂
3.027	H	H	H	-OP(O)(OH)(OH)	2	CH ₂ CH ₂
3.028	H	H	H	-NHP(O)(OH)(OMe)	2	CH ₂ CH ₂
3.029	H	H	H	-NHP(O)(OH)(OH)	2	CH ₂ CH ₂
3.030	H	H	H	-NMeP(O)(OH)(OMe)	2	CH ₂ CH ₂
3.031	H	H	H	-NMeP(O)(OH)(OH)	2	CH ₂ CH ₂
3.032	H	H	H	-тетразол	2	CH ₂ CH ₂
3.033	H	H	H	-S(O) ₂ OH	3	CH ₂ CH ₂ CH(NH ₂)
3.034	H	H	H	-C(O)OH	3	CH ₂ CH ₂ CH(NH ₂)
3.035	H	H	H	-C(O)NHCN	2	CH ₂ CH ₂
3.036	H	H	H	-OC(O)NHCN	2	CH ₂ CH ₂
3.037	H	H	H	-NHC(O)NHCN	2	CH ₂ CH ₂
3.038	H	H	H	-NMeC(O)NHCN	2	CH ₂ CH ₂
3.039	H	H	H	-S(O) ₂ NHCN	2	CH ₂ CH ₂
3.040	H	H	H	-OS(O) ₂ NHCN	2	CH ₂ CH ₂
3.041	H	H	H	-NHS(O) ₂ NHCN	2	CH ₂ CH ₂
3.042	H	H	H	-NMeS(O) ₂ NHCN	2	CH ₂ CH ₂
3.043	H	H	H	-S(O) ₂ NHS(O) ₂ Me	2	CH ₂ CH ₂
3.044	H	H	H	-OS(O) ₂ NHS(O) ₂ Me	2	CH ₂ CH ₂

Номер соединения	R ³	R ⁴	R ⁵	Z	m	Q
3.045	H	H	H	-NHS(O) ₂ NHS(O) ₂ Me	2	CH ₂ CH ₂
3.046	H	H	H	- NMeS(O) ₂ NHS(O) ₂ Me	2	CH ₂ CH ₂
3.047	H	H	H	-P(O)H(OH)	2	CH ₂ CH ₂
3.048	H	H	H	-N(OH)C(O)Me	2	CH ₂ CH ₂
3.049	H	H	H	-ONHC(O)Me	2	CH ₂ CH ₂

Таблица 4

В данной таблице раскрыты 53 конкретные соединения формулы (Т-4),

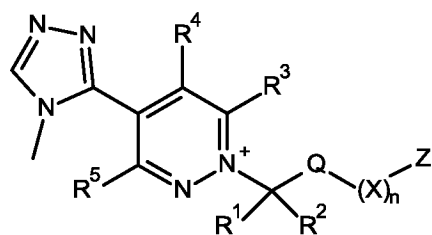


(Т-4),

где m, Q, R³, R⁴, R⁵ и Z определены выше в таблице 1, R¹ и R² представляют собой водород, и n равняется 0.

Таблица 5

В данной таблице раскрыты 49 конкретных соединений формулы (Т-5),

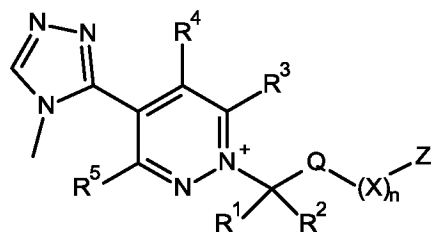


(Т-5),

где m, Q, R³, R⁴, R⁵ и Z определены выше в таблице 2, R¹ и R² представляют собой водород, и n равняется 0.

Таблица 6

В данной таблице раскрыты 49 конкретных соединений формулы (Т-6),

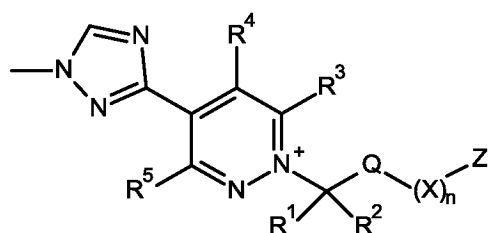


(Т-6),

- 5 где m, Q, R³, R⁴, R⁵ и Z определены выше в таблице 3, R¹ и R² представляют собой водород, и n равняется 0.

Таблица 7

- 10 В данной таблице раскрыты 53 конкретные соединения формулы (Т-7),

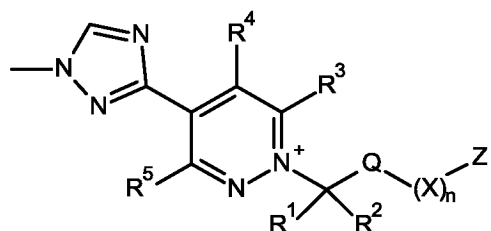


(Т-7),

- 15 где m, Q, R³, R⁴, R⁵ и Z определены выше в таблице 1, R¹ и R² представляют собой водород, и n равняется 0.

Таблица 8

В данной таблице раскрыты 49 конкретных соединений формулы (Т-8),

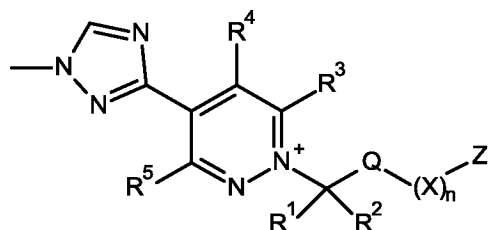


- 20 (Т-8),

где m , Q , R^3 , R^4 , R^5 и Z определены выше в таблице 2, R^1 и R^2 представляют собой водород, и n равняется 0.

Таблица 9

5 В данной таблице раскрыты 49 конкретных соединений формулы (Т-9),



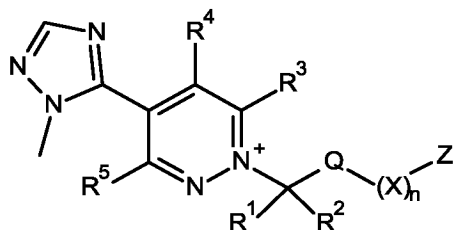
(Т-9),

где m , Q , R^3 , R^4 , R^5 и Z определены выше в таблице 3, R^1 и R^2 представляют собой водород, и n равняется 0.

10

Таблица 10

В данной таблице раскрыты 53 конкретные соединения формулы (Т-10),

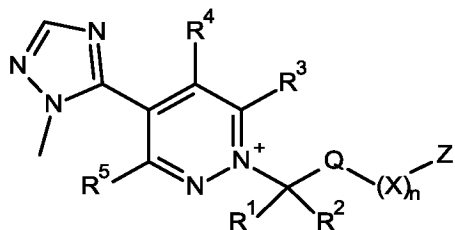


15 (Т-10),

где m , Q , R^3 , R^4 , R^5 и Z определены выше в таблице 1, R^1 и R^2 представляют собой водород, и n равняется 0.

20 Таблица 11

В данной таблице раскрыты 49 конкретных соединений формулы (Т-11),

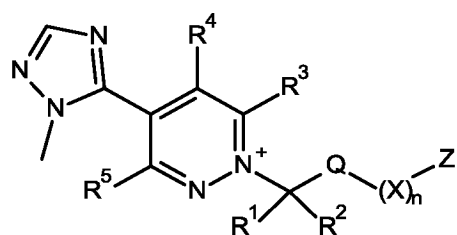


(Т-11),

где m , Q , R^3 , R^4 , R^5 и Z определены выше в таблице 2, R^1 и R^2 представляют собой водород, и n равняется 0.

5 Таблица 12

В данной таблице раскрыты 49 конкретных соединений формулы (Т-12),



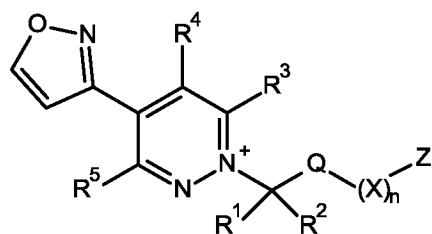
(Т-12),

10 где m , Q , R^3 , R^4 , R^5 и Z определены выше в таблице 3, R^1 и R^2 представляют собой водород, и n равняется 0.

Таблица 13

В данной таблице раскрыты 53 конкретные соединения формулы (Т-13),

15



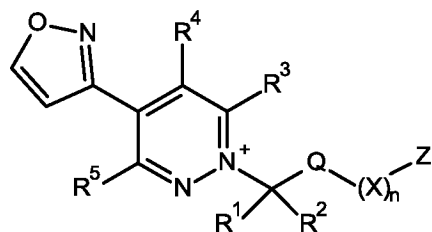
(Т-13),

где m , Q , R^3 , R^4 , R^5 и Z определены выше в таблице 1, R^1 и R^2 представляют собой водород, и n равняется 0.

20

Таблица 14

В данной таблице раскрыты 49 конкретных соединений формулы (Т-14),

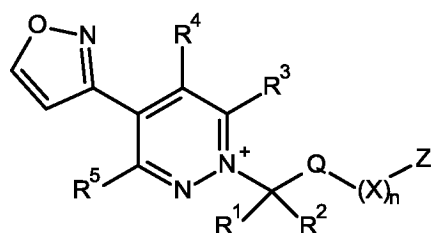


(Т-14),

- 5 где m , Q , R^3 , R^4 , R^5 и Z определены выше в таблице 2, R^1 и R^2 представляют собой водород, и n равняется 0.

Таблица 15

- 10 В данной таблице раскрыты 49 конкретных соединений формулы (Т-15),

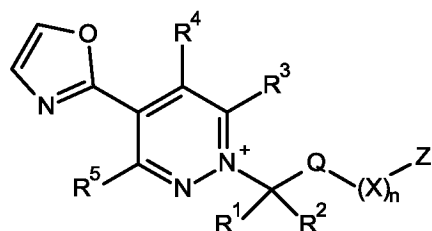


(Т-15),

- 15 где m , Q , R^3 , R^4 , R^5 и Z определены выше в таблице 3, R^1 и R^2 представляют собой водород, и n равняется 0.

Таблица 16

В данной таблице раскрыты 53 конкретные соединения формулы (Т-16),

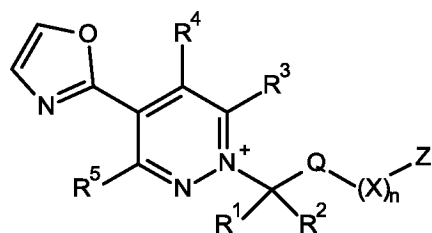


- 20 (Т-16),

где m , Q , R^3 , R^4 , R^5 и Z определены выше в таблице 1, R^1 и R^2 представляют собой водород, и n равняется 0.

Таблица 17

- 5 В данной таблице раскрыты 49 конкретных соединений формулы (T-17),

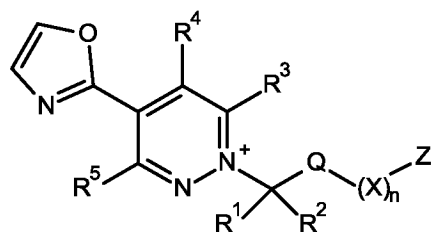


(T-17),

- 10 где m , Q , R^3 , R^4 , R^5 и Z определены выше в таблице 2, R^1 и R^2 представляют собой водород, и n равняется 0.

Таблица 18

В данной таблице раскрыты 49 конкретных соединений формулы (T-18),



15

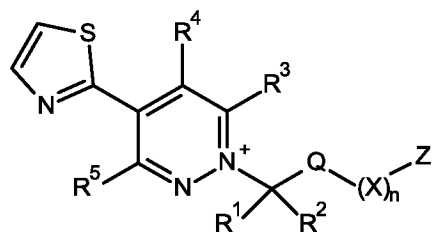
(T-18),

где m , Q , R^3 , R^4 , R^5 и Z определены выше в таблице 3, R^1 и R^2 представляют собой водород, и n равняется 0.

20

Таблица 19

В данной таблице раскрыты 53 конкретные соединения формулы (Т-19),

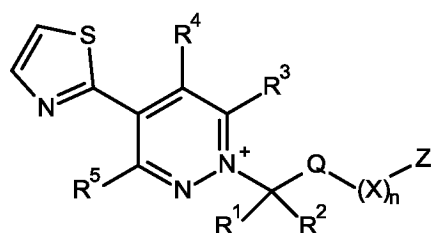


(Т-19),

5 где m , Q , R^3 , R^4 , R^5 и Z определены выше в таблице 1, R^1 и R^2 представляют собой водород, и n равняется 0.

Таблица 20

10 В данной таблице раскрыты 49 конкретных соединений формулы (Т-20),

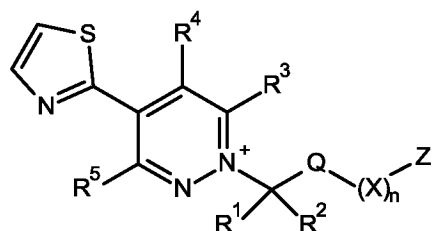


(Т-20),

15 где m , Q , R^3 , R^4 , R^5 и Z определены выше в таблице 2, R^1 и R^2 представляют собой водород, и n равняется 0.

Таблица 21

В данной таблице раскрыты 49 конкретных соединений формулы (Т-21),

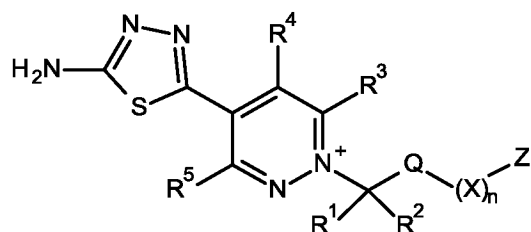


20 (Т-21),

где m , Q , R^3 , R^4 , R^5 и Z определены выше в таблице 3, R^1 и R^2 представляют собой водород, и n равняется 0.

Таблица 22

- 5 В данной таблице раскрыты 53 конкретные соединения формулы (Т-22),

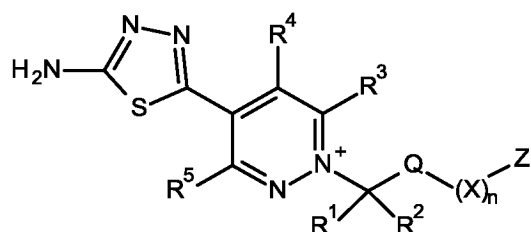


(Т-22),

- 10 где m , Q , R^3 , R^4 , R^5 и Z определены выше в таблице 1, R^1 и R^2 представляют собой водород, и n равняется 0.

Таблица 23

В данной таблице раскрыты 49 конкретных соединений формулы (Т-23),



15

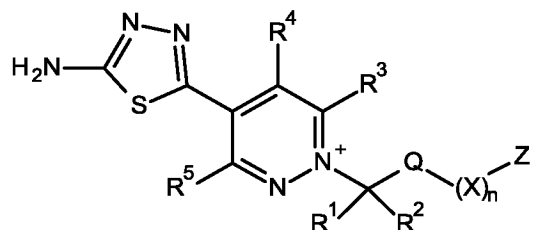
(Т-23),

где m , Q , R^3 , R^4 , R^5 и Z определены выше в таблице 2, R^1 и R^2 представляют собой водород, и n равняется 0.

20

Таблица 24

В данной таблице раскрыты 49 конкретных соединений формулы (Т-24),

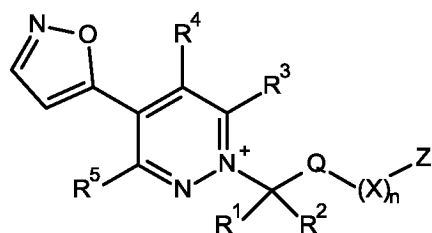


5 (Т-24),

где m, Q, R³, R⁴, R⁵ и Z определены выше в таблице 3, R¹ и R² представляют собой водород, и n равняется 0.

10 Таблица 25

В данной таблице раскрыты 53 конкретные соединения формулы (Т-25),

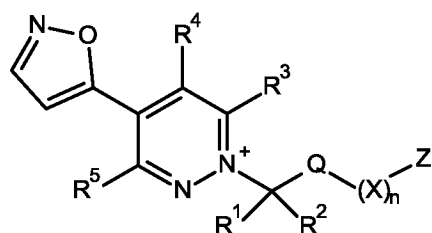


(Т-25),

15 где m, Q, R³, R⁴, R⁵ и Z определены выше в таблице 1, R¹ и R² представляют собой водород, и n равняется 0.

Таблица 26

20 В данной таблице раскрыты 49 конкретных соединений формулы (Т-26),

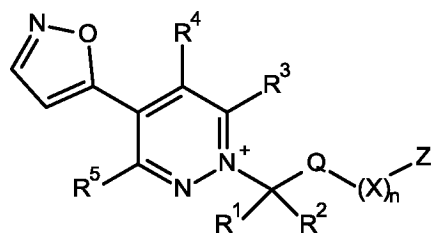


(Т-26),

где m , Q , R^3 , R^4 , R^5 и Z определены выше в таблице 2, R^1 и R^2 представляют собой водород, и n равняется 0.

Таблица 27

5 В данной таблице раскрыты 49 конкретных соединений формулы (T-27),

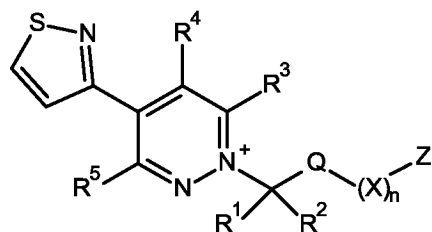


(T-27),

10 где m , Q , R^3 , R^4 , R^5 и Z определены выше в таблице 3, R^1 и R^2 представляют собой водород, и n равняется 0.

Таблица 28

В данной таблице раскрыты 53 конкретные соединения формулы (T-28),



15

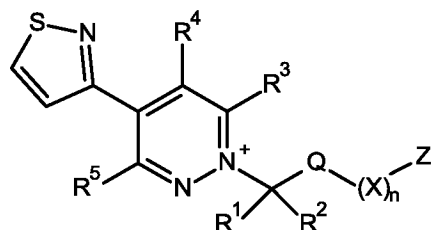
(T-28),

где m , Q , R^3 , R^4 , R^5 и Z определены выше в таблице 1, R^1 и R^2 представляют собой водород, и n равняется 0.

20

Таблица 29

В данной таблице раскрыты 49 конкретных соединений формулы (Т-29),

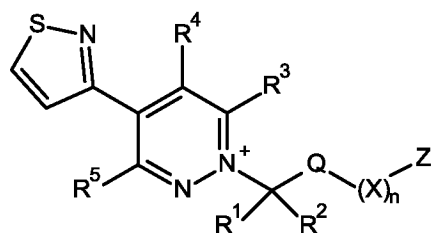


5 (Т-29),

где m , Q , R^3 , R^4 , R^5 и Z определены выше в таблице 2, R^1 и R^2 представляют собой водород, и n равняется 0.

10 Таблица 30

В данной таблице раскрыты 49 конкретных соединений формулы (Т-30),

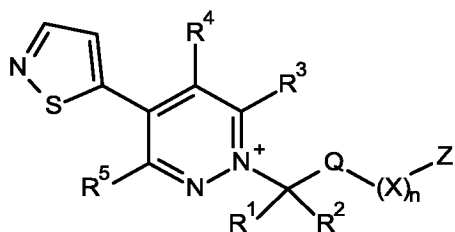


(Т-30),

15 где m , Q , R^3 , R^4 , R^5 и Z определены выше в таблице 3, R^1 и R^2 представляют собой водород, и n равняется 0.

Таблица 31

В данной таблице раскрыты 53 конкретные соединения формулы (Т-31),



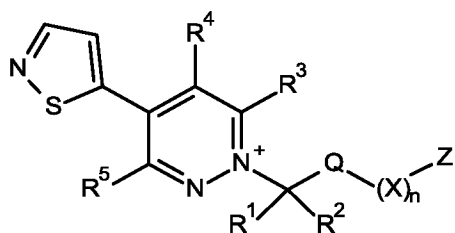
20

(Т-31),

где m , Q , R^3 , R^4 , R^5 и Z определены выше в таблице 1, R^1 и R^2 представляют собой водород, и n равняется 0.

5 Таблица 32

В данной таблице раскрыты 49 конкретных соединений формулы (Т-32),

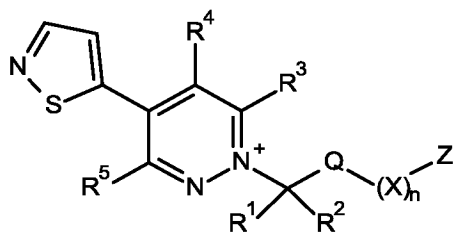


(Т-32),

10 где m , Q , R^3 , R^4 , R^5 и Z определены выше в таблице 2, R^1 и R^2 представляют собой водород, и n равняется 0.

Таблица 33

15 В данной таблице раскрыты 49 конкретных соединений формулы (Т-33),

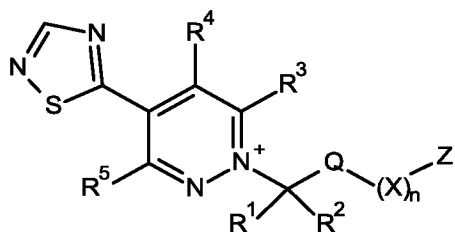


(Т-33),

20 где m , Q , R^3 , R^4 , R^5 и Z определены выше в таблице 3, R^1 и R^2 представляют собой водород, и n равняется 0.

Таблица 34

В данной таблице раскрыты 53 конкретные соединения формулы (Т-34),

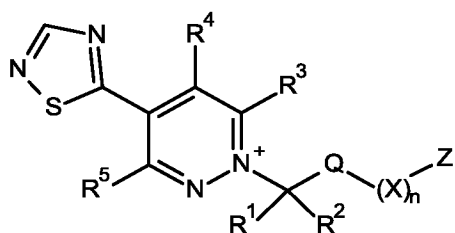


5 (Т-34),

где m, Q, R³, R⁴, R⁵ и Z определены выше в таблице 1, R¹ и R² представляют собой водород, и n равняется 0.

10 Таблица 35

В данной таблице раскрыты 49 конкретных соединений формулы (Т-35),

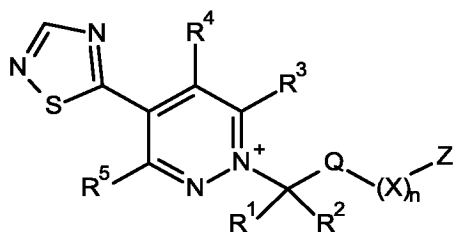


(Т-35),

15 где m, Q, R³, R⁴, R⁵ и Z определены выше в таблице 2, R¹ и R² представляют собой водород, и n равняется 0.

Таблица 36

В данной таблице раскрыты 49 конкретных соединений формулы (Т-36),



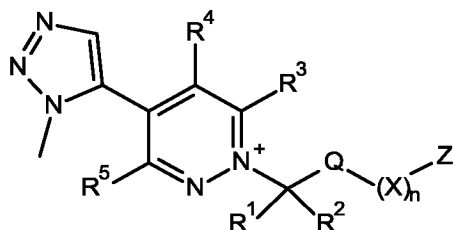
20

(Т-36),

где m , Q , R^3 , R^4 , R^5 и Z определены выше в таблице 3, R^1 и R^2 представляют собой водород, и n равняется 0.

Таблица 37

5 В данной таблице раскрыты 53 конкретные соединения формулы (Т-37),

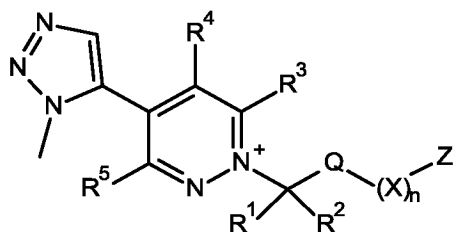


(Т-37),

10 где m , Q , R^3 , R^4 , R^5 и Z определены выше в таблице 1, R^1 и R^2 представляют собой водород, и n равняется 0.

Таблица 38

В данной таблице раскрыты 49 конкретных соединений формулы (Т-38),



15

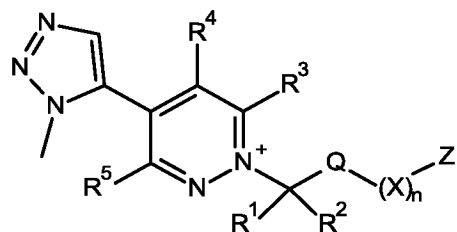
(Т-38),

где m , Q , R^3 , R^4 , R^5 и Z определены выше в таблице 2, R^1 и R^2 представляют собой водород, и n равняется 0.

20

Таблица 39

В данной таблице раскрыты 49 конкретных соединений формулы (Т-39),

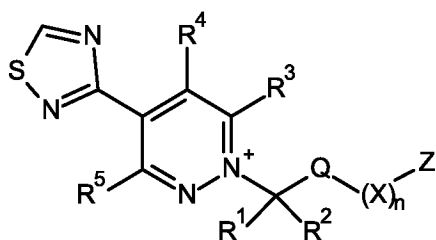


(Т-39),

- 5 где m, Q, R³, R⁴, R⁵ и Z определены выше в таблице 3, R¹ и R² представляют собой водород, и n равняется 0.

Таблица 40

- 10 В данной таблице раскрыты 53 конкретные соединения формулы (Т-40),

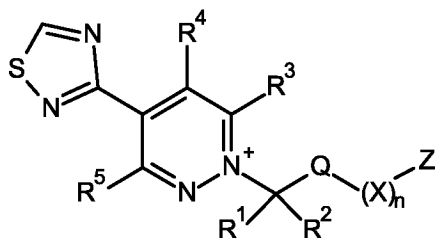


(Т-40),

- 15 где m, Q, R³, R⁴, R⁵ и Z определены выше в таблице 1, R¹ и R² представляют собой водород, и n равняется 0.

Таблица 41

В данной таблице раскрыты 49 конкретных соединений формулы (Т-41),

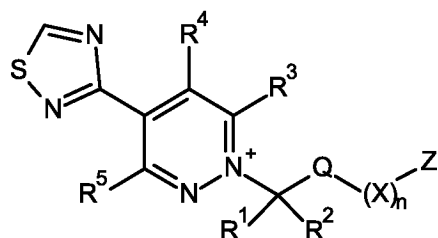


- 20 (Т-41),

где m , Q , R^3 , R^4 , R^5 и Z определены выше в таблице 2, R^1 и R^2 представляют собой водород, и n равняется 0.

Таблица 42

- 5 В данной таблице раскрыты 49 конкретных соединений формулы (Т-42),



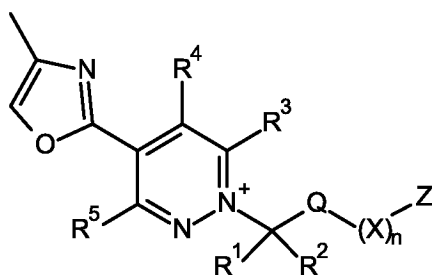
(T-42),

где m , Q , R^3 , R^4 , R^5 и Z определены выше в таблице 3, R^1 и R^2 представляют собой водород, и n равняется 0.

10

Таблица 43

В данной таблице раскрыты 53 конкретные соединения формулы (Т-43),

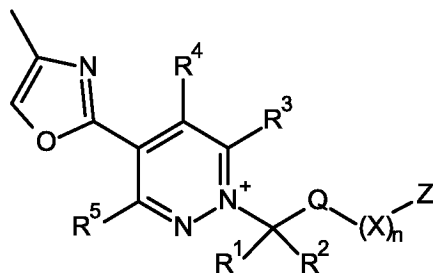


15 (T-43),

где m , Q , R^3 , R^4 , R^5 и Z определены выше в таблице 1, R^1 и R^2 представляют собой водород, и n равняется 0.

Таблица 44

В данной таблице раскрыты 49 конкретных соединений формулы (Т-44),

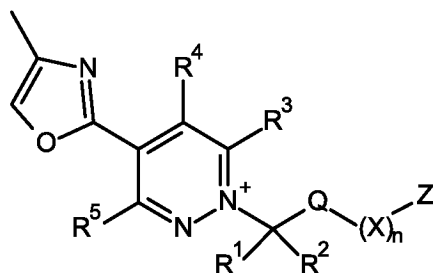


(Т-44),

- 5 где m, Q, R³, R⁴, R⁵ и Z определены выше в таблице 2, R¹ и R² представляют собой водород, и n равняется 0.

Таблица 45

- 10 В данной таблице раскрыты 49 конкретных соединений формулы (Т-45),

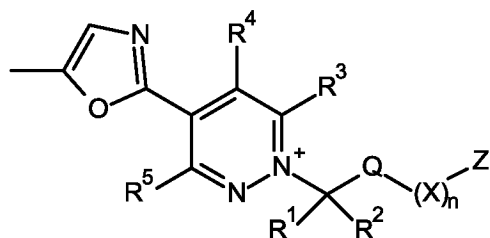


(Т-45),

- 15 где m, Q, R³, R⁴, R⁵ и Z определены выше в таблице 3, R¹ и R² представляют собой водород, и n равняется 0.

Таблица 46

В данной таблице раскрыты 53 конкретные соединения формулы (Т-46),

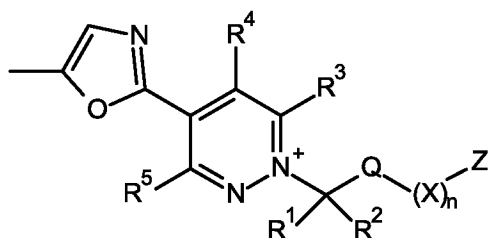


- 20 (Т-46),

где m , Q , R^3 , R^4 , R^5 и Z определены выше в таблице 1, R^1 и R^2 представляют собой водород, и n равняется 0.

Таблица 47

- 5 В данной таблице раскрыты 49 конкретных соединений формулы (Т-47),



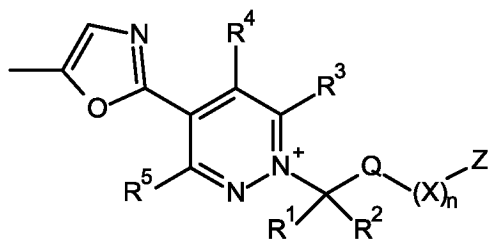
(Т-47),

где m , Q , R^3 , R^4 , R^5 и Z определены выше в таблице 2, R^1 и R^2 представляют собой водород, и n равняется 0.

10

Таблица 48

В данной таблице раскрыты 49 конкретных соединений формулы (Т-48),



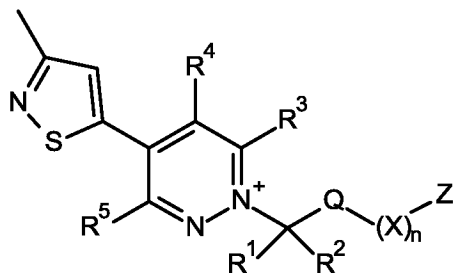
(Т-48),

15

где m , Q , R^3 , R^4 , R^5 и Z определены выше в таблице 3, R^1 и R^2 представляют собой водород, и n равняется 0.

Таблица 49

В данной таблице раскрыты 53 конкретные соединения формулы (Т-49),

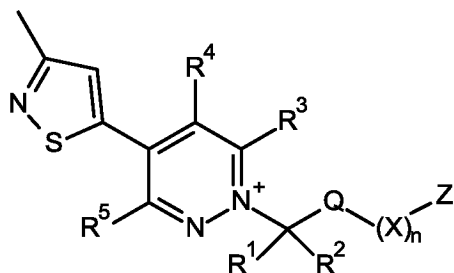


(Т-49),

5 где m, Q, R³, R⁴, R⁵ и Z определены выше в таблице 1, R¹ и R² представляют собой водород, и n равняется 0.

Таблица 50

10 В данной таблице раскрыты 49 конкретных соединений формулы (Т-50),

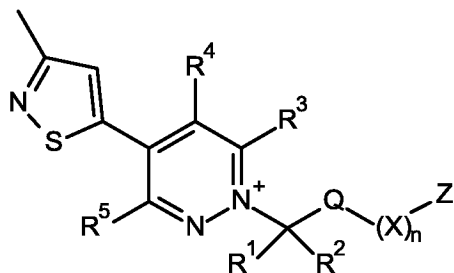


(Т-50),

15 где m, Q, R³, R⁴, R⁵ и Z определены выше в таблице 2, R¹ и R² представляют собой водород, и n равняется 0.

Таблица 51

В данной таблице раскрыты 49 конкретных соединений формулы (Т-51),

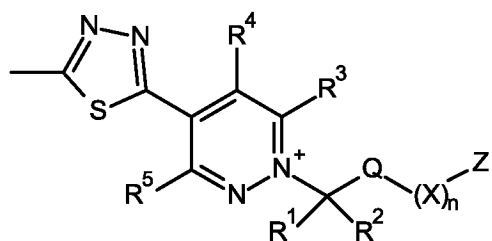


20 (Т-51),

где m , Q , R^3 , R^4 , R^5 и Z определены выше в таблице 3, R^1 и R^2 представляют собой водород, и n равняется 0.

5 Таблица 52

В данной таблице раскрыты 53 конкретные соединения формулы (Т-52),

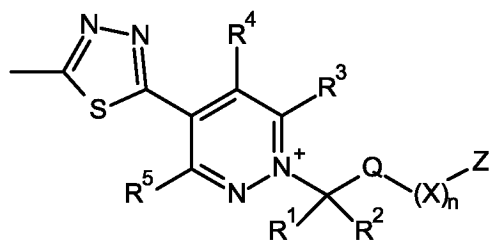


(Т-52),

10 где m , Q , R^3 , R^4 , R^5 и Z определены выше в таблице 1, R^1 и R^2 представляют собой водород, и n равняется 0.

Таблица 53

В данной таблице раскрыты 49 конкретных соединений формулы (Т-53),



15

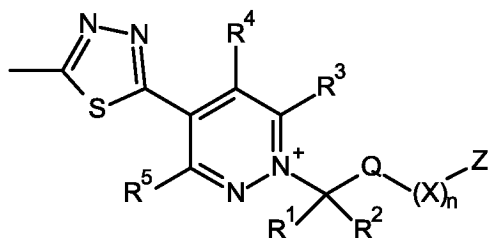
(Т-53),

где m , Q , R^3 , R^4 , R^5 и Z определены выше в таблице 2, R^1 и R^2 представляют собой водород, и n равняется 0.

20

Таблица 54

В данной таблице раскрыты 49 конкретных соединений формулы (Т-54),

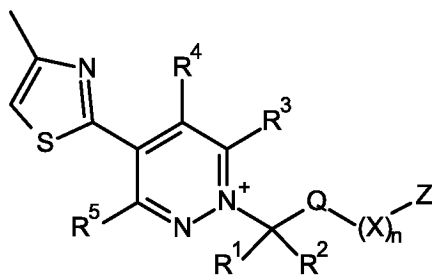


(Т-54),

- 5 где m, Q, R³, R⁴, R⁵ и Z определены выше в таблице 3, R¹ и R² представляют собой водород, и n равняется 0.

Таблица 55

- 10 В данной таблице раскрыты 53 конкретные соединения формулы (Т-55),

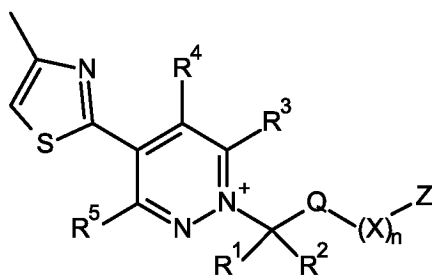


(Т-55),

- 15 где m, Q, R³, R⁴, R⁵ и Z определены выше в таблице 1, R¹ и R² представляют собой водород, и n равняется 0.

Таблица 56

В данной таблице раскрыты 49 конкретных соединений формулы (Т-56),

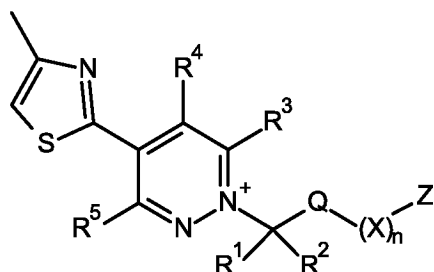


- 20 (Т-56),

где m , Q , R^3 , R^4 , R^5 и Z определены выше в таблице 2, R^1 и R^2 представляют собой водород, и n равняется 0.

Таблица 57

5 В данной таблице раскрыты 49 конкретных соединений формулы (T-57),



(T-57),

10 где m , Q , R^3 , R^4 , R^5 и Z определены выше в таблице 3, R^1 и R^2 представляют собой водород, и n равняется 0.

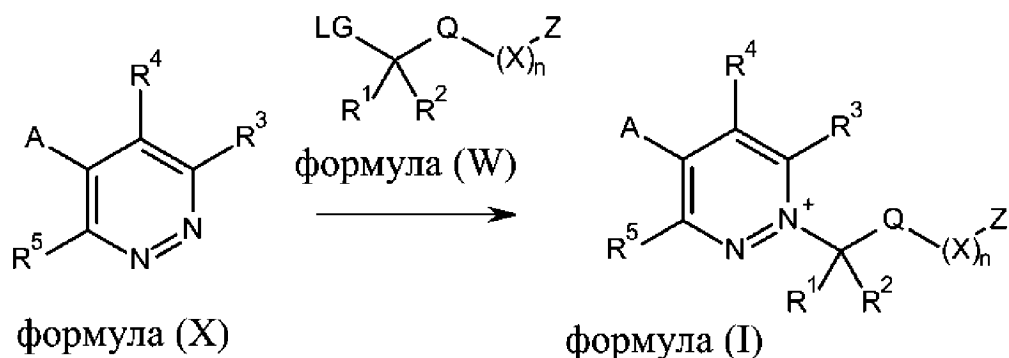
15 Соединения по настоящему изобретению можно получать в соответствии со следующими схемами, в которых заместители n , m , r , A , Q , X , Z , R^1 , R^2 , R^{1a} , R^{2b} , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 , R^7 , R^{7a} , R^{7b} , R^{7c} , R^8 , R^9 , R^{10} , R^{11} , R^{12} , R^{13} , R^{14} , R^{15} , R^{15a} , R^{16} , R^{17} и R^{18} определены в данном документе ранее, если явно не указано иное. Таким образом, соединения из предыдущих таблиц 1-57 могут быть получены аналогичным образом.

20 Соединения формулы (I) могут быть получены путем алкилирования соединений формулы (X), где R^3 , R^4 , R^5 и A определены для соединений формулы (I), с помощью подходящего алкилирующего средства формулы (W), где R^1 , R^2 , Q , X , n и Z определены для соединений формулы (I), и LG представляет собой подходящую уходящую группу, например галогенид или псевдогалогенид, такой как трифлат, мезилат или тозилат, в подходящем растворителе при подходящей температуре, как описано на схеме реакции 1. Иллюстративные условия включают перемешивание соединения формулы (X) с алкилирующим средством формулы (W) в растворителе или смеси растворителей, таких как ацетон, дихлорметан, дихлорэтан, *N,N*-диметилформамид, ацетонитрил, 1,4-диоксан, вода, уксусная кислота или трифторуксусная кислота, при температуре от -78°C и 150°C . Алкилирующее средство формулы (W) может включать без ограничения бромуксусную кислоту, метилбромацетат, 3-бромпропионовую кислоту, метил-3-бромпропионат, 2-бром-*N*-

метоксиацетамид, 2-бромэтансульфонат натрия, 2,2-диметилпропил-2-(трифторметилсульфонилокси)этансульфонат, 2-бром-N-метансульфонилацетамид, 3-бром-N-метансульфонилпропанамид,

диметоксифосфорилметилтрифторметансульфонат, диметил-3-бромпропилфосфонат, 3-хлор-2,2-диметилпропановую кислоту и диэтил-2-бромэтилфосфонат. Такие алкилирующие средства и родственные соединения либо известны из литературы, либо могут быть получены посредством известных из литературы способов. Соединения формулы (I), которые могут быть описаны как сложные эфиры N-алкильных кислот, которые включают без ограничения сложные эфиры карбоновых кислот, фосфоновых кислот, фосфиновых кислот, сульфоновых кислот и сульфиновых кислот, могут быть затем частично или полностью гидролизованы путем обработки подходящим реагентом, например водным раствором хлористоводородной кислоты или триметилсилилбромидом, в подходящем растворителе при подходящей температуре от 0°C до 100°C.

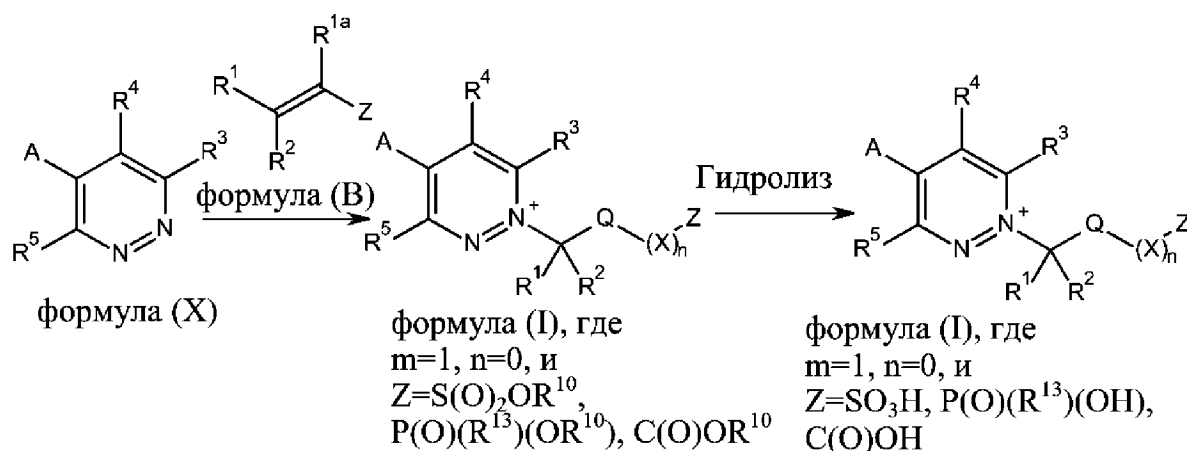
Схема реакции 1



Кроме того, соединения формулы (I) могут быть получены путем осуществления реакции соединений формулы (X), где R³, R⁴, R⁵ и A определены для соединений формулы (I), с соответствующим образом активированным электрофильным алкеном формулы (B), где Z представляет собой -S(O)₂OR¹⁰, -P(O)(R¹³)(OR¹⁰) или -C(O)OR¹⁰, и R¹, R², R^{1a}, R¹⁰ и R¹³ определены для соединений формулы (I), в подходящем растворителе при подходящей температуре. Соединения формулы (B) известны из литературы или могут быть получены посредством известных способов. Иллюстративные реагенты включают без ограничения акриловую кислоту, метакриловую кислоту, кротоновую кислоту, 3,3-диметилакриловую кислоту, метилакрилат, этенсульфоновую кислоту, изопропилэтиленсульфонат, 2,2-

диметилпропилэтенсульфонат и диметилвинилфосфонат. Непосредственные продукты данных реакций, которые могут быть описаны как сложные эфиры N-алкильных кислот, которые включают без ограничения сложные эфиры карбоновых кислот, фосфоновых кислот, фосфиновых кислот, сульфоновых кислот и сульфиновых кислот, могут быть затем частично или полностью гидролизованы путем обработки подходящим реагентом в подходящем растворителе при подходящей температуре, как описано на схеме реакции 2.

Схема реакции 2



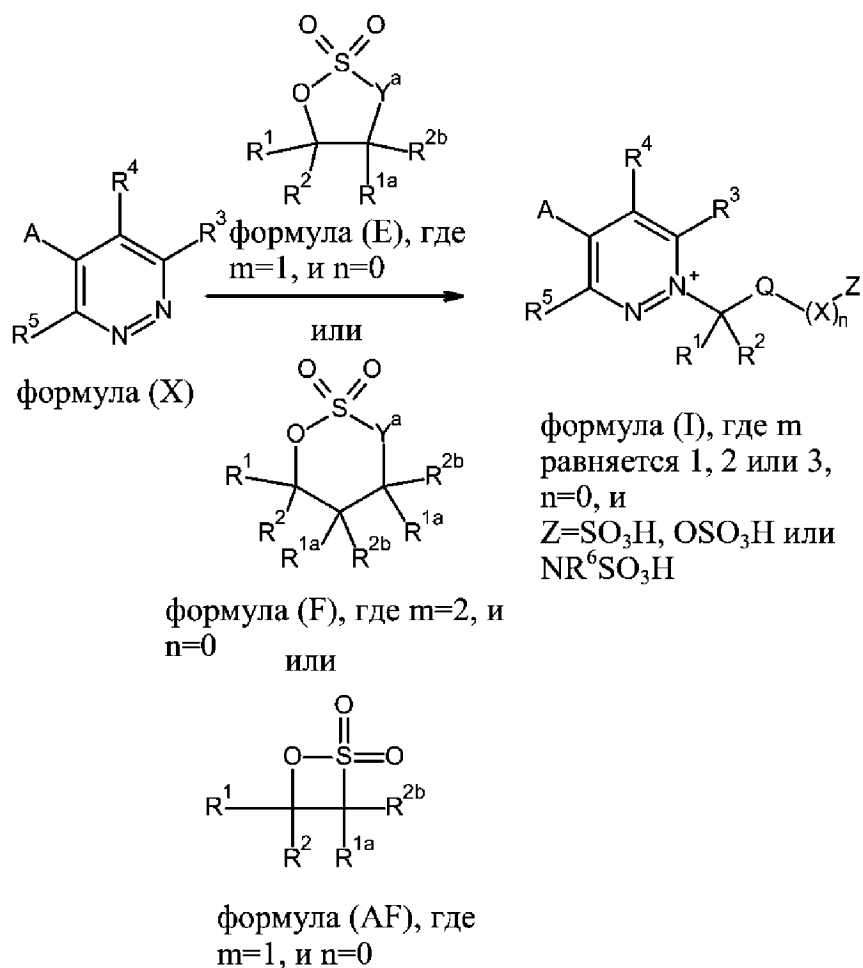
10

15

20

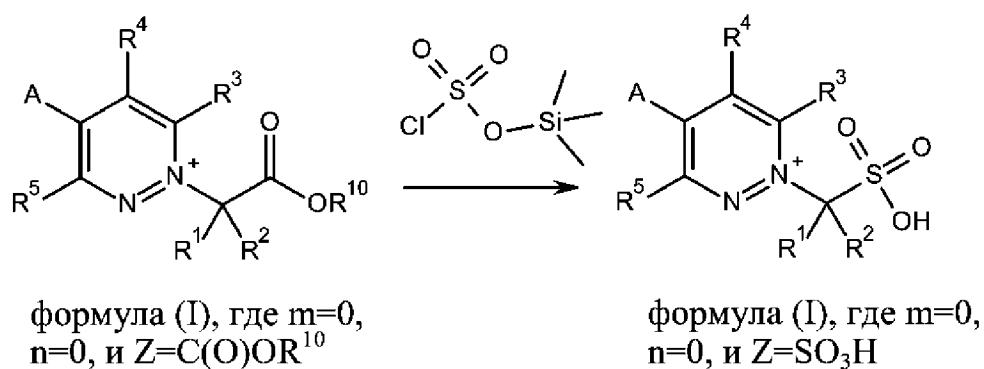
В родственных реакциях соединения формулы (I), где Q представляет собой $C(R^{1a}R^{2b})$, m равняется 1, 2 или 3, $n=0$, и Z представляет собой $-S(O)_2OH$, $-OS(O)_2OH$ или $-NR^6S(O)_2OH$, могут быть получены путем осуществления реакции соединений формулы (X), где R^3 , R^4 , R^5 и A определены для соединений формулы (I), с циклическим алкилирующим средством формулы (E), (F) или (AF), где Y^a представляет собой $C(R^{1a}R^{2b})$, O или NR^6 , и R^1 , R^2 , R^{1a} и R^{2b} определены для соединений формулы (I), в подходящем растворителе при подходящей температуре, как описано на схеме реакции 3. Подходящие растворители и подходящие температуры описаны ранее. Алкилирующее средство формулы (E) или (F) может включать без ограничения 1,3-пропансультон, 1,4-бутансультон, этиленсульфат, 1,3-пропиленсульфат и 1,2,3-оксатиазолидин-2,2-диоксид. Такие алкилирующие средства и родственные соединения либо известны из литературы, либо могут быть получены посредством известных из литературы способов.

Схема реакции 3



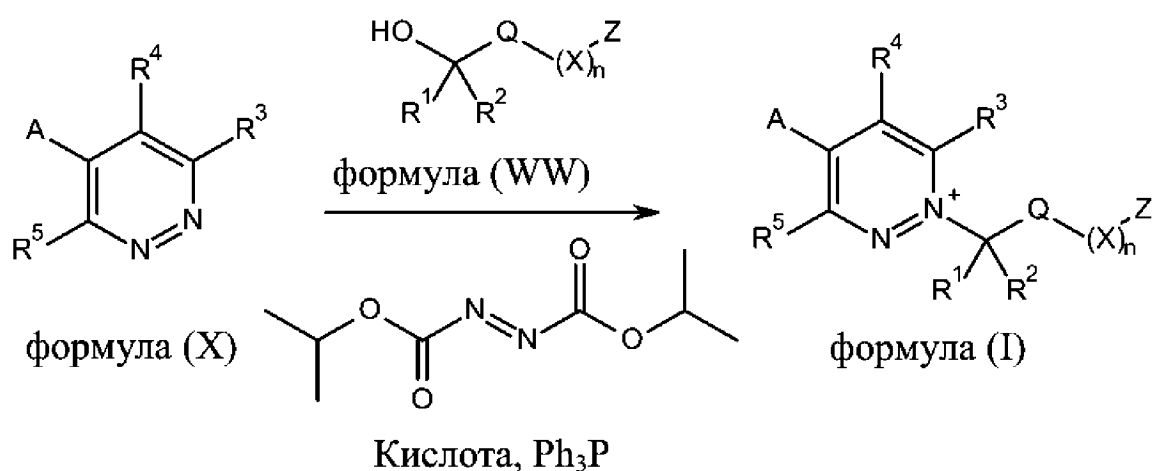
- 5 Соединение формулы (I), где m равняется 0, n равняется 0, и Z представляет собой $-S(O)_2OH$, может быть получено из соединения формулы (I), где m равняется 0, n равняется 0, и Z представляет собой $C(O)OR^{10}$, путем обработки с помощью триметилсилилхлорсульфоната в подходящем растворителе при подходящей температуре, как описано на схеме реакции 4. Предпочтительные условия включают
- 10 нагревание карбоксилатного предшественника в чистом триметилсилилхлорсульфонате при температуре от $25^\circ C$ до $150^\circ C$.

Схема реакции 4



Кроме того, соединения формулы (I) могут быть получены путем осуществления
 5 реакций соединений формулы (X), где R^3 , R^4 , R^5 и A определены для соединений
 формулы (I), с подходящим спиртом формулы (WW), где R^1 , R^2 , Q, X, n и Z определены
 для соединений формулы (I), в условиях типа реакции Мицунобу, таких как условия,
 описанные Petit et al, Tet. Lett. 2008, 49 (22), 3663. Подходящие фосфины включают
 трифенилфосфин, подходящие азодикарбоксилаты включают
 10 диизопропилазодикарбоксилат, и подходящие кислоты включают фторборную кислоту,
 трифлатную кислоту и бис(трифторметилсульфонил)амин, как описано на схеме
 реакции 5. Такие спирты либо известны из литературы, либо могут быть получены
 посредством известных из литературы способов.

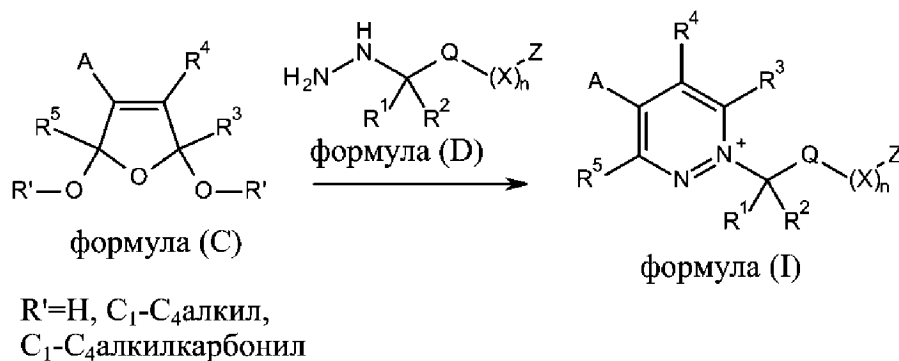
15 Схема реакции 5



Соединения формулы (I) также могут быть получены путем осуществления реакции
 соединений формулы (C), где Q, Z, X, n, R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 и A определены для

соединений формулы (I), с гидразином формулы (D) в подходящем растворителе или смеси растворителей в присутствии подходящей кислоты при подходящей температуре от -78°C до 150°C, как описано на схеме реакции 6. Подходящие растворители или их смеси включают без ограничения спирты, такие как метанол, этанол и изопропанол, воду, водный раствор хлористоводородной кислоты, водный раствор серной кислоты, уксусную кислоту и трифторуксусную кислоту. Гидразиновые соединения формулы (D), например 2,2-диметилпропил-2-гидразиноэтансульфонат, либо известны из литературы, либо могут быть получены посредством известных из литературы способов.

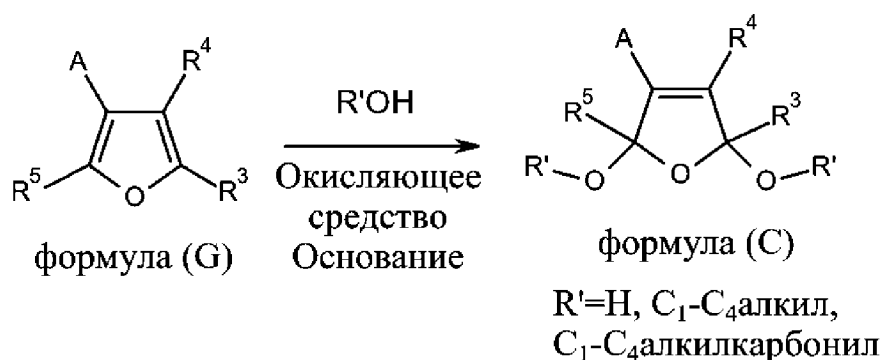
Схема реакции 6



Соединения формулы (C) могут быть получены путем осуществления реакции соединений формулы (G), где R³, R⁴, R⁵ и A определены для соединений формулы (I), с окисляющим средством в подходящем растворителе при подходящей температуре от -78°C до 150°C необязательно в присутствии подходящего основания, как описано на схеме реакции 7. Подходящие окисляющие средства включают без ограничения бром, и подходящие растворители включают без ограничения спирты, такие как метанол, этанол и изопропанол. Подходящие основания включают без ограничения бикарбонат натрия, карбонат натрия, бикарбонат калия, карбонат калия и ацетат калия. Подобные реакции известны в литературе (например, Hufford, D. L.; Tarbell, D. S.; Koszalka, T. R. J. Amer. Chem. Soc., 1952, 3014). Фураны формулы (G) известны из литературы или могут быть получены с применением способов известных из литературы. Иллюстративные способы включают без ограничения реакции кросс-сочетания, в которых используют переходные металлы, такие как реакция Стилле (например, Farina, V.; Krishnamurthy, V.; Scott, W. J. Organic Reactions, Vol. 50. 1997 и Gazzard, L. et al. J. Med. Chem., 2015, 5053), Сузуки-Мияуры (например, Ando, S.; Matsunaga, H.; Ishizuka,

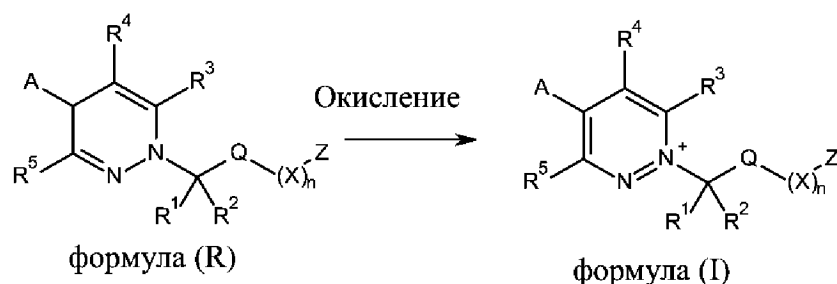
T. J. Org. Chem. 2017, 1266-1272 и Ernst, J. B.; Rakers, L.; Glorius, F. Synthesis, 2017, 260), Негиши (например, Yang, Y.; Oldenhius, N. J.; Buchwald, S. L. Angew. Chem. Int. Ed. 2013, 615 и Braendvang, M.; Gundersen, L. Bioorg. Med. Chem. 2005, 6360) и Кумада (например, Heravi, M. M.; Hajiabbasi, P. Monatsh. Chem., 2012, 1575). Компоненты для реакции сочетания могут быть выбраны на основании конкретной реакции кросс-сочетания и целевого продукта. Катализаторы на основе переходных металлов, лиганды, основания, растворители и значения температуры могут быть выбраны на основании необходимого кросс-сочетания и известны в литературе. Реакции кросс-сочетания с применением псевдогалогенов, в том числе без ограничения трифлатов, мезилатов, тозилатов и анизолов, также могут быть обеспечены в соответствующих условиях.

Схема реакции 7



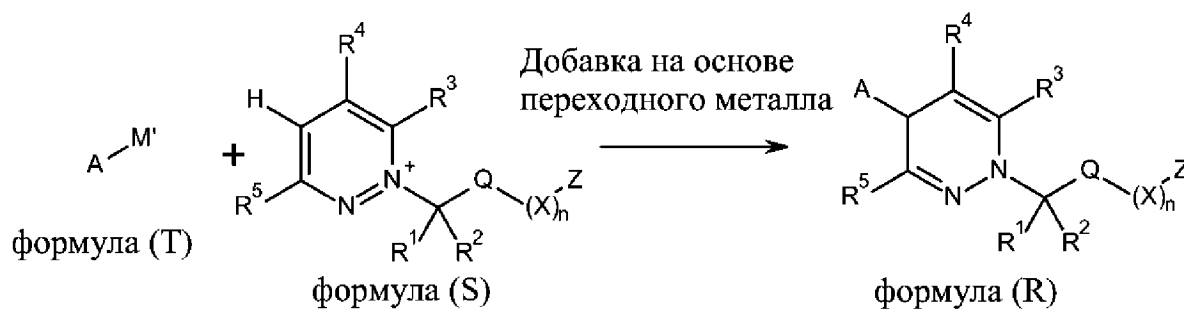
В другом подходе соединение формулы (I), где Q, Z, X, R¹, R², R³, R⁴, R⁵ и A определены для соединений формулы (I), может быть получено из соединения формулы (R) и окислителя в подходящем растворителе при подходящей температуре, как указано на схеме реакции 8. Иллюстративные окислители включают без ограничения 2,3-дихлор-5,6-дициано-1,4-бензохинон, тетрахлор-п-бензохинон, перманганат калия, диоксид марганца, 2,2,6,6-тетраметил-1-пиперидинилокси и бром. Родственные реакции известны в литературе.

Схема реакции 8



Соединение формулы (R), где Q, Z, X, n, R¹, R², R³, R⁴, R⁵ и A определены для соединений формулы (I), может быть получено из соединения формулы (S), где Q, Z, X, n, R¹, R², R³, R⁴ и R⁵ определены для соединений формулы (I), и металлоорганического соединения формулы (T), где M' включает без ограничения магнийорганические, литийорганические, медьорганические и цинкорганические реагенты, в подходящем растворителе при подходящей температуре необязательно в присутствии дополнительной добавки на основе переходного металла, как указано на схеме реакции 9. Иллюстративные условия включают обработку соединения формулы (S) реактивом Гриньяра формулы (T) в присутствии 0,05-100 мол. % йодида меди в растворителе, таком как тетрагидрофуран, при температуре от -78°C до 100°C. Металлоорганические соединения формулы (T) известны в литературе или могут быть получены посредством известных из литературы способов. Соединения формулы (S) могут быть получены посредством реакций, аналогичных реакциям для получения соединений формулы (I) из соединения формулы (XX).

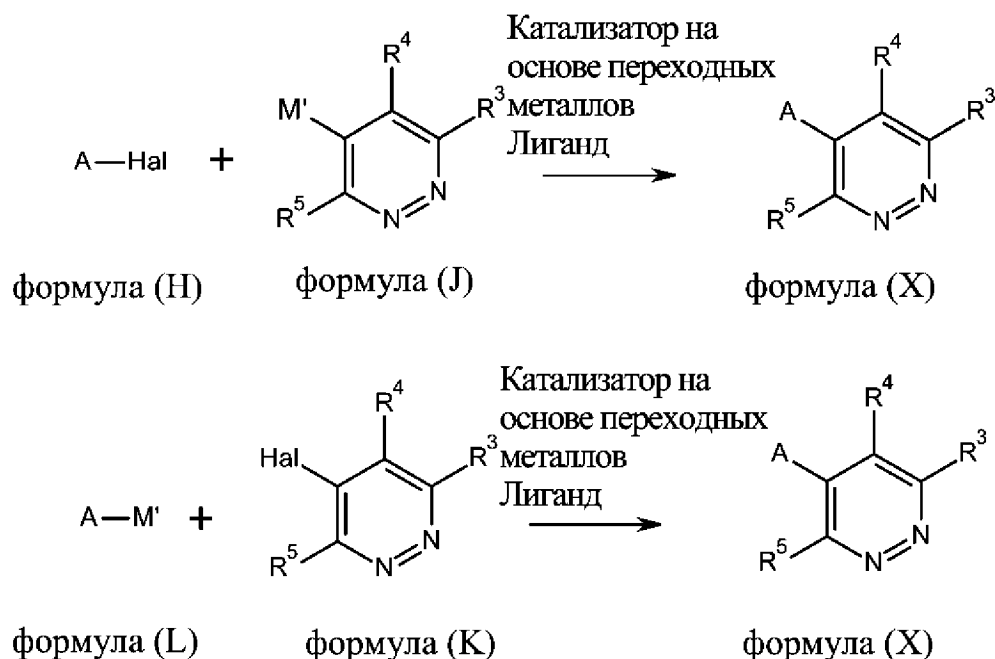
Схема реакции 9



Биарилпиридазины формулы (X) известны в литературе или могут быть получены с применением известных из литературы способов. Иллюстративные способы включают без ограничения реакцию кросс-сочетания, в которой используют переходные металлы,

соединений формулы (H) и формулы (J) или альтернативно соединений формулы (K) и формулы (L), где в соединениях формулы (J) и формулы (L) M' представляет собой любое из органостаннана, органобороновой кислоты или сложного эфира, органотрифторбората, магнийорганического соединения, медьорганического соединения или цинкорганического соединения, как указано на схеме реакции 10. Hal определен как галоген или псевдогалоген, например трифлат, мезилат и тозилат. Такие реакции кросс-сочетания включают реакции Стилле, Сузуки-Мияуры, Негиши и Кумады (например, WO 2017035409, WO 2016046530, WO 2015161924 и WO 2013062079). Компоненты для реакции сочетания могут быть выбраны на основании конкретной реакции кросс-сочетания и целевого продукта. Катализаторы на основе переходных металлов, лиганды, основания, растворители и значения температуры могут быть выбраны на основании необходимого кросс-сочетания и известны в литературе. Соединения формулы (H), формулы (K) и формулы (L) известны в литературе или могут быть получены посредством известных из литературы способов.

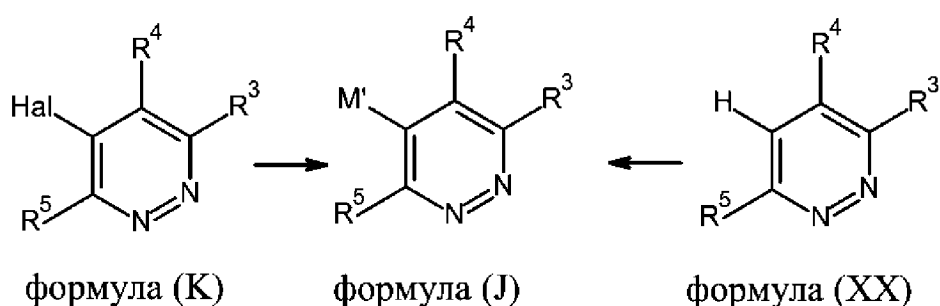
Схема реакции 10



Соединение формулы (J), где M' представляет собой любое из органостаннана, органобороновой кислоты или сложного эфира, органотрифторбората, магнийорганического соединения, медьорганического соединения или

цинкорганического соединения, может быть получено из соединения формулы (XX), где R^3 , R^4 и R^5 определены для соединений формулы (I), путем металлирования, как указано на схеме реакции 11. Аналогичные реакции известны в литературе (например, Ramphal et al., WO 2015/153683, Unsinn et al., Organic Letters, 15(5), 1128-1131; 2013, Sadler et al., Organic & Biomolecular Chemistry, 12(37), 7318-7327; 2014). Альтернативно металлоорганическое соединение формулы (J) может быть получено из соединений формулы (K), где R^3 , R^4 , R^5 определены для соединений формулы (I), и Hal определен как галоген или псевдогалоген, например, трифлат, мезилат и тозилат, как описано на схеме 11. Иллюстративные условия получения соединения формулы (J), где M' представляет собой органостаннан, включают обработку соединения формулы (K) комплексом лития с трибутилоловом в соответствующем растворителе при соответствующей температуре (например, см. WO 2010038465). Иллюстративные условия получения соединения формулы (J), где M' представляет собой органобороновую кислоту или сложный эфир, включают обработку соединения формулы (K) с помощью бис(пинаколато)дибора в присутствии соответствующего катализатора на основе переходного металла, соответствующего лиганда, соответствующего основания в соответствующем растворителе при соответствующей температуре (например, KR 2015135626). Соединения формулы (K) и формулы (XX) либо известны в литературе, либо могут быть получены посредством известных способов.

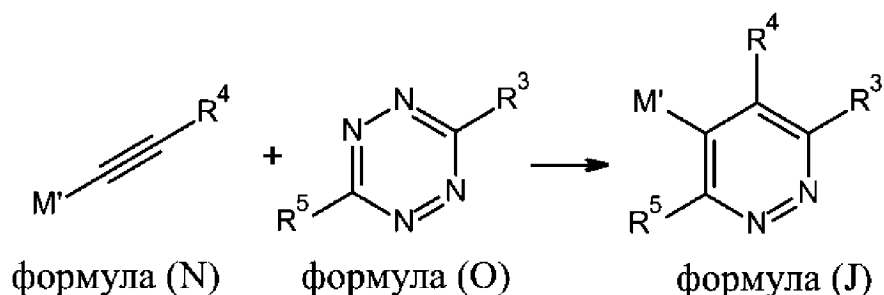
Схема реакции 11



В другом подходе соединение формулы (J), в котором M' представляет собой либо органостаннан, либо органобороновую кислоту или сложный эфир, может быть получено из соединения формулы (N) и соединения формулы (O), где R^3 , R^4 и R^5 определены для соединений формулы (I), как указано на схеме реакции 12. Примеры такой реакции известны в литературе, например, Helm et al., Org. and Biomed. Chem.,

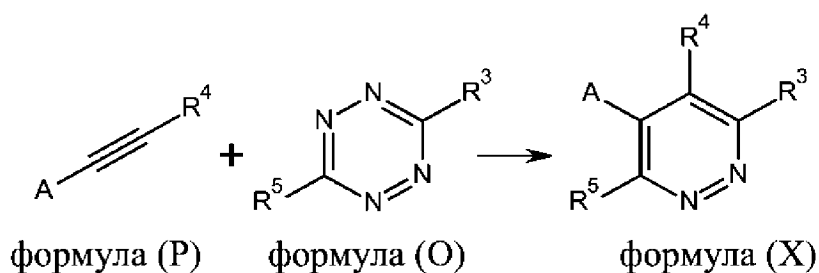
2006, 4 (23), 4278, Sauer et al., Eur. J. Org. Chem., 1998, 12, 2885 и Helm, M. D.; Moore, J. E.; Plant, A.; Harrity, J. P. A., Angew. Chem. Int. Ed., 2005, 3889. Соединения формулы (N) и формулы (O) известны в литературе.

5 Схема реакции 12



Соединения формулы (X), где R^3 , R^4 , R^5 и A определены ранее, может быть получено из соединений формулы (P) и формулы (O) в соответствующем растворителе при соответствующей температуре, как указано на схеме реакции 13. Примеры такой реакции известны в литературе, например, WO 2001038332. Соединения формулы (P) известны в литературе или могут быть получены посредством осуществления известных способов.

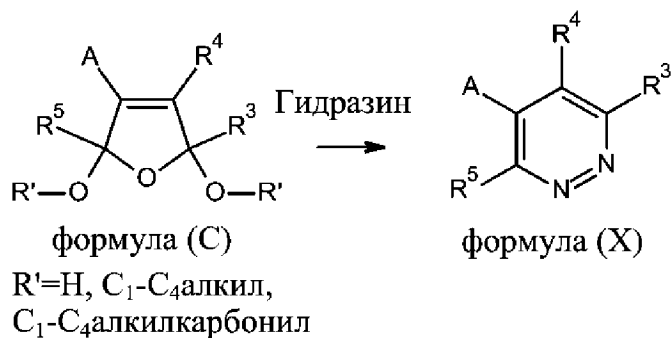
15 Схема реакции 13



В дополнительном подходе соединение формулы (X), где R^3 , R^4 , R^5 и A определены для соединений формулы (I), может быть получено из соединений формулы (C) и гидразина в соответствующем растворителе при соответствующей температуре, как указано на схеме реакции 14. Также необязательно данная реакция может быть осуществлена в присутствии кислоты, например водного раствора серной кислоты или водного раствора хлористоводородной кислоты. Аналогичные реакции известны в литературе (например, DE 102005029094 и Chen, B.; Bohnert, T.; Zhou, X.; Dedon, P. C.

Chem. Res. Toxicol., 2004, 1406). Соединения формулы (C) могут быть получены, как указано ранее.

Схема реакции 14



Наконец, в дополнительном подходе, указанном на схеме 15, биарилпиридазины формулы (X) могут быть получены с помощью классических подходов для синтеза колец, исходя из соединения формулы (U), где Т представляет собой функциональную группу, которое можно превратить посредством одной или нескольких химических стадий в 5-членный гетероарил А, где А определен для соединений формулы (I). Такие функциональные группы включают без ограничения кислоту, сложный эфир, нитрил, амид, тиаамид и кетон. Родственные преобразования известны в литературе.

Схема реакции 15



Соединения в соответствии с настоящим изобретением можно применять в качестве гербицидных средств в немодифицированной форме, но, как правило, их различными способами составляют в композиции с применением вспомогательных веществ для составления, таких как носители, растворители и поверхностно-активные вещества. Составы могут находиться в различных физических формах, например, в форме распыляемых порошков, гелей, смачиваемых порошков, диспергируемых в воде

гранул, диспергируемых в воде таблеток, шипучих драже, эмульгируемых концентратов, концентратов микроэмульсий, эмульсий типа "масло в воде", масляных текучих составов, водных дисперсий, масляных дисперсий, суспензий, капсульных суспензий, эмульгируемых гранул, растворимых жидкостей, водорастворимых концентратов (с водой или смешиваемым с водой органическим растворителем в качестве носителя), пропитанных полимерных пленок или в других формах, известных, например, из Manual on Development and Use of FAO and WHO Specifications for Pesticides, United Nations, First Edition, Second Revision (2010). Такие составы можно либо применять непосредственно, либо разбавлять перед применением. Разбавления можно осуществлять, например, с помощью воды, жидких удобрений, питательных микроэлементов, биологических организмов, масла или растворителей.

Составы можно получать, например, путем смешивания активного ингредиента со вспомогательными веществами для составления с получением композиций в форме тонкодисперсных твердых веществ, гранул, растворов, дисперсий или эмульсий. Активные ингредиенты также можно составлять с другими вспомогательными веществами, например, тонкодисперсными твердыми веществами, минеральными маслами, маслами растительного или животного происхождения, модифицированными маслами растительного или животного происхождения, органическими растворителями, водой, поверхностно-активными веществами или их комбинациями.

Активные ингредиенты также могут содержаться в очень мелких микрокапсулах. Микрокапсулы содержат активные ингредиенты в пористом носителе. Это обеспечивает возможность высвобождения активных ингредиентов в окружающую среду в регулируемых количествах (например, медленного высвобождения). Микрокапсулы обычно имеют диаметр от 0,1 до 500 микрон. Они содержат активные ингредиенты в количестве от приблизительно 25 до 95% по весу от веса капсулы. Активные ингредиенты могут находиться в форме монолитного твердого вещества, в форме мелких частиц в твердой или жидкой дисперсии или в форме подходящего раствора. Инкапсулирующие мембраны могут содержать, например, природные и синтетические каучуки, целлюлозу, сополимеры стирола и бутадиена, полиакрилонитрил, полиакрилат, сложные полиэфиры, полиамиды, полимочевины, полиуретан или химически модифицированные полимеры и ксантаты крахмала или другие полимеры, которые известны специалисту в данной области техники. Альтернативно могут быть образованы очень мелкие микрокапсулы, в которых активный ингредиент содержится в форме тонкодисперсных частиц в твердой матрице

основного вещества, однако микрокапсулы сами по себе не являются инкапсулированными.

Вспомогательные вещества для составления, которые являются подходящими для получения композиций в соответствии с настоящим изобретением, являются известными *per se*. В качестве жидких носителей можно применять воду, толуол, ксилол, петролейный эфир, растительные масла, ацетон, метилэтилкетон, циклогексанон, ангидриды кислот, ацетонитрил, ацетофенон, амилацетат, 2-бутанон, бутиленкарбонат, хлорбензол, циклогексан, циклогексанол, алкиловые сложные эфиры уксусной кислоты, диацетоновый спирт, 1,2-дихлорпропан, диэтаноламин, п-диэтилбензол, диэтиленгликоль, абиетат диэтиленгликоля, бутиловый простой эфир диэтиленгликоля, этиловый простой эфир диэтиленгликоля, метиловый простой эфир диэтиленгликоля, *N,N*-диметилформамид, диметилсульфоксид, 1,4-диоксан, дипропиленгликоль, метиловый эфир дипропиленгликоля, дибензоат дипропиленгликоля, дипрокситол, алкилпирролидон, этилацетат, 2-этилгексанол, этиленкарбонат, 1,1,1-трихлорэтан, 2-гептанон, альфа-пинен, d-лимонен, этиллактат, этиленгликоль, бутиловый простой эфир этиленгликоля, метиловый простой эфир этиленгликоля, гамма-бутиролактон, глицерин, ацетат глицерина, диацетат глицерина, триацетат глицерина, гексадекан, гексиленгликоль, изоамилацетат, изоборнилацетат, изооктан, изофорон, изопропилбензол, изопропилмиристат, молочную кислоту, лауриламин, мезитилоксид, метоксипропанол, метил-изоамилкетон, метил-изобутилкетон, метиллаурат, метилоктаноат, метилолеат, метиленхлорид, м-ксилол, *n*-гексан, *n*-октиламин, октадекановую кислоту, октиламинацетат, олеиновую кислоту, олеиламин, о-ксилол, фенол, полиэтиленгликоль, пропионовую кислоту, пропиллактат, пропиленкарбонат, пропиленгликоль, метиловый эфир пропиленгликоля, п-ксилол, толуол, триэтилфосфат, триэтиленгликоль, ксилолсульфоновую кислоту, парафин, минеральное масло, трихлорэтилен, перхлорэтилен, этилацетат, амилацетат, бутилацетат, метиловый простой эфир пропиленгликоля, метиловый простой эфир диэтиленгликоля, метанол, этанол, изопропанол и высокомолекулярные спирты, такие как амиловый спирт, тетрагидрофурфуриловый спирт, гексанол, октанол, этиленгликоль, пропиленгликоль, глицерин, *N*-метил-2-пирролидон и т. п.

Подходящими твердыми носителями являются, например, тальк, диоксид титана, пирофиллитовая глина, диоксид кремния, аттапульгитовая глина, кизельгур, известняк, карбонат кальция, бентонит, кальциевый монтмориллонит, шелуха семян

хлопчатника, пшеничная мука, соевая мука, пемза, древесная мука, измельченная скорлупа грецких орехов, лигнин и подобные вещества.

Большое количество поверхностно-активных веществ можно успешно использовать как в твердых, так и в жидких составах, особенно в тех составах, которые можно разбавлять носителем перед применением. Поверхностно-активные вещества могут быть анионными, катионными, неионогенными или полимерными, и их можно применять в качестве эмульгаторов, смачивающих средств или суспендирующих средств или для других целей. Типичные поверхностно-активные вещества включают, например, соли алкилсульфатов, такие как лаурилсульфат диэтаноламмония; соли алкиларилсульфонатов, такие как додецилбензолсульфонат кальция; продукты присоединения алкилфенола/алкиленоксида, такие как этилоксилат нонилфенола; продукты присоединения спирта/алкиленоксида, такие как этоксилат тридецилового спирта; мыла, такие как стеарат натрия; соли алкилнафталинсульфонатов, такие как дибутилнафталинсульфонат натрия; диалкиловые сложные эфиры сульфосукцинатных солей, такие как ди(2-этилгексил)сульфосукцинат натрия; сложные эфиры сорбита, такие как сорбитолеат; четвертичные амины, такие как хлорид лаурилтриметиламмония, полиэтиленгликолевые сложные эфиры жирных кислот, такие как стеарат полиэтиленгликоля; блок-сополимеры этиленоксида и пропиленоксида и соли моно- и диалкилфосфатных сложных эфиров; а также дополнительные вещества, описанные, например, в McCutcheon's Detergents and Emulsifiers Annual, MC Publishing Corp., Ridgewood New Jersey (1981).

Дополнительные вспомогательные вещества, которые можно использовать в пестицидных составах, включают ингибиторы кристаллизации, модификаторы вязкости, суспендирующие средства, красители, антиоксиданты, вспенивающие средства, поглотители света, вспомогательные средства для смешивания, противовспениватели, комплексообразующие средства, нейтрализующие или pH-модифицирующие вещества и буферы, ингибиторы коррозии, отдушки, смачивающие средства, усилители поглощения, питательные микроэлементы, пластификаторы, вещества, способствующие скольжению, смазывающие вещества, диспергирующие вещества, загустители, антифризы, микробициды, а также жидкие и твердые удобрения.

Композиции в соответствии с настоящим изобретением могут включать добавку, предусматривающую масло растительного или животного происхождения, минеральное масло, алкиловые сложные эфиры таких масел или смеси таких масел и

производных масел. Количество масляной добавки в композиции в соответствии с настоящим изобретением обычно составляет от 0,01 до 10% в пересчете на смесь, подлежащую применению. Например, масляную добавку можно вносить в резервуар опрыскивателя в требуемой концентрации после получения смеси для опрыскивания.

5 Предпочтительные масляные добавки включают минеральные масла или масло растительного происхождения, например, рапсовое масло, оливковое масло или подсолнечное масло, эмульгированное растительное масло, алкиловые сложные эфиры масел растительного происхождения, например метиловые производные, или масло животного происхождения, такое как рыбий жир или говяжий жир. Предпочтительные
10 масляные добавки включают алкиловые сложные эфиры C_8 - C_{22} -жирных кислот, особенно метильные производные C_{12} - C_{18} -жирных кислот, например, метиловые сложные эфиры лауриновой кислоты, пальмитиновой кислоты и олеиновой кислоты (метиллаурат, метилпальмитат и метилолеат соответственно). Многие производные масел известны из Compendium of Herbicide Adjuvants, 10th Edition, Southern Illinois
15 University, 2010.

Гербицидные композиции, как правило, содержат от 0,1 до 99% по весу, в частности от 0,1 до 95% по весу соединений формулы (I) и от 1 до 99,9% по весу вспомогательного средства для составления, которое предпочтительно включает от 0 до 25% по весу поверхностно-активного вещества. Композиции по настоящему
20 изобретению, как правило, содержат от 0,1 до 99% по весу, в частности от 0,1 до 95% по весу соединений по настоящему изобретению и от 1 до 99,9% по весу вспомогательного вещества для составления, которое предпочтительно включает от 0 до 25% по весу поверхностно-активного вещества. Поскольку коммерческие продукты предпочтительно могут быть составлены в виде концентратов, то конечный
25 потребитель обычно будет использовать разбавленные составы.

Нормы применения варьируются в широких пределах и зависят от свойств почвы, способа применения, культурного растения, вредителя, подлежащего контролю, преобладающих климатических условий и других факторов, определяемых способом применения, временем применения и целевой сельскохозяйственной культурой. В
30 качестве общего руководства, соединения можно применять в норме от 1 до 2000 л/га, в частности, от 10 до 1000 л/га.

Предпочтительные составы могут характеризоваться следующими композициями (вес. %).

Эмульгируемые концентраты:

активный ингредиент: 1-95%, предпочтительно 60-90%;
 поверхностно-активное вещество: 1-30%, предпочтительно 5-20%;
 жидкий носитель: 1-80%, предпочтительно 1-35%.

5

Пылевидные препараты:

активный ингредиент: 0,1-10%, предпочтительно 0,1-5%;
 твердый носитель: 99,9-90%, предпочтительно 99,9-99%.

10 Суспензионные концентраты:

активный ингредиент: 5-75%, предпочтительно 10-50%;
 вода: 94-24%, предпочтительно 88-30%;
 поверхностно-активное вещество: 1-40%, предпочтительно 2-30%.

15 Смачиваемые порошки:

активный ингредиент: 0,5-90%, предпочтительно 1-80%;
 поверхностно-активное вещество: 0,5-20%, предпочтительно 1-15%;
 твердый носитель: 5-95%, предпочтительно 15-90%.

20 Гранулы:

активный ингредиент: 0,1-30%, предпочтительно 0,1-15%;
 твердый носитель: 99,5-70%, предпочтительно 97-85%.

25 Композиция по настоящему изобретению может дополнительно содержать по меньшей мере один дополнительный пестицид. Например, соединения в соответствии с настоящим изобретением также можно применять в комбинации с другими гербицидами или регуляторами роста растений. В предпочтительном варианте осуществления дополнительным пестицидом является гербицид и/или антидот гербицида.

30 Таким образом, соединения формулы (I) можно применять в комбинации с одним или несколькими другими гербицидами для обеспечения различных гербицидных смесей. Конкретные примеры таких смесей включают (где "I" представляет собой соединение формулы (I)): I + ацетохлор; I + ацифлуорфен (в том числе ацифлуорфен-натрий); I + аклонифен; I + алахлор; I + аллоксидим; I + аметрин; I

- + амикарбазон; I + амидосульфурон; I + аминокicloпирахлор ; I + аминоклопиралид; I + амитрол; I + асулам; I + атразин; I + бенсульфурон (в том числе бенсульфурон-метил); I + бентазон; I + бициклопирон; I + биланафос; I + бифенокс; I + биспирибак-натрий; I + биксозон; I + бромацил; I + бромоксинил; I + бутахлор; I + бутафенацил; I +
- 5 кафенстрол; I + карфентразон (в том числе карфентразон-этил); I + клорансулам (в том числе клорансулам-метил); I + хлоримурон (в том числе хлоримурон-этил); I + хлоротолурон; I + циносульфурон; I + хлорсульфурон; I + цинметилин; I + клацифос; I + клетодим; I + клодинафоп (в том числе клодинафоп-пропаргил); I + кломазон; I + клопиралид; I + циклопиранил; I + циклопириморат; I + циклосульфамурон; I +
- 10 цигалофоп (в том числе цигалофоп-бутил); I + 2,4-D (в том числе его холиновая соль и сложный 2-этилгексиловый эфир); I + 2,4-DB; I + даимурон; I + десмедифам; I + дикамба (в том числе ее соли с алюминием, аминоклопиралом, бис-аминоклопиралметилом, холином, дихлорпропом, дигликольамином, диметиламином, диметиламмонием, калием и натрием); I + диклофоп-метил; I + диклосулам; I +
- 15 дифлуфеникан; I + дифензокват; I + дифлуфеникан; I + дифлуфензопир; I + диметаклор; I + диметенамид-Р; I + дикват дибромид; I + диурон; I + эспрокарб; I + эталфлуралин; I + этофумезат; I + феноксапроп (в том числе феноксапроп-Р-этил); I + феноксасульфоп; I + фенквинотрион; I + фентразамид; I + флазасульфурон; I + флорасулам; I + флорпирауоксифен; I + флуазифоп (в том числе флуазифоп-Р-бутил); I +
- 20 флукарбазон (в том числе флукарбазон-натрий); I + флуфенацет; I + флуметралин; I + флуметсулам; I + флумиоксазин; I + флупирсульфурон (в том числе флупирсульфурон-метил-натрий); I + флуороксопир (в том числе флуороксопир-метил); I + флутиацет-метил; I + фомесафен; I + форамсульфурон; I + глюфосинат (в том числе его аммониевая соль); I + глифосат (в том числе его диаммониевые, изопропиламмониевые
- 25 и калиевые соли); I + галауоксифен (в том числе галауоксифен-метил); I + галосульфурон-метил; I + галоксифоп (в том числе галоксифоп-метил); I + гексазинон; I + гидантоцидин; I + имазамокс; I + имазапик; I + имазапир; I + имазаквин; I + имазетапир; I + индазифлам; I + йодосульфурон (в том числе йодосульфурон-метил-натрий); I + иофенсульфурон; I + иофенсульфурон-натрий; I + иоксинил; I +
- 30 изопротурон; I + ипфенкарбазон; I + изоксабен; I + изоксафлютол; I + лактофен; I + ланкотрион; I + линурон; I + МСРА; I + МСРВ; I + мекопроп-Р; I + мефенацет; I + мезосульфурон; I + мезосульфурон-метил; I + мезотрион; I + метамитрон; I + метазахлор; I + метиозолин; I + метобромурон; I + метолахлор; I + метосулам; I + метоксурон; I + метрибузин; I + метсульфурон; I + молинат; I + напропамид; I +

никосульфурон; I + норфлуразон; I + ортосульфамурон; I + оксадиаргил; I + оксадиазон; I + оксасульфурон; I + оксифлуорфен; I + паракват дихлорид; I + пендиметалин; I + пеноксулам; I + фенмедифам; I + пихлорам; I + пиколинафен; I + пиноксаден; I + претилахлор; I + примисульфурон-метил; I + продиамин; I + прометрин; I + пропахлор; I + пропанил; I + пропаквизафоп; I + профам; I + пропирисульфурон; I + пропизамид; I + просульфокарб; I + просульфурон; I + пираклонил; I + пирафлуфен (в том числе пирафлуфен-этил); I + пирасульфотол; I + пиразолинат; I + пиразосульфурон-этил; I + пирибензоксим; I + пиридат; I + пирифталид; I + пиримисульфам; I + пиритиобак-натрий; I + пироксасульфам; I + пироксулам; I + квинклорак; I + квинмерак; I + квизалофоп (в том числе квизалофоп-Р-этил и квизалофоп-Р-тефурил); I + римсульфурон; I + сафлуфенацил; I + сетоксидим; I + симазин; I + S-метолахлор; I + сулькотрион; I + сульфентразон; I + сульфосульфурон; I + тебутиурон; I + тефурилтрион; I + темботрион; I + тербутилазин; I + тербутрин; I + тиенкарбазон; I + тифенсульфурон; I + тиафенацил; I + толпиралат; I + топрамезон; I + тралкоксидим; I + триафамон; I + триаллат; I + триасульфурон; I + трибенурон (в том числе трибенурон-метил); I + триклопир; I + трифлорисульфурон (в том числе трифлорисульфурон-натрий); I + трифлудимоксазин; I + трифлуралин; I + трифлусульфурон; I + тритосульфурон; I + 4-гидрокси-1-метокси-5-метил-3-[4-(трифторметил)-2-пиридил]имидазолидин-2-он; I + 4-гидрокси-1,5-диметил-3-[4-(трифторметил)-2-пиридил]имидазолидин-2-он; I + 5-этоксид-4-гидрокси-1-метил-3-[4-(трифторметил)-2-пиридил]имидазолидин-2-он; I + 4-гидрокси-1-метил-3-[4-(трифторметил)-2-пиридил]имидазолидин-2-он; I + 4-гидрокси-1,5-диметил-3-[1-метил-5-(трифторметил)пиразол-3-ил]имидазолидин-2-он; I + (4R)-1-(5-трет-бутилизоксазол-3-ил)-4-этоксид-5-гидрокси-3-метилимидазолидин-2-он; I + 3-[2-(3,4-диметоксифенил)-6-метил-3-оксопиридазин-4-карбонил]бицикло[3.2.1]октан-2,4-дион; I + 2-[2-(3,4-диметоксифенил)-6-метил-3-оксопиридазин-4-карбонил]-5-метилциклогексан-1,3-дион; I + 2-[2-(3,4-диметоксифенил)-6-метил-3-оксопиридазин-4-карбонил]циклогексан-1,3-дион; I + 2-[2-(3,4-диметоксифенил)-6-метил-3-оксопиридазин-4-карбонил]-5,5-диметилциклогексан-1,3-дион; I + 6-[2-(3,4-диметоксифенил)-6-метил-3-оксопиридазин-4-карбонил]-2,2,4,4-тетраметилциклогексан-1,3,5-трион; I + 2-[2-(3,4-диметоксифенил)-6-метил-3-оксопиридазин-4-карбонил]-5-этилциклогексан-1,3-дион; I + 2-[2-(3,4-диметоксифенил)-6-метил-3-оксопиридазин-4-карбонил]-4,4,6,6-тетраметилциклогексан-1,3-дион; I + 2-[6-циклопропил-2-(3,4-диметоксифенил)-3-оксопиридазин-4-карбонил]-5-метилциклогексан-1,3-дион; I + 3-[6-циклопропил-2-(3,4-

диметоксифенил)-3-оксопиридазин-4-карбонил]бицикло[3.2.1]октан-2,4-дион; I + 2-[6-циклопропил-2-(3,4-диметоксифенил)-3-оксопиридазин-4-карбонил]-5,5-диметилциклогексан-1,3-дион; I + 6-[6-циклопропил-2-(3,4-диметоксифенил)-3-оксопиридазин-4-карбонил]-2,2,4,4-тетраметилциклогексан-1,3,5-трион; I + 2-[6-циклопропил-2-(3,4-диметоксифенил)-3-оксопиридазин-4-карбонил]циклогексан-1,3-дион; I + 4-[2-(3,4-диметоксифенил)-6-метил-3-оксопиридазин-4-карбонил]-2,2,6,6-тетраметилтетрагидропиран-3,5-дион и I + 4-[6-циклопропил-2-(3,4-диметоксифенил)-3-оксопиридазин-4-карбонил]-2,2,6,6-тетраметилтетрагидропиран-3,5-дион.

Особенно предпочтительные примеры таких смесей включают: I + аметрин; I + атразин; I + бициклопирон; I + бутафенацил; I + хлоротолурон; I + клодинафоп-пропаргил; I + кломазон; I + 2,4-D (в том числе его холиновая соль и сложный 2-этилгексиловый эфир); I + дикамба (в том числе ее соли с алюминием, аминопропилом, бис-аминопропилметилом, холином, дигликольамином, диметиламином, диметиламмонием, калием и натрием); I + диметаклор; I + дикват дибромид; I + флуазифоп-Р-бутил; I + флуметралин; I + фомесафен; I + глюфосинат-аммоний; I + глифосат (в том числе его диаммониевые, изопропиламмониевые и калиевые соли); I + мезотрион; I + молинат; I + напропамид; I + никосульфурон; I + паракват дихлорид; I + пиноксаден; I + претилахлор; I + примисульфурон-метил; I + прометрин; I + просульфокарб; I + просульфурон; I + пиридат; I + пирифталид; I + пиразолинат, I + S-метолахлор; I + тербутилазин; I + тербутрин; I + тралкоксидим; I + триасульфурон и I + трифлорисульфурон-натрий.

Предпочтительные продукты в виде гербицидной смеси для контроля сорняков в злаковых (в частности, пшенице и/или ячмене) включают: I + амидосульфурон; I + аминопиралид; I + бромоксинил; I + карфентразон-этил; I + хлоротолурон; I + клодинафоп-пропаргил; I + клопиралид; I + 2,4-D (в том числе его холиновая соль и сложный 2-этилгексиловый эфир); I + дикамба (в том числе ее соли с алюминием, аминопропилом, бис-аминопропилметилом, холином, дигликольамином, диметиламином, диметиламмонием калием и натрием); I + дифензокват; I + дифлуфеникан; I + феноксапроп-Р-этил; I + флорасулам; I + флукарбазон-натрий; I + флуфенацет; I + флупирсульфурон-метил-натрий; I + флуороксибир-мептил; I + галауксифен-метил; I + йодосульфурон-метил-натрий; I + иофенсульфурон; I + иофенсульфурон-натрий; I + мезосульфурон; I + мезосульфурон-метил; I + метсульфурон; I + пендиметалин; I + пиноксаден; I + просульфокарб; I +

пирасульфотол; I + пироксасульфон; I + пироксулам; I + топрамезон; I + тралкоксидим; I + триасульфурон и I + трибенурон-метил.

Предпочтительные продукты в виде гербицидной смеси для контроля сорняков в кукурузе включают: I + ацетохлор; I + алахлор; I + атразин; I + бициклопирон; I + 2,4-D (в том числе его холиновая соль и сложный 2-этилгексильный эфир); I + дикамба (в том числе ее соли с алюминием, аминопропилом, бис-аминопропилметилом, холином, дигликольамином, диметиламином, диметиламмонием калием и натрием); I + дифлуфензопир; I + диметенамид-Р; I + флумиоксазин; I + флутиацет-метил; I + форамсульфурон; I + глюфосинат (в том числе его аммониевая соль); I + глифосат (в том числе его диаммониевые, изопропиламмониевые и калиевые соли); I + изоксафлютол; I + мезотрион; I + никосульфурон; I + примисульфурон-метил; I + просульфурон; I + пироксасульфон; I + римсульфурон; I + S-метолахлор, I + тербутилазин; I + темботрион; I + тиенкарбазон и I + тифенсульфурон.

Предпочтительные продукты в виде гербицидной смеси для контроля сорняков в рисе включают: I + 2,4-D; I + холиновая соль 2,4-D; I + сложный 2-этилгексильный эфир 2,4-D; I + бенсульфурон-метил; I + биспирибак-натрий; I + кафенстрол; I + циносульфурон; I + кломазон; I + цигалофоп-бутил; I + даимурон; I + дикамба (в том числе ее соли с алюминием, аминопропилом, бис-аминопропилметилом, холином, дигликольамином, диметиламином, диметиламмонием калием и натрием); I + эспрокарб; I + феноксапроп-Р-этил; I + флорасулам; I + галауксифен-метил; I + галосульфурон-метил; I + иофенсульфурон; I + ипфенкарбазон; I + мефенацет; I + мезотрион; I + метсульфурон; I + молинат; I + ортосульфамурон; I + оксадиаргил; I + оксадиазон; I + пендиметалин; I + пеноксулам; I + претилахлор; I + пиразолинат, I + пиразосульфурон-этил; I + пирибензоксим; I + пирифталид; I + квинклорак; I + тефурилтрион; I + триафамон и I + триасульфурон.

Предпочтительные гербицидные смеси для контроля сорняков в сое включают: I + ацифлуорфен-натрий; I + аметрин; I + атразин; I + бентазон; I + бициклопирон; I + бромоксинил; I + карфентразон-этил; I + хлоримурон-этил; I + клетодим; I + кломазон; I + 2,4-D (в том числе его холиновая соль и сложный 2-этилгексильный эфир); I + дикамба (в том числе ее соли с алюминием, аминопропилом, бис-аминопропилметилом, холином, дигликольамином, диметиламином, диметиламмонием калием и натрием); I + дикват дибромид; I + диурон; I + феноксапроп-Р-этил; I + флуазифоп-Р-бутил; I + флуфенацет; I + флумиоксазин; I + фомесафен; I + глюфосинат (в том числе его аммониевая соль); I + глифосат (в том числе его диаммониевые,

изопропиламмониевые и калиевые соли); I + имазетапир; I + лактофен; I + мезотрион; I + метолахлор; I + метрибузин; I + никосульфурон; I + оксифлуорфен; I + паракват дихлорид; I + пендиметалин; I + пироксасульфен; I + квизалофоп-Р-этил; I + сафлуфенацил; I + сетоксидим; I + S-метолахлор и I + сульфентразон.

5 Компоненты, смешиваемые с соединением формулы (I), также могут находиться в форме сложных эфиров или солей, как упоминается, например, в The Pesticide Manual, Fourteenth Edition, British Crop Protection Council, 2006.

Соединение формулы (I) также можно применять в смесях с другими агрохимическими средствами, такими как фунгициды, нематоды или инсектициды, 10 примеры которых приведены в The Pesticide Manual.

Соотношение в смеси соединения формулы (I) и смешиваемого компонента предпочтительно составляет от 1: 100 до 1000:1.

Смеси преимущественно можно применять в упомянутых выше составах (в этом случае выражение "активный ингредиент" относится к соответствующей смеси 15 соединения формулы (I) со смешиваемым компонентом).

Соединения формулы (I) по настоящему изобретению могут также быть объединены с антидотами гербицидов. Предпочтительные комбинации (где "I" представляет собой соединение формулы (I)) включают: I + беноксакор, I + 20 клоквинтосет (в том числе клоквинтосет-мексил); I + ципросульфамид; I + дихлормид; I + фенхлоразол (в том числе фенхлоразол-этил); I + фенклорим; I + флуксофенил; I + фурилазол; I + изоксацифен (в том числе изоксацифен-этил); I + мефенпир (в том числе мефенпир-диэтил); I + меткамифен; I + N-(2-метоксибензоил)-4- [(метиламинокарбонил)амино]бензолсульфонамид и I + оксабетринил.

В частности, предпочтительными являются смеси соединения формулы (I) с 25 ципросульфамидом, изоксацифеном (в том числе изоксацифен-этилом), клоквинтосетом (в том числе клоквинтосет-мексилом) и/или N-(2-метоксибензоил)-4- [(метиламинокарбонил)амино]бензолсульфонамидом.

Антидоты для соединения формулы (I) также могут находиться в форме сложных эфиров или солей, как упоминается, например, в The Pesticide Manual, 14th 30 Edition (BCPC), 2006. Ссылка на клоквинтосет-мексил также относится к его соли с литием, натрием, калием, кальцием, магнием, алюминием, железом, аммонием, четвертичным аммонием, сульфониом или фосфониом, как раскрыто в WO 02/34048, а ссылка на фенхлоразол-этил также относится к фенхлоразолу и т. д.

Предпочтительно соотношение в смеси соединения формулы (I) и антидота составляет от 100:1 до 1:10, в частности от 20:1 до 1:1.

Смеси преимущественно можно применять в вышеупомянутых составах (в случае чего выражение "активный ингредиент" относится к соответствующей смеси соединения формулы (I) с антидотом).

Соединения формулы (I) по настоящему изобретению являются пригодными в качестве гербицидов. Следовательно, в настоящем изобретении дополнительно предусмотрен способ контроля нежелательных растений, включающий применение в отношении указанных растений или места произрастания, содержащего их, эффективного количества соединения по настоящему изобретению или гербицидной композиции, содержащей указанное соединение. "Контроль" означает уничтожение, снижение или замедление роста или предупреждение или снижение прорастания. Обычно растениями, подлежащими контролю, являются нежелательные растения (сорняки). "Место произрастания" означает территорию, на которой растения произрастают или будут произрастать.

Нормы применения соединений формулы (I) могут изменяться в широких пределах и зависят от свойств почвы, способа применения (до появления всходов; после появления всходов; применение по отношению к борозде для семян; применение при беспашотной обработке и т. д.), культурного растения, сорняка(сорняков), подлежащего(подлежащих) контролю, преобладающих климатических условий и других факторов, определяемых способом применения, временем применения и целевой сельскохозяйственной культурой. Соединения формулы (I) в соответствии с настоящим изобретением, как правило, применяют при норме от 10 до 2000 г/га, в частности от 50 до 1000 г/га.

Применение обычно осуществляют посредством распыления композиции, как правило, с помощью установленного на тракторе опрыскивателя для больших площадей, но также можно применять и другие способы, такие как опыление (для порошков), капельный полив или орошение.

Полезные растения, по отношению к которым можно применять композицию в соответствии с настоящим изобретением, включают сельскохозяйственные культуры, такие как зерновые, например, ячмень и пшеница, хлопчатник, масличный рапс, подсолнечник, маис, рис, соя, сахарная свекла, сахарный тростник и дерновой покров.

Культурные растения могут также включать деревья, такие как плодовые деревья, пальмовые деревья, кокосовые пальмы или другие орехоплодные культуры.

Также включены вьющиеся растения, такие как виноград, плодовые кустарники, плодовые растения и овощные культуры.

Следует понимать, что сельскохозяйственные культуры также включают те сельскохозяйственные культуры, которым придали выносливость к гербицидам или классам гербицидов (например, ALS-, GS-, EPSPS-, PPO-, ACCаза- и HPPD-ингибиторы) с помощью традиционных способов селекции или с помощью генетической инженерии. Примером сельскохозяйственной культуры, которой придали выносливость к имидазолинонам, например, имазамоксу, с помощью традиционных способов селекции, является сурепица (канола) Clearfield®. Примеры сельскохозяйственных культур, которым придали выносливость к гербицидам с помощью способов генной инженерии, включают, например, устойчивые к глифосату и глюфосинату сорта маиса, коммерчески доступные под товарными знаками RoundupReady® и LibertyLink®.

Под сельскохозяйственными культурами также следует понимать те, которым с помощью способов генетической инженерии была придана устойчивость к вредным насекомым, например, Bt-маис (устойчивый к мотыльку кукурузному), Bt-хлопчатник (устойчивый к долгоносику хлопковому), а также разновидности Bt-картофеля (устойчивые к колорадскому жуку). Примерами Bt-маиса являются гибриды маиса Bt 176 NK® (Syngenta Seeds). Токсин Bt представляет собой белок, который в природе образуют почвенные бактерии *Bacillus thuringiensis*. Примеры токсинов или трансгенных растений, способных синтезировать такие токсины, описаны в EP-A-451878, EP-A-374753, WO 93/07278, WO 95/34656, WO 03/052073 и EP-A-427529. Примерами трансгенных растений, содержащих один или несколько генов, кодирующих устойчивость к насекомым, и экспрессирующих один или несколько токсинов, являются KnockOut® (маис), Yield Gard® (маис), NuCOTIN33B® (хлопчатник), Bollgard® (хлопчатник), NewLeaf® (разновидности картофеля), NatureGard® и Protexcta®. Растительные культуры или их семенной материал могут быть устойчивыми к гербицидам и в то же время устойчивыми к поеданию насекомыми (трансгенные объекты с "пакетированными" генами). Например, семя может обладать способностью экспрессировать инсектицидный белок Cry3, в то же время будучи выносливым к глифосату.

Также следует понимать, что сельскохозяйственные культуры включают те, которые получены традиционными способами селекции или генетической инженерии и

обладают так называемыми привнесенными признаками (например, улучшенной стабильностью при хранении, более высокой питательной ценностью и улучшенным вкусом).

Другие полезные растения включают газонную траву, например, на гольф-площадках, лужайках, в парках и на обочинах дороги или коммерчески выращиваемую для газона, и декоративные растения, такие как цветы или кустарники.

Соединения формулы (I) и композиции по настоящему изобретению, как правило, можно применять для контроля большого разнообразия однодольных и двудольных видов сорняков. Примеры однодольных видов, которые обычно можно контролировать, включают *Alopecurus myosuroides*, *Avena fatua*, *Brachiaria plantaginea*, *Bromus tectorum*, *Cyperus esculentus*, *Digitaria sanguinalis*, *Echinochloa crus-galli*, *Lolium perenne*, *Lolium multiflorum*, *Panicum miliaceum*, *Poa annua*, *Setaria viridis*, *Setaria faberi* и *Sorghum bicolor*. Примеры двудольных видов, которые можно контролировать, включают *Abutilon theophrasti*, *Amaranthus retroflexus*, *Bidens pilosa*, *Chenopodium album*, *Euphorbia heterophylla*, *Galium aparine*, *Ipomoea hederacea*, *Kochia scoparia*, *Polygonum convolvulus*, *Sida spinosa*, *Sinapis arvensis*, *Solanum nigrum*, *Stellaria media*, *Veronica persica* и *Xanthium strumarium*.

Соединения формулы (I) также пригодны для проводимого перед сбором урожая обезвоживанием в сельскохозяйственных культурах, например, без ограничения в картофеле, сое, сортах подсолнечника и хлопчатнике. Проводимое перед сбором урожая обезвоживание является хорошо известным способом, применяемым для высушивания листы сельскохозяйственной культуры без значительного повреждения самой сельскохозяйственной культуры, для облегчения сбора урожая. Соединения/композиции по настоящему изобретению, в частности, являются пригодными в неселективных контактных вариантах применения со "сплошным действием" и, как таковые, также могут применяться для контроля самосева или культурных "растений-беглецов".

Различные аспекты и варианты осуществления настоящего изобретения далее будут более подробно проиллюстрированы с помощью примера. Следует понимать, что можно осуществлять модификацию некоторых подробностей без отступления от объема настоящего изобретения.

ПРИМЕРЫ

Следующие примеры служат для иллюстрации, но не для ограничения настоящего изобретения.

Примеры составов

Смачиваемые порошки	a)	b)	c)
Активные ингредиенты	25 %	50 %	75 %
Лигносульфат натрия	5 %	5 %	-
Лаурилсульфат натрия	3 %	-	5 %
Диизобутилнафталинсульфонат натрия	-	6 %	10 %
Феноловый эфир полиэтиленгликоля (7-8 моль этиленоксида)	-	2 %	-
Высокодисперсная кремниевая кислота	5 %	10 %	10 %
Каолин	62 %	27 %	-

- 5 Комбинацию тщательно смешивают со вспомогательными веществами и смесь тщательно измельчают в подходящей мельнице с получением смачиваемых порошков, которые можно разбавлять водой с получением суспензии с необходимой концентрацией.

Эмульгируемый концентрат

Активные ингредиенты	10 %
Октилфеноловый эфир полиэтиленгликоля (4-5 моль этиленоксида)	3 %
Додecilбензолсульфонат кальция	3 %
Полигликолевый эфир касторового масла (35 моль этиленоксида)	4 %
Циклогексанон	30 %
Смесь ксилолов	50 %

- 10 Из этого концентрата путем разбавления водой можно получить эмульсии любого необходимого разбавления, которые можно применять для защиты растений.

Пылевидные препараты	a)	b)	c)
Активные ингредиенты	5 %	6 %	4 %
Тальк	95 %	-	-

Каолин	-	94 %	-
Минеральный наполнитель	-	-	96 %

Готовые к применению пылевидные препараты получают путем смешивания комбинации с носителем и измельчения смеси в подходящей мельнице.

Экструдированные гранулы

Активные ингредиенты	15 %
Лигносульфат натрия	2 %
Карбоксиметилцеллюлоза	1 %
Каолин	82 %

5 Комбинацию смешивают и измельчают со вспомогательными веществами и смесь увлажняют водой. Смесь экструдировать и затем высушивают в потоке воздуха.

Покрываемые оболочкой гранулы

Активные ингредиенты	8 %
Полиэтиленгликоль (молекулярная масса 200)	3 %
Каолин	89 %

Тонкоизмельченную комбинацию в перемешивающем устройстве равномерно наносят на увлажненный полиэтиленгликолем каолин. Таким способом получают непылевидные покрываемые оболочкой гранулы.

10

Суспензионный концентрат

Активные ингредиенты	40 %
Пропиленгликоль	10 %
Полиэтиленгликолевый эфир нонилфенола (15 моль этиленоксида)	6 %
Лигносульфат натрия	10 %
Карбоксиметилцеллюлоза	1 %
Силиконовое масло (в виде 75% эмульсии в воде)	1 %
Вода	32 %

Тонкоизмельченную комбинацию тщательно смешивают со вспомогательными веществами с получением суспензионного концентрата, из которого путем разбавления водой можно получать суспензии любого требуемого разбавления.

Капсульная суспензия медленного высвобождения

Смешивают 28 частей комбинации с 2 частями ароматического растворителя и 7 частями смеси толуолдиизоцианат/полиметилениполифенил-изоцианат (8:1). Эту смесь эмульгируют в смеси 1,2 части поливинилового спирта, 0,05 части пеногасителя и 51,6 части воды до получения частиц необходимого размера. К этой эмульсии добавляют смесь 2,8 части 1,6-диаминогексана в 5,3 части воды. Смесь перемешивают до завершения реакции полимеризации.

Полученную капсульную суспензию стабилизируют путем добавления 0,25 части загустителя и 3 частей диспергирующего средства. Состав капсульной суспензии содержит 28% активных ингредиентов. Средний диаметр капсул составляет 8-15 микрон.

Полученный состав применяют в виде водной суспензии в отношении семян в устройстве, подходящем для этой цели.

Перечень сокращений

Boc = *трет*-бутилоксикарбонил

br = широкий

CDCl₃ = хлороформ-d

CD₃OD = метанол-d

°C = градусы Цельсия

D₂O = вода-d

DCM = дихлорметан

d = дублет

dd = дублет дублетов

dt = дублет триплетов

DMSO = диметилсульфоксид

EtOAc = этилацетат

ч. = час(часы)

HCl = хлористоводородная кислота

HPLC = высокоэффективная жидкостная хроматография (описание устройства и способов, применяемых для HPLC, приведены ниже)

m = мультиплет

М = молярность

мин. = минуты

МГц = мегагерц

мл = миллилитр

5 т. пл. = точка плавления

ppm = частей на миллион

q = квартет

quin = квинтет

к. т. = комнатная температура

10 s = синглет

t = триплет

THF = тетрагидрофуран

LC/MS = жидкостная хроматография с масс-спектрометрией (описание устройства и способов, применяемых для LC/MS-анализа, приведены ниже)

15

Способ препаративной HPLC с обращенной фазой

Соединения очищали с помощью массонаправленной препаративной HPLC с применением ES+/ES- на системе Waters FractionLynx Autopurification, содержащей дозатор/сборник 2767 с градиентным насосом 2545, двумя изократическими насосами 20 515, SFO, фотодиодную матрицу 2998 (диапазон длин волн (нм): 210-400), ELSD 2424 и масс-спектрометр QDa. Применяли защитную колонку Waters Atlantis T3, 5 микрон, 19 x 10 мм, с препаративной колонкой Waters Atlantis T3 OBD, 5 микрон, 30 x 100 мм.

Способ ионизации: положительное и отрицательное электрораспыление: напряжение на конусе (В) 20,00, температура источника (°C) 120, скорость потока газа в конусе (л/ч.) 50

25

Диапазон масс (Да): положительный 100-800, отрицательный 115-800.

Препаративную HPLC проводили с применением времени хроматографирования 11,4 минуты (без применения разбавления в колонке, с обходом селектором колонки) в соответствии со следующей таблицей градиентов.

30

Время (минуты)	Растворитель А (%)	Растворитель В (%)	Скорость потока (мл/мин.)
0,00	100	0	35
2,00	100	0	35

Время (минуты)	Растворитель А (%)	Растворитель В (%)	Скорость потока (мл/мин.)
2,01	100	0	35
7,0	90	10	35
7,3	0	100	35
9,2	0	100	35
9,8	99	1	35
11,35	99	1	35
11,40	99	1	35

насос 515, 0 мл/мин., ацетонитрил (ACD)

насос 515, 1 мл/мин., 90% метанола/10% воды, (подкачивающий насос)

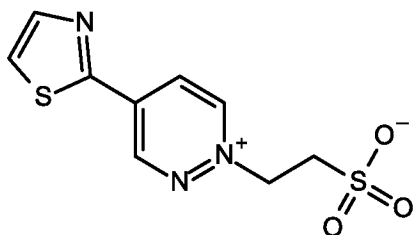
Растворитель А: вода с 0,05% трифторуксусной кислотой

Растворитель В: ацетонитрил с 0,05% трифторуксусной кислотой

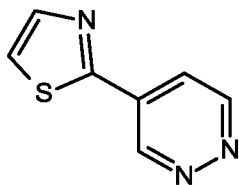
5

Примеры получения

Пример 1. Получение 2-(4-тиазол-2-илпиридазин-1-ий-1-ил)этансульфоната А-1



Стадия 1. Получение 2-пиридазин-4-илтиазола



10

К смеси 2-бромтиазола (68 мг) и 4-(4,4,5,5-тетраметил-1,3,2-диоксаборолан-2-ил)пиридазина (86 мг) в *N,N*-диметилформамиде (1 мл) добавляли 2 М водный раствор карбоната натрия (0,4 мл) с последующими дегазированием и продуванием азотом в течение десяти минут. Добавляли хлор(кротил)(трициклогексилфосфин)палладий(II) (40 мг) и реакционную смесь снова дегазировали. Данную смесь нагревали при 100°C под действием микроволнового излучения в течение 30 минут. После охлаждения до комнатной температуры реакционную смесь концентрировали и очищали посредством препаративной HPLC с обращенной фазой с получением 2-пиридазин-4-илтиазола в виде твердого вещества кремового цвета.

15

^1H ЯМР (400МГц, CDCl_3) 9,75 (dd, 1H) 9,31 (dd, 1H) 8,06 (d, 1H) 7,96 (dd, 1H) 7,60 (d, 1H)

Стадия 2. Получение 2-(4-тиазол-2-илпиридазин-1-ий-1-ил)этансульфоната А-1

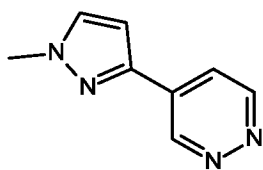
5

Смесь 2-пиридазин-4-илтиазола (40 мг) и 2-бромэтансульфоната натрия (58 мг) нагревали в воде (1 мл) при 100°C в течение 44 часов. Реакционную смесь охлаждали и промывали дихлорметаном. Водную фазу концентрировали и очищали посредством препаративной HPLC с обращенной фазой с получением 2-(4-тиазол-2-илпиридазин-1-ий-1-ил)этансульфоната в виде белого твердого вещества.

10

^1H ЯМР (400МГц, D_2O) 9,84-9,94 (m, 1H) 9,63-9,72 (m, 1H) 8,82 (dd, 1H) 8,14-8,25 (m, 1H) 8,08 (d, 1H) 5,09-5,19 (m, 2H) 3,54-3,68 (m, 2H)

Пример 2. Получение 4-(1-метилпиразол-3-ил)пиридазина



15

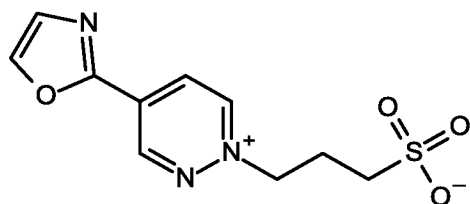
К смеси 3-бром-1-метилпиразола (156 мг) и 4-(4,4,5,5-тетраметил-1,3,2-диоксаборолан-2-ил)пиридазина (200 мг) в 1,4-диоксане (2 мл) добавляли фосфат калия (0,5 г) и воду (0,4 мл) с последующими дегазированием и продуванием азотом в течение 10 минут. Добавляли хлор(кротил)(трициклогексилфосфин)палладий(II) (28 мг) и реакционную смесь снова дегазировали. Данную смесь нагревали при 110°C под действием микроволнового излучения в течение 30 минут. После охлаждения до комнатной температуры реакционную смесь концентрировали и очищали посредством препаративной HPLC с обращенной фазой с получением 4-(1-метилпиразол-3-ил)пиридазина в виде белого твердого вещества.

20

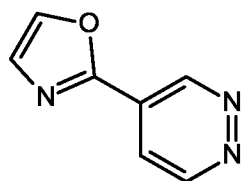
^1H ЯМР (400МГц, CD_3OD) 9,77 (dd, 1H) 9,33 (dd, 1H) 8,41 (dd, 1H) 7,80 (d, 1H) 7,10 (d, 1H) 4,04 (s, 3H)

25

Пример 3. Получение 3-(4-оксазол-2-илпиридазин-1-ий-1-ил)пропан-1-сульфоната А-3



Стадия 1. Получение 2-пиридазин-4-илоксазола



5

К смеси трибутил(оксазол-2-ил)станнана (1 г), 4-бромпиридазина (0,4 г), тетракис(трифенилфосфин)палладия(0) (0,291 г), фторида цезия (0,382 г) и иодида меди(I) (0,019 г) добавляли 1,4-диоксан (10 мл). Данную смесь нагревали при 140°C под действием микроволнового излучения в течение 60 минут. Реакционную смесь концентрировали и очищали посредством препаративной HPLC с обращенной фазой с получением 2-пиридазин-4-илоксазола в виде бежевого твердого вещества.

10

¹H ЯМР (400МГц, D₂O) 9,59 (dd, 1H) 9,24 (dd, 1H) 8,15 (dd, 1H) 8,03 (d, 1H) 7,37 (d, 1H)

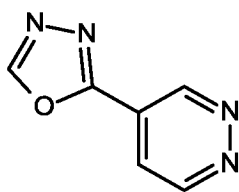
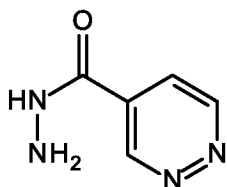
Стадия 2. Получение 3-(4-оксазол-2-илпиридазин-1-ий-1-ил)пропан-1-сульфоната А-3

15

К смеси 2-пиридазин-4-илоксазола (30 мг) в 1,4-диоксане (1 мл) добавляли 1,3-пропансультон (30 мг). Смесь нагревали при 90°C в течение 44 часов. Полученный осадок отфильтровывали, промывали ацетоном и очищали посредством препаративной HPLC с обращенной фазой с получением 3-(4-оксазол-2-илпиридазин-1-ий-1-ил)пропан-1-сульфоната в виде белого твердого вещества.

20

¹H ЯМР (400МГц, D₂O) 9,83-9,95 (m, 1H) 9,73 (d, 1H) 8,86 (dd, 1H) 8,08-8,31 (m, 1H) 7,49-7,71 (m, 1H) 4,85-5,08 (m, 2H) 2,85-3,16 (m, 2H) 2,50 (quin, 2H)

Пример 4. Получение 2-пиридазин-4-ил-1,3,4-оксадиазола**Стадия 1. Получение пиридазин-4-карбогидразида**

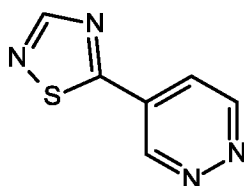
- 5 К раствору метилпиридазин-4-карбоксилата (0,4 г) в метаноле (4,92 мл) добавляли гидрат гидразина (1,16 г) и смесь нагревали с обратным холодильником в течение ночи. Реакционную смесь охлаждали и концентрировали с получением пиридазин-4-карбогидразида в виде коричневого твердого вещества.
- ¹H ЯМР (400МГц, CD₃OD) 9,52-9,48 (m, 1H) 9,36 (dd, 1H) 8,00 (dd, 1H) (три протона NH
- 10 отсутствуют)

Стадия 2. Получение 2-пиридазин-4-ил-1,3,4-оксадиазола

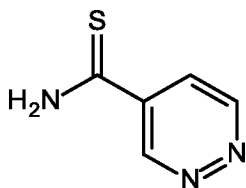
- 15 Смесь пиридазин-4-карбогидразида (0,370 г) и триметоксиметана (7,8 г) нагревали с обратным холодильником в течение ночи. Реакционную смесь охлаждали, концентрировали и очищали посредством хроматографии на силикагеле с элюированием с помощью 0-50% ацетонитрила в дихлорметане с получением 2-пиридазин-4-ил-1,3,4-оксадиазола в виде желтого твердого вещества.

¹H ЯМР (400МГц, CDCl₃) 9,87-9,84 (dd, 1H) 9,50-9,46 (dd, 1H) 8,66 (s, 1H) 8,10 (dd, 1H)

20

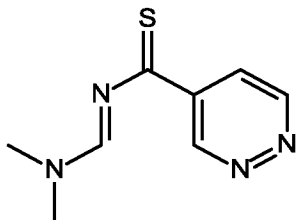
Пример 5. Получение 5-пиридазин-4-ил-1,2,4-тиадиазола

Стадия 1. Получение пиридазин-4-карботиоамида



К раствору пиридазин-4-карбонитрила (0,5 г) в метанольном растворе аммиака (2 М
 5 раствор, 5 мл) добавляли пентасульфид фосфора (1,06 г) с поддержанием температуры
 реакции на уровне ниже 35°C. После перемешивания при комнатной температуре в
 течение ночи добавляли воду. Реакционную смесь охлаждали и полученный осадок
 удаляли посредством фильтрации. Водную фазу промывали дихлорметаном и
 органическую фазу отбрасывали. Обеспечивали отстаивание водной фазы при
 10 комнатной температуре в течение нескольких дней и полученное твердое вещество
 снова удаляли посредством фильтрации. Было показано, что объединенные твердые
 вещества представляют собой необходимое соединение пиридазин-4-карботиоамид.
¹H ЯМР (400МГц, CD₃OD) 9,53 (dd, 1H) 9,26 (dd, 1H) 7,94 (dd, 1H) (два протона NH
 отсутствуют)

15

Стадия 2. Получение *N,N*-(диметиламинометил)пиридазин-4-карботиоамида

Пиридазин-4-карботиоамид (1,46 г) и 1,1-диметокси-*N,N*-диметилметанамин (1,4 мл)
 перемешивали вместе при комнатной температуре в течение 6 часов. Реакционную
 20 смесь концентрировали и очищали посредством хроматографии на силикагеле с
 элюированием с помощью 0-50% метанола в ацетонитриле с получением *N,N*-
 (диметиламинометил)пиридазин-4-карботиоамида в виде темно-красного твердого
 вещества.

¹H ЯМР (400МГц, CDCl₃) 9,94 (dd, 1H) 9,27 (dd, 1H) 8,81 (s, 1H) 8,27 (dd, 1H) 3,38-3,32
 25 (m, 6H)

Стадия 3. Получение 5-пиридазин-4-ил-1,2,4-тиадиазола

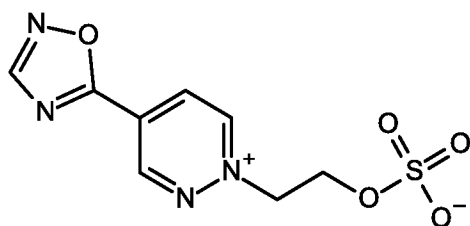
К смеси *N,N*-(диметиламинометил)пиридазин-4-карботиоамида (1 г), пиридина (0,83 мл) и этанола (25 мл) при комнатной температуре добавляли раствор

5 гидроксилламин-О-сульфоновой кислоты (640 мг) в метаноле (10 мл). Через 2 часа реакцию смесь разделяли между дихлорметаном и насыщенным водным раствором бикарбоната натрия. Органическую фазу концентрировали и полученное

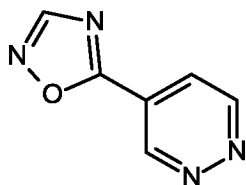
10 твердое вещество растирали с метанолом с получением 5-пиридазин-4-ил-1,2,4-тиадиазола в виде бежевого твердого вещества.

¹H ЯМР (400МГц, CDCl₃) 9,75 (dd, 1H) 9,45 (dd, 1H) 8,90 (s, 1H) 8,00 (dd, 1H)

Пример 6. Получение 2-[4-(1,2,4-оксадиазол-5-ил)пиридазин-1-ий-1-ил]этилсульфата А-8



15 Стадия 1. Получение 5-пиридазин-4-ил-1,2,4-оксадиазола



К смеси *N,N*-(диметиламинометил)пиридазин-4-карботиоамида (0,2 г), пиридина (0,17 мл) и этанола (4 мл) при комнатной температуре добавляли раствор содержащей

20 воду гидроксилламин-О-сульфоновой кислоты (128 мг) в метаноле (1,6 мл). После перемешивания в течение ночи при комнатной температуре смесь концентрировали и разделяли между дихлорметаном и насыщенным водным раствором бикарбоната натрия. Органический слой концентрировали с получением 5-пиридазин-4-ил-1,2,4-оксадиазола.

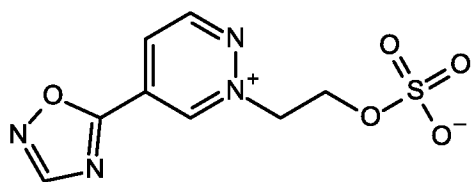
¹H ЯМР (400МГц, CDCl₃) 9,90 (dd, 1H) 9,52 (dd, 1H) 8,67 (s, 1H) 8,15 (dd, 1H)

Стадия 2. Получение 2-[4-(1,2,4-оксадиазол-5-ил)пиридазин-1-ий-1-ил]этилсульфата А-8

Смесь 5-пиридазин-4-ил-1,2,4-оксадиазола (0,056 г) и 1,3,2-диоксатиолан-2,2-диоксида (0,054 г) нагревали в 1,2-дихлорэтано (3 мл) при 85°C в течение ночи. Полученный осадок отфильтровывали, промывали ацетоном и очищали посредством препаративной HPLC с обращенной фазой с получением 2-[4-(1,2,4-оксадиазол-5-ил)пиридазин-1-ий-1-ил]этилсульфата в виде смеси 1:1 с 2-[5-(1,2,4-оксадиазол-5-ил)пиридазин-1-ий-1-ил]этилсульфатом.

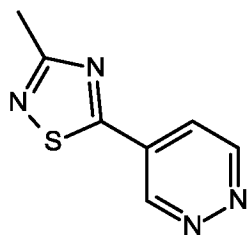
¹H ЯМР (400МГц, DMSO-d₆) 10,32-10,28 (m, 1H) 10,18-10,12 (m, 1H) 9,55-9,54 (m, 1H) 9,43-9,38 (m, 1H) 5,26-5,14 (m, 2H) 4,43-4,33 (m, 2H)

Другой изомер, 2-[5-(1,2,4-оксадиазол-5-ил)пиридазин-1-ий-1-ил]этилсульфат, характеризуется структурой, указанной ниже:



¹H ЯМР (400МГц, DMSO-d₆) 10,72 (s, 1H) 9,95-9,90 (m, 1H) 9,53-9,52 (m, 1H) 9,27-9,22 (m, 1H) 5,26-5,14 (m, 2H) 4,43-4,33 (m, 2H)

Пример 7. Получение 3-метил-5-пиридазин-4-ил-1,2,4-тиадиазола

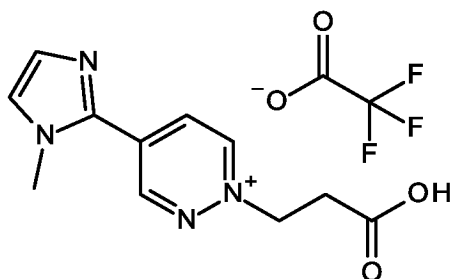


К смеси *N,N*-[1-(диметиламино)этилиден]пиридазин-4-карботиоамида (700 мг), пиридина (0,56 мл) и этанола (18 мл) добавляли раствор гидроксиламин-О-сульфоновой кислоты (0,42 г) в метаноле (7 мл) при комнатной температуре. Через один час реакционную смесь разделяли между дихлорметаном и насыщенным водным раствором бикарбоната натрия. Органическую фазу концентрировали и растирали с

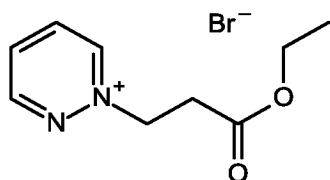
гексаном с получением 3-метил-5-пиридазин-4-ил-1,2,4-тиадиазола в виде бежевого твердого вещества.

^1H ЯМР (400МГц, CD_3OD) 9,76 (dd, 1H) 9,41 (dd, 1H) 8,25 (dd, 1H) 2,75 (s, 3H)

5 **Пример 8. Получение 3-[4-(1-метилимидазол-2-ил)пиридазин-1-ий-1-ил]пропановой кислоты, 2,2,2-трифторацетата А-31**



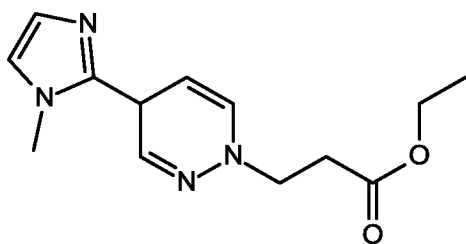
Стадия 1. Получение этил-3-пиридазин-1-ий-1-илпропаноата бромид



10 К раствору пиридазина (1 г) в ацетонитриле (40 мл) добавляли этил-3-бромпропаноат (1,76 мл) и реакционную смесь перемешивали при 80°C в течение 25 часов. Смесь концентрировали и разделяли между дихлорметаном и водой. Водный слой высушивали сублимацией с получением этил-3-пиридазин-1-ий-1-илпропаноата бромид в виде бежевого твердого вещества.

15 ^1H ЯМР (400МГц, D_2O) 9,68-9,92 (m, 1H) 9,43-9,56 (m, 1H) 8,43-8,69 (m, 2H) 5,15 (t, 2H) 4,11 (q, 2H) 3,27 (t, 2H) 1,16 (t, 3H)

Стадия 2. Получение этил-3-[4-(1-метилимидазол-2-ил)-4Н-пиридазин-1-ил]пропаноата

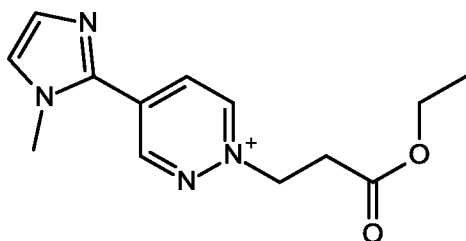


20 К раствору 1-метилимидазола (1 г) в тетрагидрофуране (10 мл) при -78°C в атмосфере азота по каплям добавляли н-бутиллитий (2,5 М в гексанах, 5,4 мл). После

перемешивания при данной температуре в течение 30 минут добавляли хлорид цинка (0,5 М в THF, 7,7 мл) и обеспечивали нагревание реакционной смеси до комнатной температуры. К данной смеси добавляли раствор этил-3-пиридазин-1-ий-1-илпропаноата (1,99 г) и иодида меди (2,1 г) в *N,N*-диметилформамиде (10 мл) и
 5 реакционную смесь перемешивали при комнатной температуре в течение ночи. Данную реакционную смесь разделяли между этилацетатом и водой. Органическую фазу концентрировали с получением неочищенного этил-3-[4-(1-метилимидазол-2-ил)-4Н-пиридазин-1-ил]пропаноата, который непосредственно применяли на следующей стадии. LC-MS 0,25 мин. МН⁺ 263.

10

Стадия 3. Получение этил-3-[4-(1-метилимидазол-2-ил)пиридазин-1-ий-1-ил]пропаноата



К раствору неочищенного этил-3-[4-(1-метилимидазол-2-ил)-4Н-пиридазин-1-ил]пропаноата (2,52 г) в тетрагидрофуране (40 мл) добавляли 2,3,5,6-тетрахлор-1,4-бензохинон (2,36 г) и смесь перемешивали при комнатной температуре в течение 2 часов. Реакционную смесь концентрировали с получением неочищенного этил-3-[4-(1-метилимидазол-2-ил)пиридазин-1-ий-1-ил]пропаноата, который непосредственно применяли на следующей стадии. LC-MS 0,26 мин. МН⁺ 261.

20

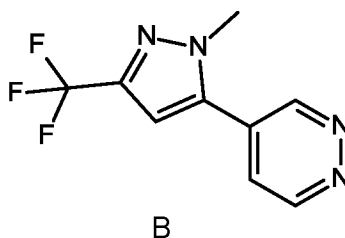
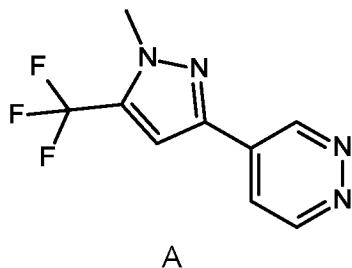
Стадия 4. Получение 3-[4-(1-метилимидазол-2-ил)пиридазин-1-ий-1-ил]пропановой кислоты, 2,2,2-трифторацетата А-31

Смесь неочищенного этил-3-[4-(1-метилимидазол-2-ил)пиридазин-1-ий-1-ил]пропаноата (320 мг) и 2 М хлористоводородной кислоты (6 мл) нагревали при 80°C в течение 2 часов. После охлаждения до комнатной температуры реакционную смесь концентрировали и очищали посредством препаративной HPLC с обращенной фазой с получением 3-[4-(1-метилимидазол-2-ил)пиридазин-1-ий-1-ил]пропаноата в виде пурпурной смолы.

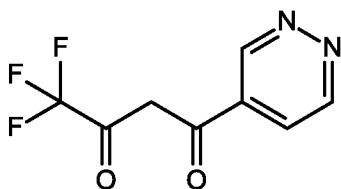
25

^1H ЯМР (400МГц, D_2O) 9,71-9,90 (m, 2H) 8,67-8,81 (m, 1H) 7,59-7,69 (m, 1H) 7,54 (d, 1H) 5,07 (t, 2H) 3,95-4,07 (m, 3H) 3,13-3,31 (m, 2H) (один протон CO_2H отсутствует)

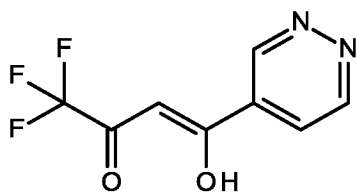
Пример 9. Получение 4-[1-метил-5-(трифторметил)пиразол-3-ил]пиридазина (А) и 4-[2-метил-5-(трифторметил)пиразол-3-ил]пиридазина (В)



Стадия 1. Получение 4,4,4-трифтор-1-пиридазин-4-ил-бутан-1,3-диона



- 10 К смеси этил-2,2,2-трифторацетата (0,256 г) и метоксида натрия (25% по весу в метаноле, 0,449 мл) в *трет*-бутилметиловом эфире (0,409 мл) добавляли суспензию 1-пиридазин-4-илэтанона (0,200 г) в *трет*-бутилметиловом эфире (2,87 мл) при комнатной температуре и смесь перемешивали при комнатной температуре в течение
- 15 лимонной кислоты, разбавляли водой и экстрагировали дихлорметаном (3 раза). Обе жидкие фазы концентрировали, объединяли, затем очищали посредством препаративной HPLC с обращенной фазой с получением 4,4,4-трифтор-1-пиридазин-4-ил-бутан-1,3-диона в виде коричневой смолы. Продукт представлял собой смесь 2:1 таутомеров енол:кетон.
- 20 ^1H ЯМР (400МГц, CD_3CN)
- пики для таутомера, представляющего собой кетон 9,57 (s, 1H) 9,51-9,43 (m, 1H) 8,04-7,98 (m, 1H) 3,52 (s, 2H)
- пики для таутомера, представляющего собой енол (показан ниже) 9,64 (s, 1H) 9,5-9,44 (m, 1H) 8,10-8,04 (m, 1H) 6,96 (s, 1H)



Стадия 2. Получение 4-[1-метил-5-(трифторметил)пиразол-3-ил]пиридазина (А) и 4-[2-метил-5-(трифторметил)пиразол-3-ил]пиридазина (В)

5

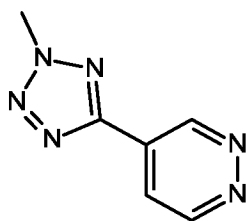
Метилгидразин (0,54 мл) медленно добавляли к раствору 4,4,4-трифтор-1-пиридазин-4-ил-бутан-1,3-диона (1,5 г) в этаноле (11 мл) с последующим нагреванием с обратным холодильником в течение 4 часов.

После охлаждения до комнатной температуры смесь концентрировали и остаток растворяли в тетрагидрофуране (34 мл). К данному раствору добавляли 3 М водный раствор хлористоводородной кислоты (6,9 мл) с последующим нагреванием с обратным холодильником в течение 2 часов. Реакционную смесь охлаждали до комнатной температуры и обеспечивали ее отстаивание в течение ночи. Смесь концентрировали и очищали посредством препаративной HPLC с обращенной фазой с получением 4-[1-метил-5-(трифторметил)пиразол-3-ил]пиридазина (А) в виде оранжевого твердого вещества и 4-[2-метил-5-(трифторметил)пиразол-3-ил]пиридазина (В) в виде оранжевой жидкости.

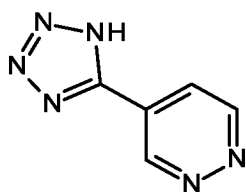
4-[1-Метил-5-(трифторметил)пиразол-3-ил]пиридазин (А): ^1H ЯМР (400МГц, CD_3CN) 9,70-9,65 (m, 1H) 9,31-9,27 (m, 1H) 8,11 (dd, 1H) 7,45 (s, 1H) 4,11 (s, 3H)

4-[2-Метил-5-(трифторметил)пиразол-3-ил]пиридазин (В): ^1H ЯМР (400МГц, CD_3CN) 9,43-9,39 (m, 1H) 9,38-9,35 (m, 1H) 7,87 (dd, 1H) 7,05 (s, 1H) 4,04 (s, 3H)

Пример 10. Получение 4-(2-метилтетразол-5-ил)пиридазина



Стадия 1. Получение 4-(1H-тетразол-5-ил)пиридазина



К смеси пиридазин-4-карбонитрила (0,200 г), азида натрия (0,187 г) и пентагидрата сульфата меди (0,048 г) добавляли диметилсульфоксид (0,4 мл). Данную смесь

5 нагревали при 145°C под действием микроволнового излучения в течение 10 минут.

После охлаждения до комнатной температуры реакционную смесь гасили ледяной водой (20 мл), подкисляли с помощью 1 М водного раствора хлористоводородной кислоты и экстрагировали смесью при соотношении этилацетата и метанола 9:1

(3 x 30 мл). Объединенные органические фазы концентрировали с получением

10 неочищенного 4-(1H-тетразол-5-ил)пиридазина.

¹H ЯМР (400 МГц, DMSO-d₆) 9,67 (br s, 1H) 9,15 (br d, 1H) 8,00 (br d, 1H) (один протон NH отсутствует)

Стадия 2. Получение 4-(2-метилтетразол-5-ил)пиридазина

15

Смесь 4-(1H-тетразол-5-ил)пиридазина (0,16 г), *N,N*-диметилформамида (1 мл), диметилкарбоната (0,5 мл) и 1,4-диазабицикло[2.2.2]октана (0,026 г) нагревали при 150°C под действием микроволнового излучения в течение 80 минут. После

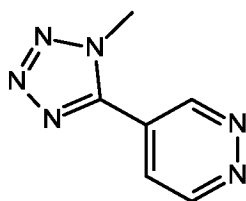
охлаждения до комнатной температуры реакционную смесь концентрировали и

20 очищали посредством хроматографии на силикагеле с элюированием с помощью 0-10%

метанола в дихлорметане с получением 4-(2-метилтетразол-5-ил)пиридазина в виде коричневого твердого вещества.

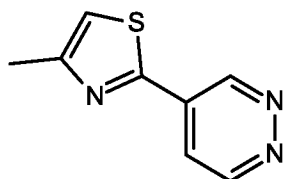
¹H ЯМР (400МГц, CD₃OD) 9,85 (s, 1H) 9,39 (d, 1H) 8,34 (d, 1H) 4,50 (s, 3H)

25 Другой изомер, 4-(1-метилтетразол-5-ил)пиридазин, также получали из данной реакции.



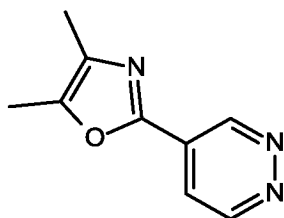
^1H ЯМР (400МГц, CD_3OD) 9,71 (s, 1H) 9,48 (d, 1H) 8,23 (d, 1H) 4,34 (s, 3H)

Пример 11. Получение 4-метил-2-пиридазин-4-илтиазола

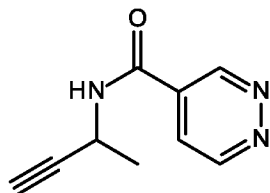


- 5 К раствору пиридазин-4-карботиоамида (0,5 г) в этаноле (10 мл) добавляли 1-хлорпропан-2-он (0,432 г) с последующим нагреванием при 80°C в течение 5 часов. Реакционную смесь концентрировали и остаток растворяли в дистиллированной воде. Повышали основность водной фазы насыщенным водным раствором бикарбоната натрия и ее экстрагировали дихлорметаном. Органическую фазу концентрировали и
- 10 очищали посредством хроматографии на силикагеле с элюированием с помощью от 60 до 80% этилацетата в циклогексане с получением 4-метил-2-пиридазин-4-илтиазола.
- ^1H ЯМР (400МГц, CD_3OD) 9,70-9,80 (m, 1H) 9,24-9,33 (m, 1H) 8,08-8,24 (m, 1H) 7,47 (s, 1H) 2,55 (s, 3H)

15 Пример 12. Получение 4,5-диметил-2-пиридазин-4-илоксазола



Стадия 1. Получение *N*-(1-метилпроп-2-инил)пиридазин-4-карбоксамида



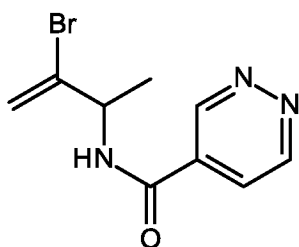
- 20 К смеси метилпиридазин-4-карбоксилата (1,00 г) в метаноле (4 мл) добавляли хлорид 1-метилпроп-2-иниламмония (2,29 г) и *N,N*-диизопропилэтиламин (3,92 мл) с последующим нагреванием при 100°C под действием микроволнового излучения в течение 2 часов. После охлаждения до комнатной температуры реакционную смесь концентрировали и очищали посредством хроматографии на силикагеле с

элюированием этилацетатом с получением *N*-(1-метилпроп-2-инил)пиридазин-4-карбоксамид.

¹H ЯМР (400МГц, CDCl₃) 9,49-9,67 (m, 1H) 9,38 (dd, 1H) 7,87 (dd, 1H) 6,83-7,07 (m, 1H) 4,94-5,13 (m, 1H) 2,37 (d, 1H) 1,48-1,63 (m, 3H)

5

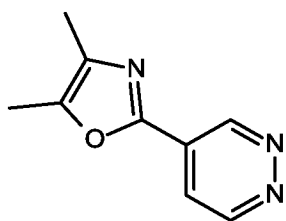
Стадия 2. Получение *N*-(2-бром-1-метилаллил)пиридазин-4-карбоксамид



Смесь *N*-(1-метилпроп-2-инил)пиридазин-4-карбоксамид (0,27 г) и бромистоводородной кислоты (5,4 мл, 33 вес. % в уксусной кислоте) нагревали при 60°C в течение 18 часов. После охлаждения до комнатной температуры добавляли насыщенный водный раствор бикарбоната натрия и продукт экстрагировали этилацетатом. Органическую фазу концентрировали с получением неочищенного *N*-(2-бром-1-метилаллил)пиридазин-4-карбоксамид, который непосредственно применяли на следующей стадии.

15

Стадия 3. Получение 4,5-диметил-2-пиридазин-4-илоксазола

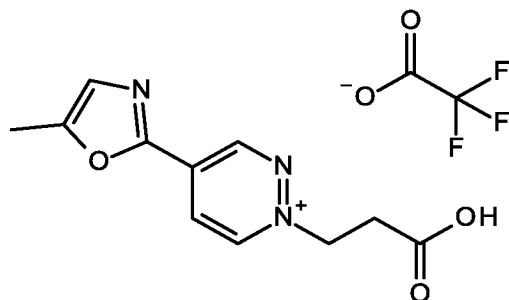


К раствору неочищенного *N*-(2-бром-1-метилаллил)пиридазин-4-карбоксамид (0,25 г) в диметилсульфоксиде (2,5 мл) в атмосфере азота добавляли карбонат цезия (1,05 г) с последующим нагреванием при 110°C в течение 1 часа. После охлаждения до комнатной температуры добавляли водный насыщенный раствор хлорида лития и неочищенный продукт экстрагировали этилацетатом. Органическую фазу высушивали над сульфатом натрия, концентрировали и очищали посредством хроматографии на силикагеле с элюированием этилацетатом с получением 4,5-диметил-2-пиридазин-4-илоксазола.

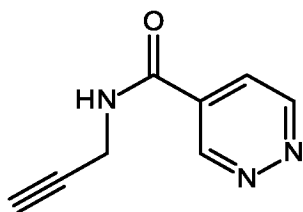
25

^1H ЯМР (400МГц, CDCl_3) 9,63-9,90 (m, 1H) 9,23-9,47 (m, 1H) 7,92-8,15 (m, 1H) 2,34-2,51 (m, 3H) 2,22 (m, 3H)

Пример 13. Получение 3-[4-(5-метилоксазол-2-ил)пиридазин-1-ий-1-ил]пропановой кислоты, 2,2,2-трифторацетата А-15



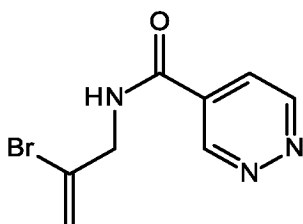
Стадия 1. Получение *N*-проп-2-инилпиридазин-4-карбоксамида



К раствору метилпиридазин-4-карбоксилата (1 г) в метаноле (2,5 мл) добавляли проп-2-ин-1-амин (4 г) и смесь нагревали при 100°C под действием микроволнового излучения в течение 4 часов. После охлаждения до комнатной температуры реакционную смесь концентрировали и очищали посредством хроматографии на силикагеле с элюированием с помощью 90-100% этилацетата в циклогексане с получением *N*-проп-2-инилпиридазин-4-карбоксамида в виде белого твердого вещества.

^1H ЯМР (400МГц, $\text{DMSO}-d_6$) 9,53-9,56 (m, 1H) 9,47-9,52 (m, 1H) 9,42-9,46 (m, 1H) 7,96-8,03 (m, 1H) 4,06-4,16 (m, 2H) 3,19-3,26 (m, 1H)

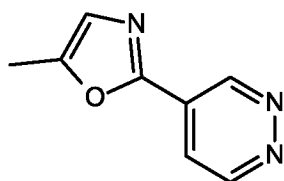
Стадия 2. Получение *N*-(2-бромаллил)пиридазин-4-карбоксамида



Смесь *N*-проп-2-инилпиридазин-4-карбоксамида (0,5 г) и бромистоводородной кислоты (10 мл, 33 вес. % в уксусной кислоте) нагревали при 60°C в течение 18 часов. После

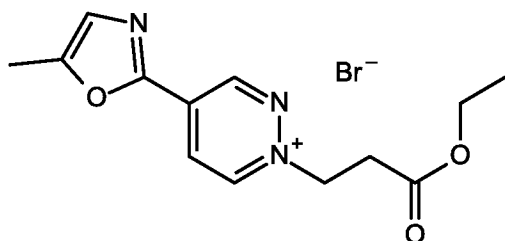
- охлаждения до комнатной температуры добавляли воду и повышали основность смеси водным насыщенным раствором бикарбоната натрия. Данную водную смесь экстрагировали этилацетатом и органическую фазу дополнительно промывали соевым раствором, высушивали над сульфатом натрия и концентрировали с получением
- 5 неочищенного *N*-(2-бромаллил)пиридазин-4-карбоксамида, который непосредственно применяли на следующей стадии.

Стадия 3. Получение 5-метил-2-пиридазин-4-илоксазола



- 10 К смеси неочищенного *N*-(2-бромаллил)пиридазин-4-карбоксамида (0,1 г) в диметилсульфоксиде (1 мл) в атмосфере азота добавляли карбонат цезия (0,222 г) и смесь нагревали при 110°C в течение 3 часов. Реакционную смесь охлаждали до комнатной температуры, разбавляли водой (40 мл) и экстрагировали этилацетатом (3 x 20 мл). Объединенные органические фазы промывали насыщенным водным
- 15 раствором хлорида лития (30 мл), соевым раствором (30 мл) и высушивали над безводным сульфатом натрия. Посредством концентрирования органического фильтрата получали 5-метил-2-пиридазин-4-илоксазол.
- ¹H ЯМР (400МГц, CDCl₃) 9,78 (s, 1H) 9,36 (d, 1H) 8,06 (dd, 1H) 7,05 (s, 1H) 2,49 (s, 3H)

- 20 Стадия 4. Получение этил-3-[4-(5-метилоксазол-2-ил)пиридазин-1-ий-1-ил]пропаноата бромид



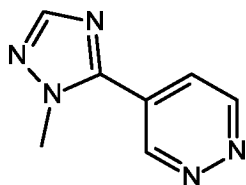
- К раствору 5-метил-2-пиридазин-4-илоксазола (0,1 г) в ацетонитриле (2 мл) добавляли этил-3-бромпропаноат (0,159 мл) и смесь нагревали при 80°C в течение 18 часов. После
- 25 охлаждения до комнатной температуры раствор концентрировали и остаток растирали с *трет*-бутилметилловым эфиром с получением неочищенной смеси 1:1 этил-3-[4-(5-

метилоксазол-2-ил)пиридазин-1-ий-1-ил]пропаноата бромиды и этил-3-[5-(5-метилоксазол-2-ил)пиридазин-1-ий-1-ил]пропаноата бромиды, которые непосредственно применяли на следующей стадии.

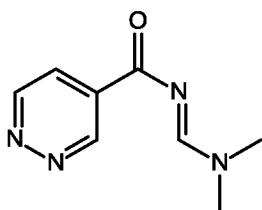
- 5 Стадия 5. Получение 3-[4-(5-метилоксазол-2-ил)пиридазин-1-ий-1-ил]пропановой кислоты 2,2,2-трифторацетата А-15

10 Неочищенную смесь 1:1 этил-3-[4-(5-метилоксазол-2-ил)пиридазин-1-ий-1-ил]пропаноата бромиды и этил-3-[5-(5-метилоксазол-2-ил)пиридазин-1-ий-1-ил]пропаноата бромиды (0,2 г) в 2 М хлористоводородной кислоте (4 мл) перемешивали при комнатной температуре в течение 18 часов. Реакционную смесь концентрировали и очищали посредством препаративной HPLC с обращенной фазой с получением 3-[4-(5-метилоксазол-2-ил)пиридазин-1-ий-1-ил]пропановой кислоты 2,2,2-трифторацетата.
¹H ЯМР (400МГц, D₂O) 9,82 (d, 1H) 9,74 (d, 1H) 8,77 (dd, 1H) 7,29 (d, 1H) 5,06 (t, 2H)
 15 3,23 (t, 2H) 2,47 (d, 3H) (один протон CO₂H отсутствует)

Пример 14. Получение 4-(2-метил-1,2,4-триазол-3-ил)пиридазина

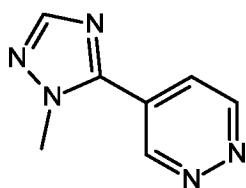


- 20 Стадия 1. Получение *N*-(диметиламинометил)пиридазин-4-карбоксиамида



Смесь пиридазин-4-карбоксиамида (2 г) и 1,1-диметокси-*N,N*-диметилметанамина (20 мл) в атмосфере азота нагревали с обратным холодильником в течение 1 часа. Реакционную смесь концентрировали и остаток промывали циклогексаном (3 x 20 мл) с
 25 получением *N*-(диметиламинометил)пиридазин-4-карбоксиамида, который непосредственно применяли на следующей стадии.

Стадия 2. Получение 4-(2-метил-1,2,4-триазол-3-ил)пиридазина

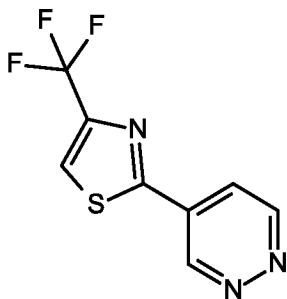


К смеси *N*-(диметиламинометил)пиридазин-4-карбоксамида (0,5 г), уксусной кислоты (5 мл) и 1,4-диоксана (5 мл) добавляли сульфат метилгидразина (0,404 г).

- 5 Данную смесь нагревали при 70°C под действием микроволнового излучения в течение 30 минут. После охлаждения до комнатной температуры реакционную смесь концентрировали и экстрагировали этилацетатом (3 x 100 мл). Органические слои концентрировали и очищали посредством хроматографии на силикагеле с элюированием с помощью 0-90% метанола в дихлорметане с получением 4-(2-метил-
- 10 1,2,4-триазол-3-ил)пиридазина.

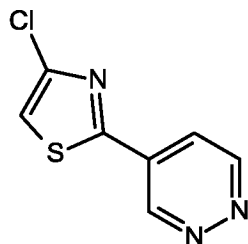
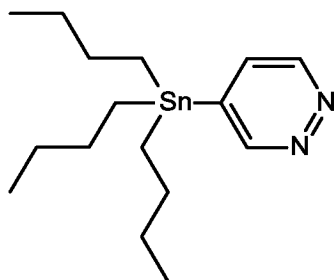
¹H ЯМР (400МГц, CDCl₃) 9,62 (dd, 1H) 9,41 (dd, 1H) 8,04 (s, 1H) 7,86 (dd, 1H) 4,15 (s, 3H)

Пример 15. Получение 2-пиридазин-4-ил-4-(трифторметил)тиазола



- 15 К смеси пиридазин-4-карботиоамида (0,05 г) и этанола (0,25 мл) добавляли 3-бром-1,1,1-трифторпропан-2-он (0,089 г). Полученную смесь нагревали с обратным холодильником в течение 6 часов, затем обеспечивали ее отстаивание в течение ночи. Реакционную смесь концентрировали и растворяли в воде (50 мл). Водную фазу
- 20 регулировали до pH 7-8 насыщенным водным раствором бикарбоната натрия и экстрагировали этилацетатом (3 x 80 мл). Органические слои концентрировали и очищали посредством хроматографии на силикагеле с элюированием с помощью 50-60% этилацетата в циклогексане с получением 2-пиридазин-4-ил-4-
- (трифторметил)тиазола.

- 25 ¹H ЯМР (400МГц, CD₃CN) 9,73 (dd, 1H) 9,37 (dd, 1H) 8,32 (d, 1H) 8,06 (dd, 1H)

Пример 16. Получение 4-хлор-2-пиридазин-4-илтиазола**Стадия 1. Получение трибутил(пиридазин-4-ил)станнана**

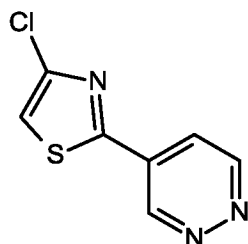
5

К раствору диизопропиламида лития (1 М раствор в тетрагидрофуране, 125 мл) при –78°C в атмосфере азота по каплям добавляли раствор пиридазина (10 г) и хлорида три-
 н-бутилолова (44,6 г) в THF (100 мл). Реакционную смесь перемешивали при –78°C в течение 1 часа. Реакционную смесь нагревали до комнатной температуры и гасили
 насыщенным водным раствором хлорида аммония (100 мл) и экстрагировали
 этилацетатом (3×150 мл). Органический слой высушивали над сульфатом натрия,
 концентрировали и очищали посредством хроматографии на диоксиде кремния с
 элюированием с помощью 30% этилацетата в гексанах с получением
 трибутил(пиридазин-4-ил)станнана в виде бледно-коричневой жидкости.

10

¹H ЯМР (400МГц, CDCl₃) 9,17 (t, 1H) 9,02 (dd, 1H) 7,54 (dd, 1H) 1,57-1,49 (m, 6H) 1,37-
 1,29 (m, 6H) 1,19-1,13 (m, 6H) 0,92-0,86 (m, 9H).

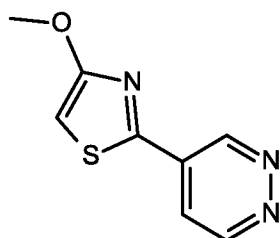
15

Стадия 2. Получение 4-хлор-2-пиридазин-4-илтиазола

К раствору 2,4-дихлортиазола (1 г) в 1,4-диоксане (15 мл) добавляли трибутил(пиридазин-4-ил)станнан (2,876 г), тетракис(трифенилфосфин)палладий(0) (0,376 г), иодид меди(I) (0,371 г) и хлорид лития (0,826 г). Реакционную смесь продували азотом, затем нагревали при 130°C под действием микроволнового излучения в течение 40 минут. После охлаждения до комнатной температуры смесь фильтровали через целит и промывали метанолом. Фильтрат концентрировали и очищали посредством хроматографии на силикагеле с элюированием с помощью от 50 до 60% этилацетата в циклогексане с получением 4-хлор-2-пиридазин-4-илтиазола.

¹H ЯМР (400МГц, DMSO-d₆) 9,60-9,88 (m, 1H) 9,40 (d, 1H) 8,15 (dd, 1H) 8,11 (s, 1H)

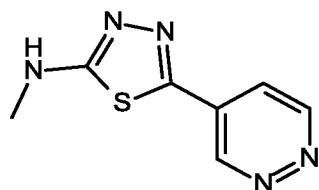
Пример 17. Получение 4-метокси-2-пиридазин-4-илтиазола



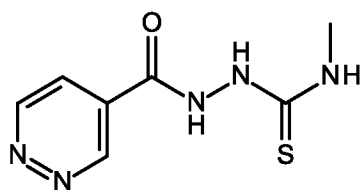
Смесь 4-хлор-2-пиридазин-4-илтиазола (0,2 г) в метоксиде натрия (30% в метаноле, 5 мл) нагревали при 100°C под действием микроволнового излучения в течение 60 минут. Реакционную смесь концентрировали и очищали посредством хроматографии на силикагеле с элюированием с помощью от 50 до 60% этилацетата в циклогексане с получением 4-метокси-2-пиридазин-4-илтиазола.

¹H ЯМР (400МГц, CDCl₃) 9,64-9,75 (m, 1H) 9,28 (d, 1H) 7,90 (dd, 1H) 6,39 (s, 1H) 4,03 (s, 3H)

Пример 18. Получение N-метил-5-пиридазин-4-ил-1,3,4-тиадиазол-2-амин

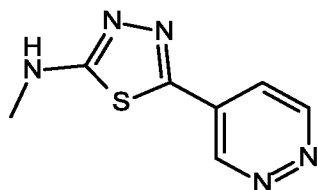


Стадия 1. Получение 1-метил-3-(пиридазин-4-карбониламино)тиомочевины



К смеси пиридазин-4-карбогидразида (2 г) и пропан-2-ола (40 мл) добавляли метилизотиоцианат (1,059 г) и смесь нагревали с обратным холодильником в течение 3 часов. После охлаждения до 0°C полученный осадок фильтровали, промывали *tert*-бутилметилловым эфиром (2 x 50 мл) и дихлорметаном (10 мл) и высушивали с получением 1-метил-3-(пиридазин-4-карбониламино)тиомочевины в виде желтого твердого вещества.

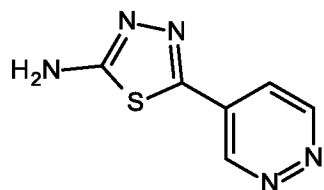
¹H ЯМР (400МГц, DMSO-d₆) 10,89 (br s, 1H) 9,56-9,62 (m, 1H) 9,46-9,56 (m, 2H) 8,20 (br d, 1H) 8,04 (dd, 1H) 2,88 (d, 3H)

Стадия 2. Получение *N*-метил-5-пиридазин-4-ил-1,3,4-тиадиазол-2-амин

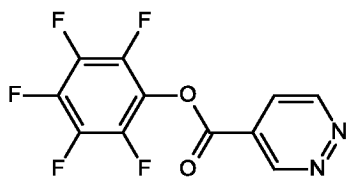
Смесь 1-метил-3-(пиридазин-4-карбониламино)тиомочевины (0,4 г) и концентрированной серной кислоты (4 мл) перемешивали при комнатной температуре в течение 12 часов. Реакционную смесь охлаждали на льду и осторожно повышали ее основность водным раствором гидроксида аммония (28-30% NH₃). Полученный осадок отфильтровывали, промывали водой, затем высушивали с получением *N*-метил-5-пиридазин-4-ил-1,3,4-тиадиазол-2-амин.

¹H ЯМР (400МГц, DMSO-d₆) 9,60 (dd, 1H) 9,29 (dd, 1H) 8,33 (br s, 1H) 7,93 (dd, 1H) 2,98 ppm (s, 3H)

Пример 19. Получение 5-пиридазин-4-ил-1,3,4-тиадиазол-2-амин



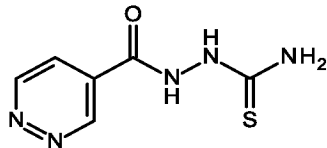
Стадия 1. Получение (2,3,4,5,6-пентафторфенил)пиридазин-4-карбоксилата



К раствору пиридазин-4-карбоновой кислоты (5 г) в дихлорметане (50 мл) в атмосфере азота добавляли 2,3,4,5,6-пентафторфенол (7,194 г). Смесь охлаждали до 0°C и

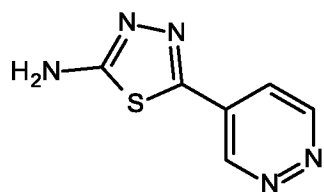
- 5 добавляли гидрохлорид 3-(этилиминометиленамино)-*N,N*-диметилпропан-1-амин (8,99 г) и *N,N*-диметиламинопиридин (0,964 г). Через 4 часа реакционную смесь разбавляли водой и экстрагировали этилацетатом. Органическую фазу промывали водой, соевым раствором и высушивали над сульфатом натрия. Органический слой концентрировали и очищали посредством хроматографии на силикагеле с
- 10 элюированием с помощью 35% этилацетата в гексане с получением (2,3,4,5,6-пентафторфенил)пиридазин-4-карбоксилата в виде белого твердого вещества.
- ¹H ЯМР (400МГц, CDCl₃) 9,90-9,76 (m, 1H) 9,67-9,47 (m, 1H) 8,36-7,88 (m, 1H)

Стадия 2. Получение (пиридазин-4-карбониламино)тиомочевины



- 15 К раствору (2,3,4,5,6-пентафторфенил)пиридазин-4-карбоксилата (1 г) в ацетонитриле (20 мл) добавляли тиосемикарбазид (0,377 г) с последующим нагреванием при 70°C в течение 12 часов. После охлаждения до комнатной температуры реакционную смесь концентрировали и очищали посредством хроматографии на силикагеле с
- 20 элюированием с помощью 0-10% метанола в дихлорметане с получением (пиридазин-4-карбониламино)тиомочевины.
- ¹H ЯМР (400МГц, DMSO-d₆) 10,93 (br s, 1H) 9,50-9,59 (m, 2H) 9,46 (d, 1H) 8,02 (dd, 2H) 7,83 (br s, 1H)

Стадия 3. Получение 5-пиридазин-4-ил-1,3,4-тиадиазол-2-амин

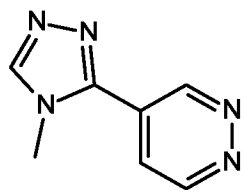


Смесь (пиридазин-4-карбониламино)тиомочевин (1 г) и концентрированной серной кислоты (10 мл) перемешивали при комнатной температуре в течение 12 часов.

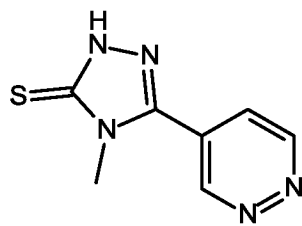
- 5 Реакционную смесь охлаждали на льду и осторожно повышали ее основность водным раствором гидроксида аммония (28-30% NH_3). Полученный осадок отфильтровывали, промывали водой и высушивали с получением 5-пиридазин-4-ил-1,3,4-тиадиазол-2-амин в виде светло-зеленого твердого вещества.

^1H ЯМР (400МГц, DMSO-d_6) 9,57-9,67 (m, 1H) 9,19-9,34 (m, 1H) 7,91-7,98 (m, 1H) 7,78-7,90 (m, 2H)

Пример 20. Получение 4-(4-метил-1,2,4-триазол-3-ил)пиридазина



Стадия 1. Получение 4-метил-3-пиридазин-4-ил-1H-1,2,4-триазол-5-тиона



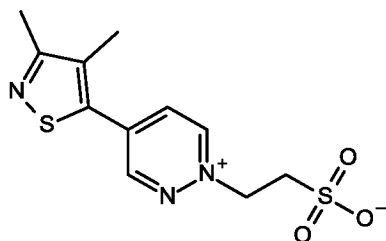
- 15 Смесь 1-метил-3-(пиридазин-4-карбониламино)тиомочевин (0,750 г) и уксусной кислоты (10 мл) нагревали при 120°C в течение 16 часов. Реакционную смесь концентрировали и неочищенное твердое вещество растирали с *трет*-бутилметилловым эфиром (30 мл) с получением 4-метил-3-пиридазин-4-ил-1H-1,2,4-триазол-5-тиона.
- 20 ^1H ЯМР (400МГц, DMF-d_7) 14,73 (br s, 1H) 10,00 (dd, 1H) 9,89 (dd, 1H) 8,53 (dd, 1H) 4,07 (s, 3H)

Стадия 2. Получение 4-(4-метил-1,2,4-триазол-3-ил)пиридазина

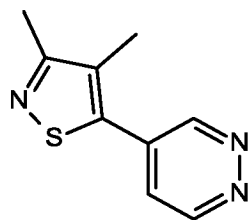
К смеси никеля Ренея (1,25 г, промытый этанолом, взвешенный примерно) в этаноле (8 мл), в атмосфере азота добавляли 4-метил-3-пиридазин-4-ил-1H-1,2,4-триазол-5-тион (0,4 г) и смесь нагревали при 90°C в течение 20 часов. Реакционную смесь фильтровали через целит, промывали этанолом и фильтрат концентрировали с получением 4-(4-метил-1,2,4-триазол-3-ил)пиридазина.

¹H ЯМР (400МГц, CDCl₃) 9,60 (br s, 1H) 9,34 (br s, 1H) 8,23-8,40 (m, 1H) 7,86 (br s, 1H) 3,90 (br s, 3H)

Пример 21. Получение 2-[4-(3,4-диметилизотиазол-5-ил)пиридазин-1-ий-1-ил]этансульфоната А-54



Стадия 1. Получение 3,4-диметил-5-пиридазин-4-илизотиазола

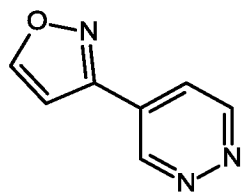


К смеси 4,5-дибром-3-метилизотиазола (1,95 г) в дегазированном 1,4-диоксане (29,3 мл), в атмосфере азота добавляли тетраakis(трифенилфосфин)палладий(0) (1,12 г) и трибутил(пиридазин-4-ил)станнан (2,02 г) и реакционную смесь нагревали при 100°C в течение 18 часов. После охлаждения до комнатной температуры добавляли карбонат калия (1,82 г) и метилбороновую кислоту (0,985 г) и реакционную смесь нагревали при 100°C в течение дополнительных 20 часов. После охлаждения до комнатной температуры реакционную смесь фильтровали через целит и промывали метанолом. Фильтрат концентрировали и очищали посредством хроматографии на силикагеле с элюированием с помощью 0-10% метанола в дихлорметане с получением 3,4-диметил-5-пиридазин-4-илизотиазола, который непосредственно применяли на следующей стадии.

Стадия 2. Получение 2-[4-(3,4-диметилизотиазол-5-ил)пиридазин-1-ий-1-ил]этансульфоната А-54

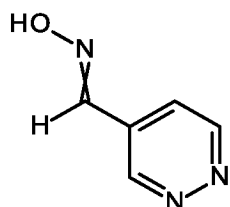
- 5 Смесь неочищенного 3,4-диметил-5-пиридазин-4-илизотиазола (0,3 г) и 2-бромэтансульфоната натрия (0,397 г) в воде (6 мл) и 1,4-диоксане (6 мл) нагревали с обратным холодильником в течение 48 часов. Реакционную смесь концентрировали, промывали этилацетатом и очищали посредством препаративной HPLC с обращенной фазой с получением 2-[4-(3,4-диметилизотиазол-5-ил)пиридазин-1-ий-1-ил]этансульфоната.
- 10 ^1H ЯМР (400МГц, D_2O) 9,73 (dd, 1H) 9,59 (dd, 1H) 8,61 (dd, 1H) 5,20 (t, 2H) 3,67 (t, 2H) 2,44 (s, 3H) 2,35 (s, 3H)

Пример 22. Получение 3-пиридазин-4-илизоксазола



15

Стадия 1. Получение пиридазин-4-карбальдегид-оксима

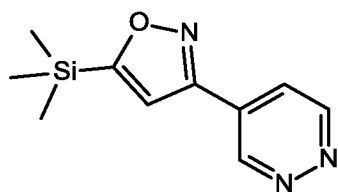


20

К раствору пиридазин-4-карбальдегида (2 г) в этаноле (29,6 мл) добавляли раствор ацетата натрия (1,53 г) и гидрохлорида гидроксилamina (1,29 г) в дистиллированной воде (69,4 мл). Данную полученную смесь нагревали с обратным холодильником в течение 2 часов. Реакционную смесь охлаждали до комнатной температуры, концентрировали и полученный оранжевый остаток растирали с водой и подвергали азеотропной перегонке с метанолом с получением пиридазин-4-карбальдегид-оксима в виде бежевого твердого вещества.

- 25 ^1H ЯМР (400МГц, CD_3OD) 9,41-9,37 (m, 1H) 9,17 (dd, 1H) 8,14 (s, 1H) 7,82 (dd, 1H) (один протон OH отсутствует)

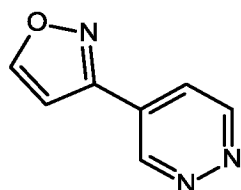
Стадия 2. Получение триметил-(3-пиридазин-4-илизоксазол-5-ил)силана



К раствору пиридазин-4-карбальдегид-оксима (1,45 г) в ацетонитриле (141 мл) при 50°C добавляли раствор *N*-хлорсукцинимид (3,81 г) в ацетонитриле (23,6 мл) и данную смесь нагревали при данной температуре в течение 1 часа. К реакционной смеси добавляли этинил(триметил)силан (17 мл) с последующим добавлением триэтиламина (1,81 мл) и нагревание продолжали в течение дополнительных 3,5 часов. Реакционную смесь охлаждали до комнатной температуры, концентрировали и очищали посредством хроматографии на силикагеле с элюированием с помощью 0-100% этилацетата в изогексане с получением триметил-(3-пиридазин-4-илизоксазол-5-ил)силана в виде желтого твердого вещества.

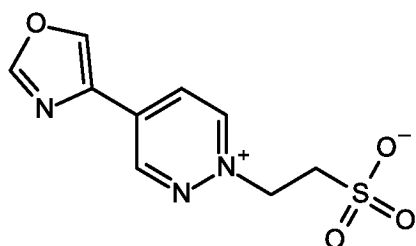
^1H ЯМР (400МГц, CDCl_3) 9,64-9,59 (m, 1H) 9,32 (dd, 1H) 7,88 (dd, 1H) 6,86 (s, 1H) 0,42 (s, 9H)

Стадия 3. Получение 3-пиридазин-4-илизоксазола

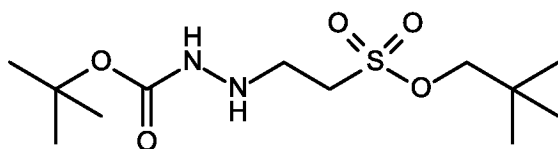


К раствору триметил-(3-пиридазин-4-илизоксазол-5-ил)силана (0,100 г) в этаноле (2,51 мл) добавляли водный раствор гидроксида аммония (28-30% NH_3 , 0,150 мл) и реакционную смесь перемешивали при комнатной температуре в течение 20 часов. Реакционную смесь концентрировали с получением 3-пиридазин-4-илизоксазола в виде коричневой смолы.

^1H ЯМР (400МГц, CD_3OD) 9,74-9,67 (m, 1H), 9,35 (dd, 1H), 8,91 (d, 1H), 8,17 (dd, 1H), 7,19 (d, 1H)

Пример 23. Получение 2-(4-оксазол-4-илпиридазин-1-ий-1-ил)этансульфоната А-22

Стадия 1. Получение 2,2-диметилпропил-2-(2-трет-бутоксикарбонилгидразино)этансульфоната

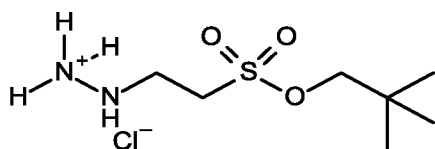


5

К раствору 2,2-диметилпропилэтансульфоната (1,35 г) в метаноле (10,1 мл) добавляли трет-бутилкарбазат (1 г) и смесь нагревали при 70°C в течение 24 часов. Реакционную смесь затем концентрировали с получением 2,2-диметилпропил-2-(2-трет-бутоксикарбонилгидразино)этансульфоната в виде желтой жидкости.

10 ^1H ЯМР (400МГц, CDCl_3) 3,90 (s, 2H) 3,38-3,30 (m, 4H) 1,50-1,43 (s, 9H) 1,00-0,97 (s, 9H) (два протона NH отсутствуют)

Стадия 2. Получение хлорида [2-(2,2-диметилпропоксисульфонил)этиламино]аммония

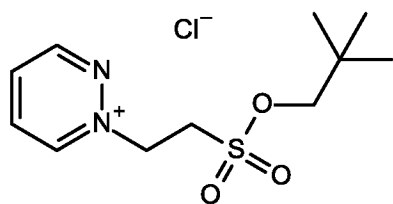


15 Раствор 2,2-диметилпропил-2-(2-трет-бутоксикарбонилгидразино)этансульфоната (1 г) в 3 М метанольном растворе хлороводорода (24,2 мл) нагревали при 70°C в течение 7 часов. После охлаждения до комнатной температуры реакцию смесь концентрировали с получением хлорида [2-(2,2-диметилпропоксисульфонил)этиламино]аммония в виде розовой смолы, которая затвердевала при отстаивании.

20

^1H ЯМР (400МГц, CD_3OD) 3,95 (s, 2H) 3,59-3,53 (m, 2H) 3,44-3,39 (m, 2H) 1,00 (s, 9H) (три протона NH отсутствуют)

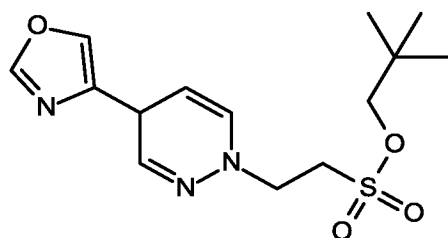
Стадия 3. Получение хлорида 2,2-диметилпропил-2-пиридазин-1-ий-1-илэтансульфоната



Раствор 2,5-диметокси-2,5-дигидрофурана (0,5 г) в уксусной кислоте (2 мл) и воде (1 мл) перемешивали при комнатной температуре в течение 4 часов. К полученному добавляли раствор хлорида [2-(2,2-диметилпропоксисульфонил)этиламино]аммония (1,04 г) в воде (1 мл) и смесь перемешивали при комнатной температуре в течение ночи. Реакционную смесь концентрировали и очищали посредством хроматографии на силикагеле с элюированием с помощью 0-50% метанола в дихлорметане с получением хлорида 2,2-диметилпропил-2-пиридазин-1-ий-1-илэтансульфоната.

^1H ЯМР (400МГц, CDCl_3) 11,11 (d, 1H) 9,45 (d, 1H) 8,96 (ddd, 1H) 8,58 (dd, 1H) 5,68 (t, 2H) 4,30 (t, 2H) 3,99 (s, 2H) 0,98 (s, 9H)

Стадия 4. Получение 2,2-диметилпропил-2-(4-оксазол-4-ил-4Н-пиридазин-1-ил)этансульфоната



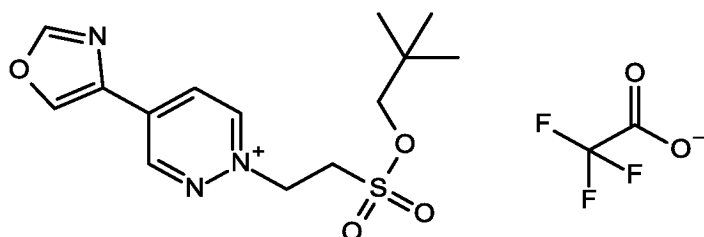
Раствор оксазола (1 г) перемешивали в тетрагидрофуране (10 мл) и охлаждали до -78°C в атмосфере азота. По каплям добавляли раствор *n*-бутиллития (2,5 М в гексанах, 5,8 мл) и реакционную смесь перемешивали в течение 30 минут. Добавляли хлорид цинка (0,5 М в THF, 9 мл) и обеспечивали нагревание реакционной смеси до комнатной температуры. К полученному добавляли раствор 2,2-диметилпропил-2-пиридазин-1-ий-1-илэтансульфоната (3,4 г) и иодида меди (2,5 г) в *N,N*-диметилформамиде (10 мл) и реакционную смесь перемешивали при комнатной температуре в течение ночи.

Реакционную смесь разделяли между EtOAc и водой и органический слой

концентрировали с получением 2,2-диметилпропил-2-(4-оксазол-4-ил-4Н-пиридазин-1-

ил)этансульфоната в виде темно-зеленой смолы. Данное вещество применяли без дополнительной очистки на следующей стадии.

Стадия 5. Получение 2,2-диметилпропил-2-(4-оксазол-4-илпиридазин-1-ий-1-ил)этансульфоната, 2,2,2-трифторацетата А-21



К раствору неочищенного 2,2-диметилпропил-2-(4-оксазол-4-ил-4Н-пиридазин-1-ил)этансульфоната (5,32 г) в тетрагидрофуране (160 мл) добавляли 2,3,5,6-тетрахлор-1,4-бензохинон (4 г) и реакционную смесь перемешивали в течение 2 часов при комнатной температуре. Реакционную смесь концентрировали, промывали этилацетатом и очищали посредством препаративной HPLC с обращенной фазой с получением 2,2-диметилпропил-2-(4-оксазол-4-илпиридазин-1-ий-1-ил)этансульфоната, 2,2,2-трифторацетата в виде коричневой смолы.

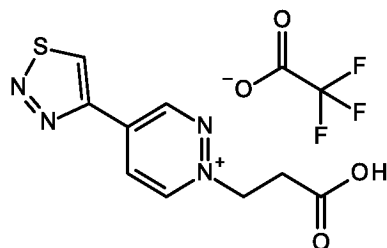
¹H ЯМР (400МГц, DMSO-d₆) 10,04 (d, 1H) 9,97 (d, 1H) 9,45 (s, 1H) 8,99-8,94 (m, 1H) 8,89 (d, 1H) 5,24 (s, 2H) 4,26 (t, 2H) 3,95 (s, 2H) 0,91 (s, 9H)

Стадия 6. Получение 2-(4-оксазол-4-илпиридазин-1-ий-1-ил)этансульфоната А-22

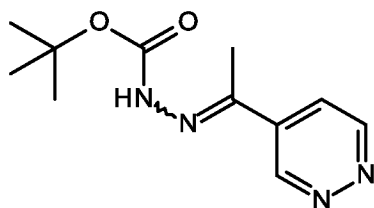
Смесь 2,2-диметилпропил-2-(4-оксазол-2-илпиридазин-1-ий-1-ил)этансульфоната 2,2,2-трифторацетата (0,2 г), трифторуксусной кислоты (3 мл) и анизола (0,6 мл) нагревали при 80°C в течение 1,5 часа. Реакционную смесь высушивали сублимацией и очищали посредством препаративной HPLC с обращенной фазой с получением 2-(4-оксазол-4-илпиридазин-1-ий-1-ил)этансульфоната в виде бледно-желтого твердого вещества.

¹H ЯМР (400МГц, D₂O) 9,70-9,77 (m, 1H) 9,58 (d, 1H) 8,88-8,97 (m, 1H) 8,63-8,70 (m, 1H) 8,35-8,42 (m, 1H) 5,04-5,18 (m, 2H) 3,53-3,71 (m, 2H)

Пример 24. Получение 3-[4-(тиадиазол-4-ил)пиридазин-1-ий-1-ил]пропановой кислоты 2,2,2-трифторацетата A139



Стадия 1. Получение *трет*-бутил-*N*-[(*E*)-1-пиридазин-4-илэтилиденамино]карбамата



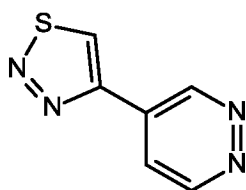
5

К раствору 1-пиридазин-4-илэтанона (0,3 г) в 1,4-диоксане (1,5 мл) добавляли *трет*-бутил-*N*-аминокарбамат (0,327 г) и реакционную смесь нагревали при 70°C в течение 90 минут. Реакционную смесь концентрировали с получением *трет*-бутил-*N*-[(*E*)-1-пиридазин-4-илэтилиденамино]карбамата, который применяли без

10

¹H ЯМР (400 МГц, CDCl₃) 9,59 (dd, 1H), 9,19 (dd, 1H), 8,00 (s, 1H), 7,77 (dd, 1H), 2,21 (s, 3H), 1,57 (s, 9H)

Стадия 2. Получение 4-пиридазин-4-илтиадиазола



15

Раствор *трет*-бутил-*N*-[(*E*)-1-пиридазин-4-илэтилиденамино]карбамата (0,25 г) в дихлорметане (4 мл) в атмосфере азота охлаждали до -78°C и по каплям добавляли тионилхлорид (0,386 мл). Обеспечивали медленное нагревание реакционной смеси до комнатной температуры. Реакционную смесь разбавляли водой и экстрагировали дихлорметаном (2 раза). Объединенные органические слои концентрировали и очищали посредством хроматографии на силикагеле с элюированием с помощью 0-100% этилацетата в изогексане с получением 4-пиридазин-4-илтиадиазола.

20

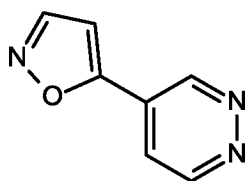
¹H ЯМР (400 МГц, CDCl₃) 10,18 (s, 1H), 9,66 (dd, 1H), 9,08 (dd, 1H), 7,57 (s, 1H)

Стадия 3. Получение 3-[4-(тиадиазол-4-ил)пиридазин-1-ий-1-ил]пропановой кислоты 2,2,2-трифторацетата A139

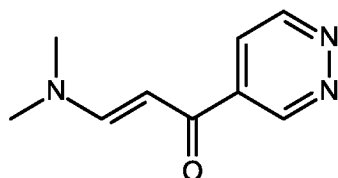
Смесь 4-пиридазин-4-илтиадиазола (0,08 г), воды (5 мл) и 3-бромпропановой кислоты (0,298 г) нагревали при 100°C в течение 2,5 часа. Реакционную смесь охлаждали, концентрировали и очищали посредством препаративной HPLC с обращенной фазой (трифторуксусная кислота присутствует в элюенте) с получением 3-[4-(тиадиазол-4-ил)пиридазин-1-ий-1-ил]пропановой кислоты 2,2,2-трифторацетата.

¹H ЯМР (400 МГц, CD₃OD) 10,26 (d, 1H), 10,23 (s, 1H), 9,97 (d, 1H), 9,24 (dd, 1H), 5,13 (t, 2H), 3,27 (t, 2H) (протон CO₂H отсутствует)

Пример 25. Получение 5-пиридазин-4-илизоксазола



Стадия 1. Получение (E)-3-(диметиламино)-1-пиридазин-4-илпроп-2-ен-1-она



К 1-пиридазин-4-илэтанону (0,230 г) добавляли 1,1-диметокси-*N,N*-диметилметанамин (0,275 мл) и смесь нагревали с обратным холодильником в течение 1 часа, охлаждали до комнатной температуры и обеспечивали ее оттаивание в течение ночи. Объединенные органические слои концентрировали и очищали посредством хроматографии на силикагеле с элюированием с помощью 0-50% ацетонитрила в дихлорметане с получением (E)-3-(диметиламино)-1-пиридазин-4-ил-проп-2-ен-1-она в виде оранжевого твердого вещества.

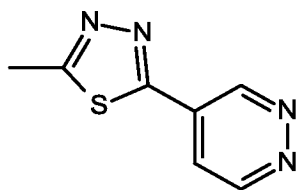
¹H ЯМР (400МГц, CDCl₃) 9,57 - 9,53 (m, 1H), 9,32 (dd, 1H), 7,92 (d, 1H), 7,84 (dd, 1H), 5,66 (d, 1H), 3,24 (s, 3H), 3,00 (s, 3H)

Стадия 2. Получение 5-пиридазин-4-илизоксазола

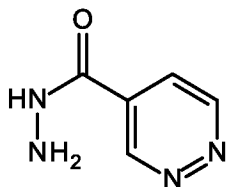
Смесь (Е)-3-(диметиламино)-1-пиридазин-4-илпроп-2-ен-1-она (0,05 г) и 4 М хлористоводородной кислоты в диоксане (1 мл) нагревали с обратным холодильником в течение 45 минут. Смесь охлаждали до комнатной температуры и добавляли гидрохлорид гидроксиламина (0,024 г) и затем нагревали с обратным холодильником в течение 12 часов. Реакционную смесь концентрировали, растворяли в воде (10 мл) и экстрагировали этилацетатом (3 x 30 мл). Объединенные органические слои высушивали над сульфатом натрия, концентрировали и очищали посредством хроматографии на силикагеле с элюированием с помощью 0-50% метанола в дихлорметане с получением 5-пиридазин-4-илизоксазола.

^1H ЯМР (400МГц, CD_3OD) 9,64-9,70 (m, 1H), 9,35 (d, 1H), 8,61 (d, 1H), 8,15 (d, 1H), 7,29 (d, 1H)

Пример 26. Получение 2-метил-5-пиридазин-4-ил-1,3,4-тиадиазола

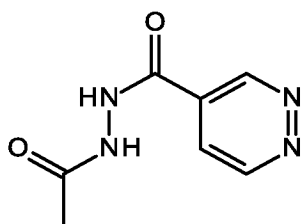


Стадия 1. Получение пиридазин-4-карбогидразида



К раствору метилпиридазин-4-карбоксилата (0,4 г) в метаноле (4,92 мл) добавляли гидрат гидразина (1,12 мл) и смесь нагревали с обратным холодильником в течение 26 часов. Реакционную смесь охлаждали до комнатной температуры и концентрировали с получением пиридазин-4-карбогидразида в виде коричневого твердого вещества.

^1H ЯМР (400МГц, CD_3OD) 9,52 - 9,48 (m, 1H), 9,36 (dd, 1H), 8,00 (dd, 1H) (протоны NH отсутствуют)

Стадия 2. Получение *N'*-ацетилпиридазин-4-карбогидразида

Смесь пиридазин-4-карбогидразида (2,3 г), уксусной кислоты (23 мл) и уксусного ангидрида (1,9 мл) нагревали при 100°C в течение 16 часов. Реакционную массу концентрировали и полученное твердое вещество промывали *трет*-бутилметилловым эфиром (2 x 20 мл) и этилацетатом (2 x 20 мл) и высушивали под вакуумом с получением *N'*-ацетилпиридазин-4-карбогидразида.

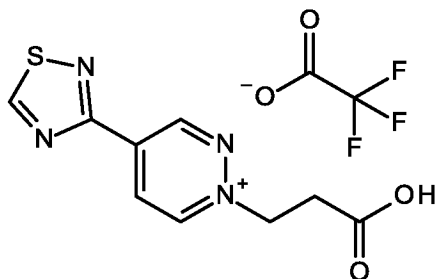
¹H ЯМР (400 МГц, DMSO-d₆) 10,87 (s, 1H), 10,12 (s, 1H), 9,54 (dd, 1H), 9,47 (dd, 1H), 8,02 (dd, 1H), 1,94 (s, 3H)

Стадия 3. Получение 2-метил-5-пиридазин-4-ил-1,3,4-тиадиазола

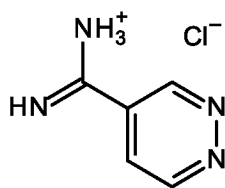
Во флакон для микроволновой обработки загружали *N'*-ацетилпиридазин-4-карбогидразид (0,1 г), 1,4-диоксан (1 мл), пентасульфид фосфора (0,123 г) и оксид алюминия (0,084 г) и нагревали при 140°C в течение 1 часа. Реакционную массу гасили в ледяной воде и экстрагировали этилацетатом. Органический слой высушивали над сульфатом натрия, концентрировали и очищали посредством хроматографии на силикагеле с элюированием с помощью 0-15% метанола в дихлорметане с получением 2-метил-5-пиридазин-4-ил-1,3,4-тиадиазола.

¹H ЯМР (400 МГц, DMSO-d₆) 9,76 (dd, 1H), 9,43 (dd, 1H), 8,18 (dd, 1H), 2,85 (s, 3H)

Пример 27. Получение 3-[4-(1,2,4-тиадиазол-3-ил)пиридазин-1-ий-1-ил]пропановой кислоты 2,2,2-трифторацетата A142



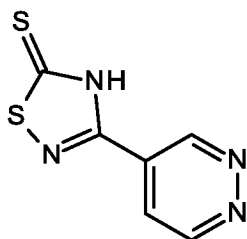
Стадия 1. Получение гидрохлорида пиридазин-4-карбоксамидина



К смеси пиридазин-4-карбонитрила (3,5 г) в метаноле (18 мл) добавляли метоксид натрия (25% в метаноле, 0,78 мл) при комнатной температуре и реакционную смесь перемешивали в течение 3 часов. К данной смеси добавляли хлорид аммония (2 г) и перемешивание продолжали при комнатной температуре в течение дополнительных 18 часов. Реакционную смесь концентрировали и полученный осадок промывали *трет*-бутилметиловым эфиром с получением гидрохлорида пиридазин-4-карбоксамидина в виде коричневого твердого вещества.

¹H ЯМР (400 МГц, DMSO-*d*₆) 9,58 - 9,60 (m, 2H), 8,12 - 8,14 (m, 1H)

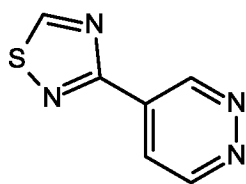
Стадия 2. Получение 3-пиридазин-4-ил-4Н-1,2,4-тиадиазол-5-тиона



К смеси гидрохлорида пиридазин-4-карбоксамидина (50 мг), дисульфида углерода (0,5 М в THF, 2 мл), серы (0,013 г) и метанола (0,5 мл) добавляли метоксид натрия (25% в метаноле, 0,144 мл) и реакционную смесь нагревали при 60°C в течение 5 часов. Реакционную смесь концентрировали и очищали посредством хроматографии на силикагеле с элюированием с помощью этилацетата в метаноле с получением 3-пиридазин-4-ил-4Н-1,2,4-тиадиазол-5-тиона в виде темно-коричневого твердого вещества.

¹H ЯМР (400 МГц, DMSO-*d*₆) 9,73 (s, 1H) 9,33 (dd, 1H) 8,12 (dd, 1H)

Стадия 3. Получение 3-пиридазин-4-ил-1,2,4-тиадиазола



Смесь 3-пиридазин-4-ил-4Н-1,2,4-тиадиазол-5-тиона (0,5 г) и уксусной кислоты (12,74 мл) охлаждали до 15°C и по каплям добавляли пероксид водорода (1,56 мл).

- 5 Смесь перемешивали при комнатной температуре в течение 3 часов, после чего добавляли дополнительное количество пероксида водорода (1,56 мл). После дополнительных 2 часов перемешивания реакционную смесь гасили раствором метабисульфита натрия, нейтрализовали и экстрагировали этилацетатом (3 x 50 мл). Объединенные органические фазы высушивали над безводным сульфатом натрия и
- 10 очищали посредством хроматографии на силикагеле с элюированием этилацетатом с получением 3-пиридазин-4-ил-1,2,4-тиадиазола.

¹H ЯМР (400 МГц, CDCl₃) 10,09 (dd, 1H), 10,01 (s, 1H), 9,41 (dd, 1H), 8,33 (dd, 1H)

- Стадия 4. Получение 3-[4-(1,2,4-тиадиазол-3-ил)пиридазин-1-ий-1-ил]пропановой
- 15 кислоты 2,2,2-трифторацетата A142

К раствору 3-пиридазин-4-ил-1,2,4-тиадиазола (0,2 г) в ацетонитриле (8 мл) добавляли 3-бромпропановую кислоту (0,224 г) и смесь нагревали с обратным холодильником в течение 30 часов. Реакционную смесь охлаждали, концентрировали и очищали посредством препаративной HPLC с обращенной фазой (трифторуксусная кислота

20 присутствует в элюенте) с получением 3-[4-(1,2,4-тиадиазол-3-ил)пиридазин-1-ий-1-ил]пропановой кислоты 2,2,2-трифторацетата.

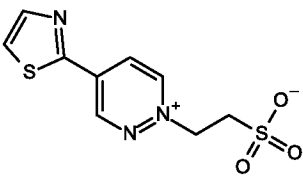
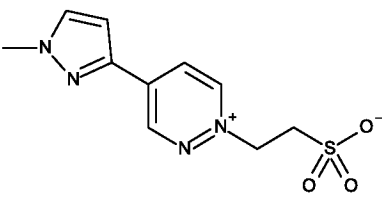
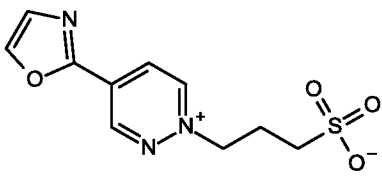
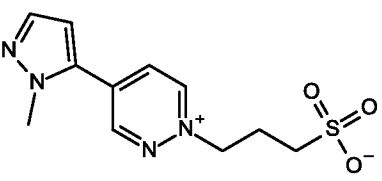
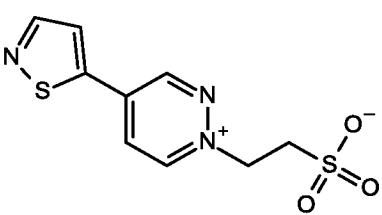
¹H ЯМР (400 МГц, D₂O) 10,35 (s, 1H), 10,19 (d, 1H), 9,90 (d, 1H), 9,18 (dd, 1H), 5,14 (t, 2H), 3,26 (t, 2H) (протон CO₂H отсутствует)

- 25 Дополнительные соединения в таблице А (ниже) получали посредством аналогичных процедур из соответствующих исходных материалов. Специалисту в данной области техники будет понятно, что соединения формулы (I) могут существовать в виде агрономически приемлемой соли, цвиттер-иона или агрономически приемлемой соли цвиттер-иона, как описано в данном документе ранее. При упоминании конкретный
- 30 противоион не считается ограничивающим, и соединение формулы (I) может быть образовано с любым подходящим противоионом.

ЯМР-спектры, приведенные в данном документе, регистрировали на Bruker AVANCE III HD, работающем при 400 МГц, оснащенном зондом Bruker SMART, если не указано иное. Химические сдвиги выражали в ppm для слабополюного сдвига от TMS, либо с TMS, либо с сигналами остаточного растворителя в качестве внутреннего стандарта. Следующие мультиплетности применяют для описания пиков: s = синглет, d = дублет, t = триплет, dd = дублет дублетов, dt = дублет триплетов, q = квартет, quin = квинтет, m = мультиплет. Дополнительно используют br. для описания широкого сигнала и используют каж. для описания кажущейся мультиплетности.

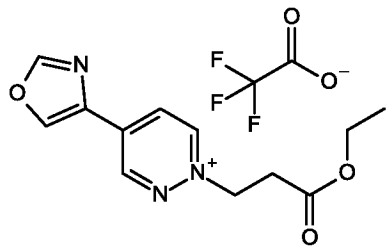
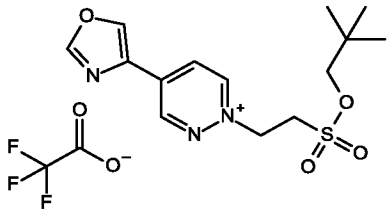
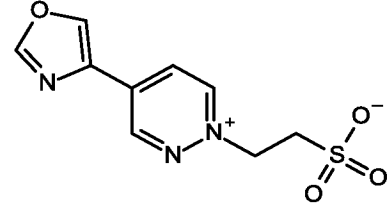
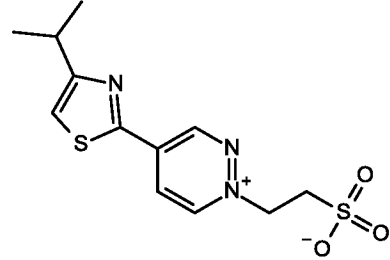
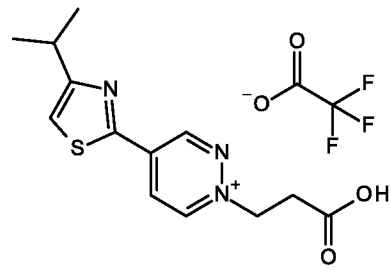
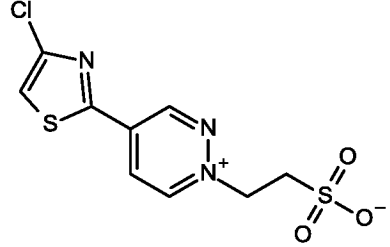
10

Таблица А. Физические данные для соединений по настоящему изобретению

Номер соединения	Структура	¹ H ЯМР
A1		(400МГц, D ₂ O) 9,84-9,94 (m, 1H) 9,63-9,72 (m, 1H) 8,82 (dd, 1H) 8,14-8,25 (m, 1H) 8,08 (d, 1H) 5,09-5,19 (m, 2H) 3,54-3,68 (m, 2H)
A2		(400 МГц, D ₂ O) 9,67 (d, 1H) 9,45 (d, 1H) 8,55 (dd, 1H) 7,71 (d, 1H) 7,09 (d, 1H) 5,10-5,01 (m, 2H) 3,94 (s, 3H) 3,64-3,54 (m, 2H)
A3		(400 МГц, D ₂ O) 9,83-9,95 (m, 1H) 9,73 (d, 1H) 8,86 (dd, 1H) 8,08-8,31 (m, 1H) 7,49-7,71 (m, 1H) 4,85-5,08 (m, 2H) 2,85-3,16 (m, 2H) 2,50 (quin, 2H)
A4		(400 МГц, D ₂ O) 9,52-9,69 (m, 2H) 8,52-8,67 (m, 1H) 7,59-7,70 (m, 1H) 7,03 (d, 1H) 4,92 (t, 2H) 3,93-4,15 (m, 3H) 2,89-3,02 (m, 2H) 2,39-2,62 (m, 2H)
A5		(400 МГц, D ₂ O) 9,73-9,79 (m, 1H) 9,62-9,74 (m, 1H) 8,72-8,81 (m, 1H) 8,58-8,69 (m, 1H) 8,04-8,23 (m, 1H) 5,17 (t, 2H) 3,53-3,77 (m, 2H)

Номер соединения	Структура	¹ H ЯМР
A6		(400 МГц, D ₂ O) 9,74-9,92 (m, 1H) 9,54-9,69 (m, 1H) 8,64-8,85 (m, 1H) 8,41-8,60 (m, 1H) 5,09-5,24 (m, 2H) 4,18-4,40 (m, 3H) 3,56-3,76 (m, 2H)
A7		(400 МГц, D ₂ O) 10,06-10,03 (m, 1H) 9,95-9,92 (m, 1H) 9,24-9,21 (m, 1H) 9,11-9,07 (m, 1H) 5,06-5,01 (m, 2H) 3,03-2,94 (m, 2H) 2,60-2,47 (m, 2H) [выделенный в виде смеси 1:1 изомеров с 10,50-10,47 (m, 1H) 9,70-9,66 (m, 1H) 9,20-9,17 (m, 1H) 9,03-8,99 (m, 1H) 5,12-5,06 (m, 1H) 3,03-2,94 (m, 2H) 2,60-2,47 (m, 2H)]
A8		(400МГц, DMSO-d ₆) 10,32-10,28 (m, 1H) 10,18-10,12 (m, 1H) 9,55-9,54 (m, 1H) 9,43-9,38 (m, 1H) 5,26-5,14 (m, 2H) 4,43-4,33 (m, 2H) [выделенный в виде смеси 1:1 изомеров с 10,72 (s, 1H) 9,95-9,90 (m, 1H) 9,53-9,52 (m, 1H) 9,27-9,22 (m, 1H) 5,26-5,14 (m, 2H) 4,43-4,33 (m, 2H)]
A9		(400 МГц, D ₂ O) 10,00-10,06 (m, 1H) 9,91 (d, 1H) 9,07 (dd, 1H) 8,94-9,13 (m, 1H) 5,17-5,28 (m, 2H) 3,62-3,71 (m, 2H)
A10		(400 МГц, D ₂ O) 9,92-9,97 (m, 1H) 9,83-9,90 (m, 1H) 8,96-9,01 (m, 1H) 5,15-5,27 (m, 2H) 3,56-3,70 (m, 2H) 2,71 (s, 3H)
A11		(400 МГц, D ₂ O) 10,09 (d, 1H) 9,89 (d, 1H) 8,98-9,15 (m, 1H) 5,10-5,39 (m, 2H) 4,51 (s, 3H) 3,49-3,75 (m, 2H) (один протон SO ₃ H отсутствует)
A12		(400 МГц, D ₂ O) 10,01-10,08 (m, 2H) 9,10 (d, 1H) 5,30-5,38 (m, 2H) 4,40 (s, 3H) 3,69-3,77 (m, 2H) (один протон SO ₃ H отсутствует)

Номер соединения	Структура	¹ H ЯМР
A13		(400 МГц, D ₂ O) 9,86 (d, 1H) 9,66 (d, 1H) 8,78 (dd, 1H) 7,72 (s, 1H) 5,16 (t, 2H) 3,66 (t, 2H) 2,52 (s, 3H)
A14		(400 МГц, D ₂ O) 9,74-9,78 (m, 1H) 9,66 (d, 1H) 8,68 (dd, 1H) 5,11-5,18 (m, 2H) 3,61-3,68 (m, 2H) 2,40 (s, 3H) 2,18 (s, 3H)
A15		(400 МГц, D ₂ O) 9,82 (d, 1H) 9,74 (d, 1H) 8,77 (dd, 1H) 7,29 (d, 1H) 5,06 (t, 2H) 3,23 (t, 2H) 2,47 (d, 3H) (один протон CO ₂ H отсутствует)
A16		(400 МГц, D ₂ O) 9,88-9,92 (m, 2H) 8,92 (dd, 1H) 8,21 (s, 1H) 5,20-5,23 (m, 2H) 4,17 (s, 3H) 3,63-3,75 (m, 2H)
A17		(400 МГц, D ₂ O) 9,76 (s, 1H) 9,57 (d, 1H) 8,65 (d, 1H) 5,13 (t, 2H) 3,66 (t, 2H) 2,51 (s, 3H) 2,42 ppm (s, 3H)
A18		(400 МГц, D ₂ O) 9,96 (m, 1H) 9,77 (d, 1H) 8,93 (dd, 1H) 8,60 (s, 1H) 5,16 (t, 2H) 3,64 (t, 2H)
A19		(400 МГц, D ₂ O) 10,01-9,93 (m, 1H) 9,88-9,78 (m, 1H) 8,97-8,90 (m, 1H) 8,33-8,26 (m, 1H) 7,69-7,62 (m, 1H) 5,29-5,19 (m, 2H) 3,75-3,65 (m, 2H)

Номер соединения	Структура	¹ H ЯМР
A20		(400 МГц, CD ₃ OD) 9,89 (s, 1H) 9,78 (d, 1H) 9,16 (s, 1H) 8,83 (dd, 1H) 8,52 (s, 1H) 5,07 (t, 2H) 4,14 (q, 2H) 3,24 (t, 2H) 1,23 (t, 3H)
A21		(400 МГц, DMSO-d ₆) 10,04 (d, 1H) 9,97 (d, 1H) 9,45 (s, 1H) 8,99-8,94 (m, 1H) 8,89 (d, 1H) 5,24 (s, 2H) 4,26 (t, 2H) 3,95 (s, 2H) 0,91 (s, 9H)
A22		(400 МГц, D ₂ O) 9,70-9,77 (m, 1H) 9,58 (d, 1H) 8,88-8,97 (m, 1H) 8,63-8,70 (m, 1H) 8,35-8,42 (m, 1H) 5,04-5,18 (m, 2H) 3,53-3,71 (m, 2H)
A23		(400 МГц, D ₂ O) 9,84 (m, 1H) 9,60 (m, 1H) 8,75 (br d, 1H) 7,71 (br s, 1H) 5,11 (br s, 2H) 3,61 (br s, 2H) 3,16 (br s, 1H) 1,25 (d, 6H)
A24		(400 МГц, CDCl ₃) 9,86 (s, 1H) 9,67 (m, 1H) 8,79 (m, 1H) 7,75 (m, 1H) 5,01 (m, 2H) 3,17 (br t, 3H) 1,31 (d, 6H) (один протон CO ₂ H отсутствует)
A25		(400 МГц, D ₂ O) 9,88 (d, 1H) 9,73 (d, 1H) 8,83 (dd, 1H) 7,96 (s, 1H) 5,18 (t, 2H) 3,66 (t, 2H)

Номер соединения	Структура	^1H ЯМР
A26		(400 МГц, D ₂ O) 9,83 (s, 1H) 9,64 (d, 1H) 8,75 (dd, 1H) 7,11 (s, 1H) 5,12-5,18 (m, 2H) 3,98 (s, 3H) 3,65-3,69 (m, 2H)
A27		(400 МГц, D ₂ O) 9,94 (d, 1H) 9,86-9,90 (m, 1H) 8,93 (dd, 1H) 8,23 (s, 1H) 5,16 (t, 2H) 4,18 (s, 3H) 3,26 (t, 2H) (один протон CO ₂ H отсутствует)
A28		(400 МГц, D ₂ O) 10,06 (d, 1H) 9,90 (d, 1H) 9,09 (d, 1H) 5,13 (dd, 2H) 4,51 (br s, 3H) 3,26 (dd, 2H) (один протон CO ₂ H отсутствует)
A29		(400 МГц, D ₂ O) 9,76-9,70 (m, 1H) 9,54 (d, 1H) 8,64 (dd, 1H) 7,57 (s, 1H) 5,09 (t, 2H) 4,05 (s, 3H) 3,59 (t, 2H)
A30		(400 МГц, CD ₃ OD) 9,91-9,86 (m, 1H) 9,85-9,80 (m, 1H) 8,83 (dd, 1H) 7,54 (s, 1H) 5,27-5,20 (m, 2H) 4,27 (s, 3H) 3,60-3,53 (m, 2H)
A31		(400 МГц, D ₂ O) 9,71-9,90 (m, 2H) 8,67-8,81 (m, 1H) 7,59-7,69 (m, 1H) 7,54 (d, 1H) 5,07 (t, 2H) 3,95-4,07 (m, 3H) 3,13-3,31 (m, 2H) (один протон CO ₂ H отсутствует)
A32		(400 МГц, D ₂ O) 9,84-9,92 (m, 1H) 9,74-9,82 (m, 1H) 8,77-8,90 (m, 1H) 8,14-8,28 (m, 1H) 7,51-7,62 (m, 1H) 4,94-5,15 (m, 2H) 3,10-3,26 (m, 2H) (один протон CO ₂ H отсутствует)

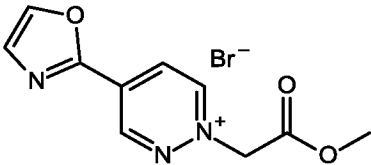
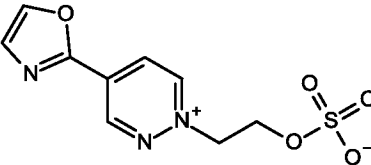
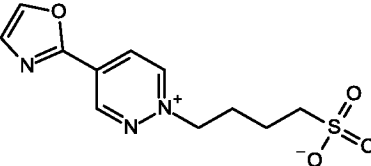
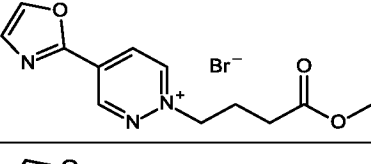
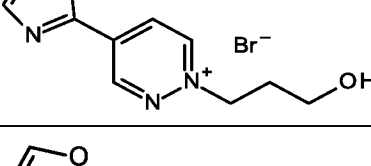
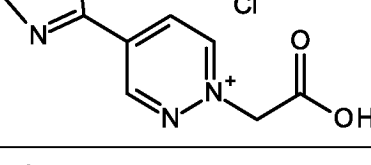
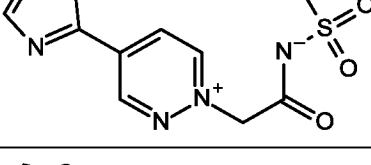
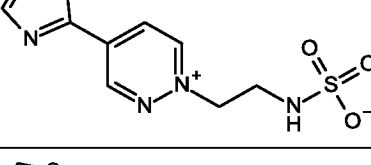
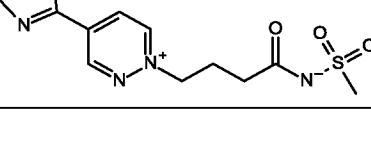
Номер соединения	Структура	¹ H ЯМР
A33		(400 МГц, D ₂ O) 9,71 (d, 1H) 9,64 (s, 1H) 8,65 (s, 1H) 7,47 (s, 1H) 5,04 (t, 2H) 3,99 (s, 3H) 3,20 (t, 2H) (один протон CO ₂ H отсутствует)
A34		(400 МГц, D ₂ O) 9,69 (d, 1H) 9,67 (d, 1H) 8,65 (dd, 1H) 7,48 (s, 1H) 5,16 (t, 2H) 3,99 (s, 3H) 3,63 (t, 2H)
A35		(400 МГц, D ₂ O) 9,62 (m, 2H) 9,52 (s, 1H) 8,58 (dd, 1H) 5,14 (t, 2H) 3,63 (t, 2H) 2,61 (s, 3H)
A36		(400 МГц, D ₂ O) 9,63 (d, 1H) 9,38 (d, 1H) 8,47 (dd, 1H) 8,17 (dd, 1H) 8,04 (dd, 1H) 7,36 (dd, 1H) 5,05 (t, 2H) 3,63 ppm (t, 2H)
A37		(400 МГц, D ₂ O) 9,87 (d, 1H) 9,71 (d, 1H) 8,84 (d, 1H) 8,64 (s, 1H) 5,02 (t, 2H) 3,18 (t, 2H) (один протон NH и один протон CO ₂ H отсутствуют)
A38		(400 МГц, D ₂ O) 10,00 (d, 1H) 9,77 (d, 1H) 8,94 (dd, 1H) 8,73 (s, 1H) 5,22 (t, 2H) 3,69 (t, 2H) (один протон NH отсутствует)

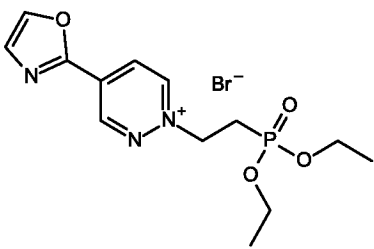
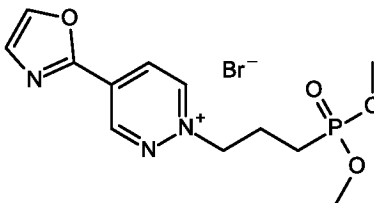
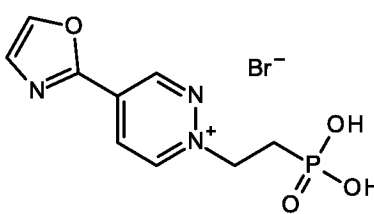
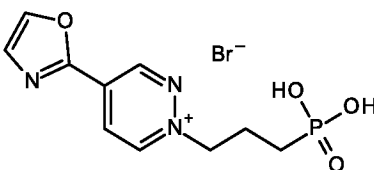
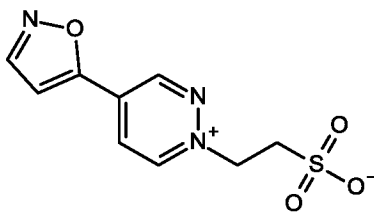
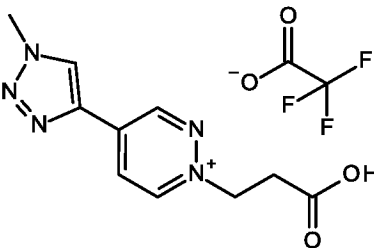
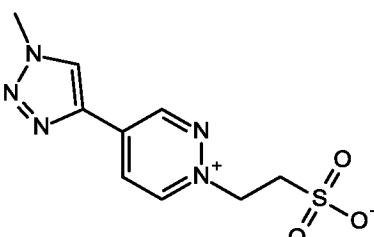
Номер соединения	Структура	^1H ЯМР
A39		(400 МГц, D ₂ O) 9,96 (d, 1H) 9,76 (d, 1H) 8,90 (dd, 1H) 8,62 (s, 1H) 5,22 (t, 2H) 4,06 (s, 3H) 3,69 (t, 2H)
A40		(400 МГц, D ₂ O) 9,86 (d, 1H) 9,77 (d, 1H) 8,82 (dd, 1H) 8,00 (s, 1H) 5,20 (t, 2H) 3,67 (t, 2H) 2,27 (s, 3H)
A41		(400 МГц, D ₂ O) 9,61 (d, 1H) 9,41 (m, 1H) 8,47 (m, 1H) 8,16 (m, 1H) 8,05 (d, 1H) 7,37 (m, 1H) 5,01-4,89 (m, 2H) 3,23-3,12 (m, 2H) (один протон CO ₂ H отсутствует)
A42		(400 МГц, D ₂ O) 9,55 (d, 1H) 9,40 (d, 1H) 8,53 (d, 1H) 8,42 (dd, 1H) 7,70 (s, 1H) 7,05 (dd, 1H) 5,04 (m, 2H) 3,60 (m, 2H)
A43		(400 МГц, D ₂ O) 9,57 (d, 1H) 9,46 (d, 1H) 8,56 (s, 1H) 8,47 (dd, 1H) 7,74 (m, 1H) 7,09 (dd, 1H) 4,97 (t, 2H) 3,22 (t, 2H) (один протон CO ₂ H отсутствует)
A44		(400 МГц, D ₂ O) 9,90 (d, 1H) 9,73 (d, 1H) 8,81 (dd, 1H) 8,13 (s, 1H) 5,17-5,22 (m, 2H) 3,66-3,71 (m, 2H)
A45		(400 МГц, D ₂ O) 9,82 (d, 1H) 9,63 (d, 1H) 8,58 (dd, 1H) 5,10-5,19 (m, 2H) 3,62-3,69 (m, 2H) 3,08 (s, 3H) (один протон NH отсутствует)

Номер соединения	Структура	^1H ЯМР
A46		(400 МГц, D ₂ O) 9,89 (s, 1H) 9,77 (d, 1H) 8,86 (dd, 1H) 7,99 (s, 1H) 5,09 (t, 2H) 3,25 (t, 2H) (один протон CO ₂ H отсутствует)
A47		(400 МГц, D ₂ O) 9,80 (d, 1H) 9,67 (d, 1H) 8,60 (dd, 1H) 5,04 (t, 2H) 3,24 (t, 2H) (два протона NH и один протон CO ₂ H отсутствуют)
A48		(400 МГц, D ₂ O) 9,76-9,82 (m, 1H) 9,65-9,72 (m, 1H) 8,68-8,79 (m, 1H) 8,37-8,43 (m, 1H) 5,02-5,13 (m, 2H) 4,22-4,34 (m, 3H) 3,18-3,25 (m, 2H) (один протон CO ₂ H отсутствует)
A49		(400 МГц, D ₂ O) 9,71-9,96 (m, 2H) 8,76-8,98 (m, 1H) 8,43-8,61 (m, 1H) 5,19-5,42 (m, 2H) 4,29-4,51 (m, 3H) 3,63-3,85 (m, 2H)
A50		(400 МГц, D ₂ O) 9,95 (d, 1H) 9,90-9,92 (d, 1H) 8,92-8,96 (m, 1H) 8,89 (s, 1H) 5,23-5,35 (m, 2H) 4,04 (s, 3H) 3,67-3,73 (m, 2H)
A51		(400 МГц, D ₂ O) 9,92 (d, 1H) 9,77 (d, 1H) 8,88 (dd, 1H) 8,61 (s, 1H) 5,10 (t, 2H) 4,05 (s, 3H) 3,26 (t, 2H) (один протон CO ₂ H отсутствует)
A52		(400 МГц, D ₂ O) 9,56 (d, 1H) 9,40 (d, 1H) 8,41 (dd, 1H) 7,98 (d, 1H) 7,73 (d, 1H) 6,82 (dd, 1H) 4,93 (t, 2H) 3,18 (t, 2H) (один протон CO ₂ H отсутствует)

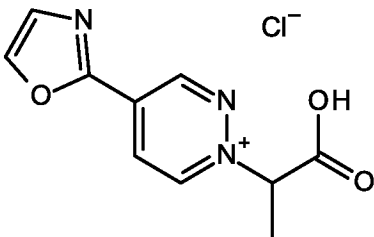
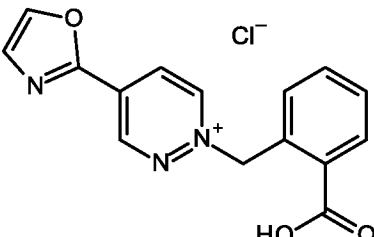
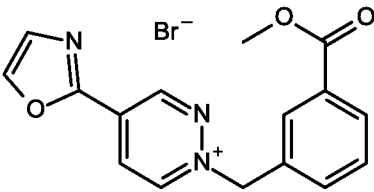
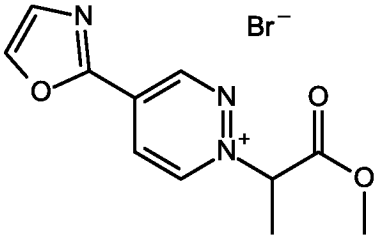
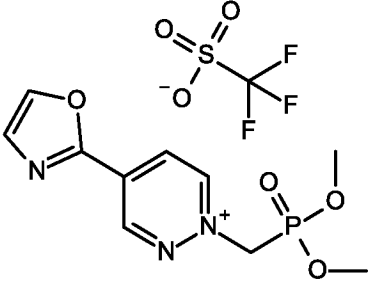
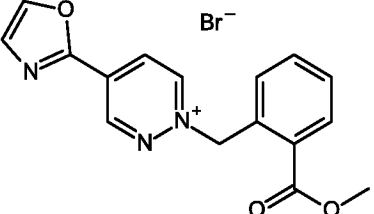
Номер соединения	Структура	¹ H ЯМР
A53		(400 МГц, D ₂ O) 9,58 (d, 1H) 9,38 (d, 1H) 8,41 (dd, 1H) 7,98 (d, 1H) 7,75 (d, 1H) 6,82 (dd, 1H) 5,02-5,07 (m, 2H) 3,60-3,64 (m, 2H)
A54		(400 МГц, D ₂ O) 9,73 (dd, 1H) 9,59 (dd, 1H) 8,61 (dd, 1H) 5,20 (t, 2H) 3,67 (t, 2H) 2,44 (s, 3H) 2,35 (s, 3H)
A55		(400 МГц, D ₂ O) 9,85 (d, 1H) 9,80 (d, 1H) 8,83 (dd, 1H) 8,01 (s, 1H) 5,10 (t, 2H) 3,26 (t, 2H) 2,28 (s, 3H) (один протон CO ₂ H отсутствует)
A56		(400 МГц, D ₂ O) 9,99 (d, 1H) 9,95 (d, 1H) 9,02 (dd, 1H) 8,80 (s, 1H) 5,15 (t, 2H) 3,26 (t, 2H) (один протон CO ₂ H отсутствует)
A57		(400 МГц, D ₂ O) 10,03 (d, 1H) 9,95 (d, 1H) 9,04 (dd, 1H) 8,81 (s, 1H) 5,29 (t, 2H) 3,72 (t, 2H)
A58		(400 МГц, D ₂ O) 9,76 (d, 1H) 9,58 (d, 1H) 8,61 (dd, 1H) 5,09 (t, 2H) 3,24 (t, 2H) 2,45 (s, 3H) 2,35 (s, 3H) (один протон CO ₂ H отсутствует)

Номер соединения	Структура	¹ H ЯМР
A59		(400 МГц, D ₂ O) 9,92-9,86 (m, 1H) 9,80-9,71 (m, 1H) 8,89 (dd, 1H) 8,86 (d, 1H) 7,22 (d, 1H) 4,98 (t, 2H) 2,96 (t, 2H) 2,51 (quin, 2H)
A60		(400 МГц, D ₂ O) 9,87 (s, 1H) 9,80 (d, 1H) 9,61 (d, 1H) 9,19 (s, 1H) 8,74 (dd, 1H) 5,12-5,17 (m, 2H) 3,63-3,68 (m, 2H)
A61		(400 МГц, D ₂ O) 9,91 (d, 1H) 9,62 (d, 1H) 9,21 (d, 1H) 8,79-8,85 (m, 2H) 5,16 (t, 2H) 3,67 (t, 2H)
A62		(400 МГц, D ₂ O) 9,87 (s, 1H) 9,79 (d, 1H) 9,64 (d, 1H) 9,19 (s, 1H) 8,74 (dd, 1H) 5,04 (t, 2H) 3,24 (t, 2H) (один протон CO ₂ H отсутствует)
A63		(400 МГц, D ₂ O) 9,67 (d, 1H) 9,48 (d, 1H) 8,52-8,58 (m, 2H) 7,75 (d, 1H) 7,68 (dd, 1H) 4,97 (t, 2H) 3,20 (t, 2H) (один протон CO ₂ H отсутствует)
A64		(400 МГц, D ₂ O) 9,91-9,87 (m, 1H) 9,82-9,77 (m, 1H) 8,89 (dd, 1H) 8,85 (d, 1H) 7,22 (d, 1H) 5,19 (t, 2H) 3,65 (t, 2H)
A65		(400 МГц, D ₂ O) 9,89 (d, 1H), 9,70 (d, 1H), 8,65-8,68 (m, 1H), 5,22 (t, 2H), 3,67-3,75 ppm (m, 2H) (протоны NH отсутствуют)

Номер соединения	Структура	^1H ЯМР
A66		(400 МГц, D ₂ O) 9,92 (s, 1H) 9,76 (d, 1H) 8,94-8,98 (m, 1H) 8,26 (s, 1H) 7,62 (s, 1H) 5,78 (s, 3H) 3,78 (s, 2H)
A67		(400 МГц, D ₂ O) 9,90 (s, 1H) 9,72 (d, 1H) 8,86-8,90 (m, 1H) 8,22 (s, 1H) 7,58 (s, 1H) 5,06-5,12 (m, 2H) 4,52-4,58 (m, 2H)
A68		(400 МГц, D ₂ O) 9,88 (s, 1H) 9,71 (d, 1H) 8,84-8,88 (m, 1H) 8,20 (s, 1H) 7,56 (s, 1H) 4,80-4,88 (m, 2H) 2,86-2,92 (m, 2H) 2,14-2,24 (m, 2H) 1,70-1,78 (m, 2H)
A69		(400 МГц, D ₂ O) 9,88 (s, 1H) 9,74 (d, 1H) 8,84-8,90 (m, 1H) 8,23 (s, 1H) 7,58 (s, 1H) 4,82-4,88 (m, 2H) 3,59 (s, 3H) 2,46-2,54 (m, 2H) 2,30-2,40 (m, 2H)
A70		(400 МГц, D ₂ O) 9,88 (s, 1H) 9,74 (d, 1H) 8,84-8,88 (m, 1H) 8,21 (s, 1H) 7,58 (s, 1H) 4,88-4,94 (m, 2H) 3,60-3,68 (m, 2H) 2,22-2,31 (m, 2H) (один протон OH отсутствует)
A71		(400 МГц, D ₂ O) 9,86 (d, 1H) 9,66 (d, 1H) 8,90 (dd, 1H) 8,21 (s, 1H) 7,57 (s, 1H) 5,50 (s, 2H) (один протон CO2H отсутствует)
A72		(400 МГц, D ₂ O) 9,86 (d, 1H) 9,66 (dd, 1H) 8,90 (dd, 1H) 8,22 (s, 1H) 7,63-7,50 (m, 1H) 5,51-5,44 (m, 2H) 2,98-2,94 (m, 3H)
A73		(400 МГц, D ₂ O) 9,94 (d, 1H) 9,82 (d, 1H) 8,93 (dd, 1H) 8,23 (s, 1H) 7,59 (s, 1H) 5,22-5,14 (m, 2H) 3,79-3,73 (m, 2H) (один протон NH отсутствует)
A74		(400 МГц, D ₂ O) 9,87 (d, 1H) 9,77-9,71 (m, 1H) 8,86 (dd, 1H) 8,21 (s, 1H) 7,57 (s, 1H) 4,90-4,82 (m, 2H) 3,17 (s, 3H) 2,59-2,51 (m, 2H) 2,42-2,32 (m, 2H)

Номер соединения	Структура	¹ H ЯМР
A75		(400 МГц, D ₂ O) 9,97-9,88 (m, 1H) 9,78 (d, 1H) 8,90 (dd, 1H) 8,23 (d, 1H) 7,59 (d, 1H) 5,14-5,00 (m, 2H) 4,05 (qd, 4H) 2,77 (td, 2H) 1,23-1,12 (m, 6H)
A76		(400 МГц, D ₂ O) 9,89 (d, 1H) 9,71 (d, 1H) 8,87 (dd, 1H) 8,21 (d, 1H) 7,58 (d, 1H) 4,90-4,83 (m, 2H) 3,69 (s, 3H) 3,66 (s, 3H) 2,40-2,26 (m, 2H) 2,05-1,93 (m, 2H)
A77		(400 МГц, D ₂ O) 9,87-9,83 (m, 1H) 9,74-9,69 (m, 1H) 8,85-8,80 (m, 1H) 8,20-8,17 (m, 1H) 7,57-7,53 (m, 1H) 5,00-4,90 (m, 2H) 2,42-2,31 (m, 2H) (два протона OH отсутствуют)
A78		(400 МГц, D ₂ O) 9,87 (d, 1H) 9,72 (d, 1H) 8,85 (dd, 1H) 8,20 (s, 1H) 7,56 (s, 1H) 4,86 (br t, 2H) 2,35-2,21 (m, 2H) 1,74-1,59 (m, 2H) (два протона OH отсутствуют)
A79		(400 МГц, D ₂ O) 9,92 (d, 1H) 9,85 (d, 1H) 8,91 (dd, 1H) 8,74 (d, 1H) 7,59 (d, 1H) 5,24-5,28 (m, 2H) 3,70-3,74 (m, 2H)
A80		(400 МГц, D ₂ O) 9,83 (d, 1H), 9,66 (d, 1H), 8,87 (s, 1H), 8,78 (dd, 1H), 5,06 (t, 2H), 4,22 (s, 3H), 3,25 (t, 2H) (протон CO ₂ H отсутствует)
A81		(400 МГц, D ₂ O) 9,87 (d, 1H), 9,66 (d, 1H), 8,90 (s, 1H), 8,80 (dd, 1H), 5,19 (m, 2H), 4,24 (s, 3H), 3,70 (m, 2H)

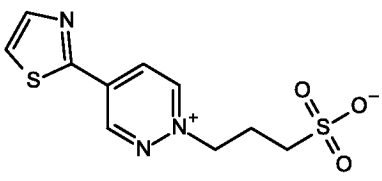
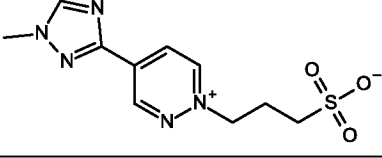
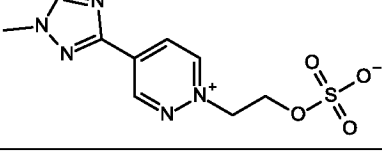
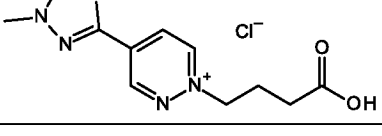
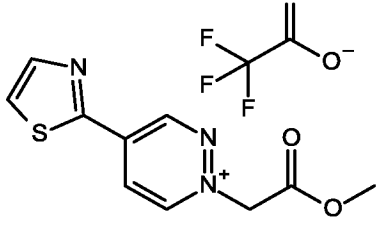
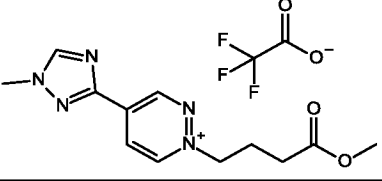
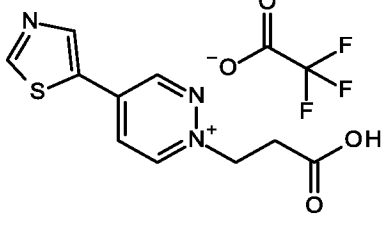
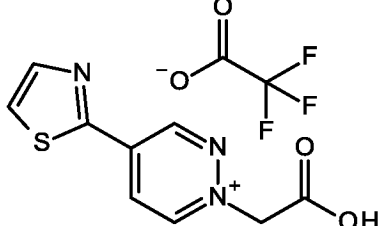
Номер соединения	Структура	^1H ЯМР
A82		(400 МГц, D ₂ O) 9,87 (d, 1H), 9,74 (d, 1H), 9,09 (s, 1H), 8,81 (dd, 1H), 8,36 (s, 1H), 5,14 (t, 2H), 4,13 (s, 3H), 3,29 (t, 2H) (протон CO ₂ H отсутствует)
A83		(400 МГц, D ₂ O) 9,89 (d, 1H) 9,63 (d, 1H) 8,84 (dd, 1H) 8,23-8,18 (m, 1H) 7,57 (s, 1H) 5,18-5,08 (m, 1H) 3,53-3,33 (m, 2H) 1,64 (d, 3H) (один протон NH отсутствует)
A84		(400 МГц, D ₂ O) 9,93-9,88 (m, 1H) 9,70-9,66 (m, 1H) 8,92-8,86 (m, 1H) 8,24-8,21 (m, 1H) 7,60-7,57 (m, 1H) 5,16-5,07 (m, 1H) 4,88-4,78 (m, 2H) 3,25-3,15 (m, 2H) (один протон OH отсутствует)
A85		(400 МГц, D ₂ O) 9,92-9,87 (m, 1H) 9,78-9,71 (m, 1H) 8,91-8,84 (m, 1H) 8,22 (s, 1H) 7,58 (d, 1H) 5,00-4,90 (m, 2H) 3,86-3,73 (m, 2H) 2,45-2,33 (m, 2H) 1,13-1,07 (m, 3H) (один протон OH отсутствует)
A86		(400 МГц, D ₂ O) 9,88 - 9,83 (m, 1H), 9,73 - 9,67 (m, 1H), 8,88 - 8,80 (m, 1H), 8,19 (s, 1H), 7,55 (s, 1H), 4,88 - 4,78 (m, 2H), 3,46 (d, J=10,5 Гц, 3H), 2,35 - 2,17 (m, 2H), 1,74 - 1,57 (m, 2H) (один протон OH отсутствует)
A87		(400 МГц, D ₂ O) 9,90 (d, 1H) 9,68 (dd, 1H) 8,92 (dd, 1H) 8,56 (s, 1H) 5,75 (s, 2H) 4,00 (s, 3H) 3,76 (s, 3H)
A88		(400 МГц, D ₂ O) 9,84 (d, 1H) 9,66 (d, 1H) 8,86-8,80 (m, 1H) 8,19 (s, 1H) 7,55 (s, 1H) 4,95-4,76 (m, 2H) 3,18-3,06 (m, 1H) 1,18 (d, 3H) (один протон CO ₂ H отсутствует)
A89		(400 МГц, D ₂ O) 9,87-9,82 (m, 1H) 9,65-9,58 (m, 1H) 8,88-8,81 (m, 1H) 8,20 (s, 1H) 7,57 (s, 1H) 4,96-4,88 (m, 1H) 4,58-4,49 (m, 1H) 3,87-3,74 (m, 1H) 1,31 (d, 3H) (один протон NH отсутствует)

Номер соединения	Структура	^1H ЯМР
A90		(400 МГц, D ₂ O) 9,92-9,89 (m, 1H) 9,78-9,73 (m, 1H) 8,94-8,89 (m, 1H) 8,26-8,24 (m, 1H) 7,62-7,60 (m, 1H) 5,77 (q, 1H) 1,91 (d, 3H) (один протон CO ₂ H отсутствует)
A91		(400 МГц, D ₂ O) 9,74 (d, 1H) 9,63 (d, 1H) 8,79 (dd, 1H) 8,18 (s, 1H) 8,03 (dd, 1H) 7,68-7,53 (m, 4H) 6,22 (s, 2H) (один протон CO ₂ H отсутствует)
A92		(400 МГц, DMSO-d ₆) 10,21 (d, 1H) 10,06 (d, 1H) 9,11 (dd, 1H) 8,72 (s, 1H) 8,24 (s, 1H) 8,02 (d, 1H) 7,88-7,83 (m, 2H) 7,63 (t, 1H) 6,17 (s, 2H) 3,87 (s, 3H)
A93		(400 МГц, D ₂ O) 9,95-9,88 (m, 1H) 9,84-9,75 (m, 1H) 9,00-8,89 (m, 1H) 8,24 (s, 1H) 7,60 (s, 1H) 6,04-5,92 (m, 1H) 3,73 (s, 3H) 1,93 (br d, 3H)
A94		(400 МГц, D ₂ O) 9,93 (d, 1H) 9,76 (d, 1H) 8,97-8,91 (m, 1H) 8,25 (s, 1H) 7,61 (s, 1H) 5,62-5,53 (m, 2H) 3,86-3,80 (m, 6H)
A95		(400 МГц, DMSO-d ₆) 10,10-10,04 (m, 1H) 10,03-9,99 (m, 1H) 9,09 (dd, 1H) 8,73 (s, 1H) 8,15-7,97 (m, 1H) 7,85 (s, 1H) 7,79-7,70 (m, 1H) 7,70-7,56 (m, 2H) 6,39 (s, 2H) 3,82 (s, 3H)

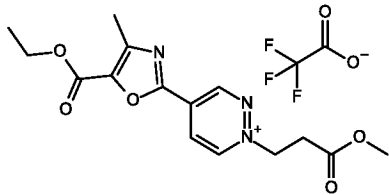
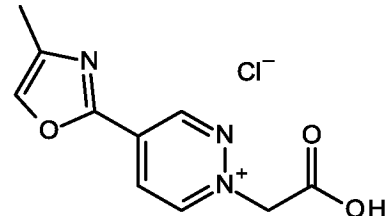
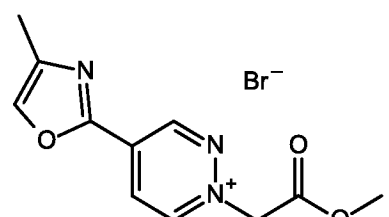
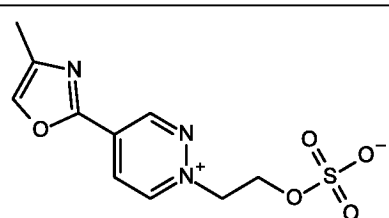
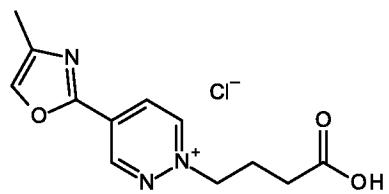
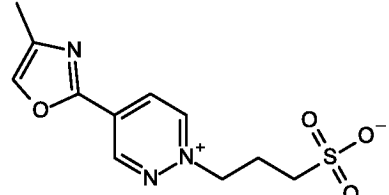
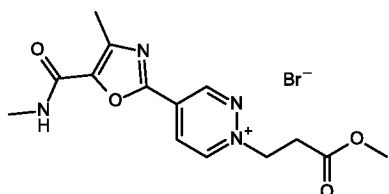
Номер соединения	Структура	¹ H ЯМР
A96		(400 МГц, D ₂ O) 9,87 (m, 2H), 8,89 (m, 1H), 8,74 (m, 1H), 7,58 (m, 1H), 5,13 (m, 2H), 3,32 (m, 2H) (протон CO ₂ H отсутствует)
A97		(400 МГц, D ₂ O) 10,01 (s, 1H), 9,77 (br d, 1H), 9,16 (d, 1H), 8,93 (dd, 1H), 8,18 (d, 1H), 5,09 (br t, 2H), 3,26 (br t, 2H) (протон CO ₂ H отсутствует)
A98		(400 МГц, D ₂ O) 10,05 (dd, 1H), 9,95 (d, 1H), 9,02 (dd, 1H), 5,20 (t, 2H), 3,34 (t, 2H), 2,96 (s, 3H) (протон CO ₂ H отсутствует)
A99		(400 МГц, D ₂ O) 9,98 (dd, 1H), 9,83 (d, 1H), 8,93 (dd, 1H), 5,19 - 5,25 (m, 2H), 3,63 - 3,70 (m, 2H), 2,87 (s, 3H)
A100		(400 МГц, D ₂ O) 9,90 (d, 1H), 9,65 (d, 1H), 9,23 (d, 1H), 8,79 - 8,85 (m, 2H), 5,05 (t, 2H), 3,25 (t, 2H) (протон CO ₂ H отсутствует)
A101		(400 МГц, D ₂ O) 9,83 (d, 1H) 9,59 (d, 1H) 8,84 (dd, 1H) 8,21 (s, 1H) 7,57 (s, 1H) 4,90 (dd, 1H) 4,62-4,52 (m, 1H) 4,13-4,02 (m, 1H) 3,30-3,17 (m, 2H) 2,19-2,04 (m, 1H) 2,01-1,70 (m, 3H)

Номер соединения	Структура	^1H ЯМР
A102		(400 МГц, D ₂ O) 9,91-9,86 (m, 1H) 9,69-9,63 (m, 1H) 8,95-8,88 (m, 1H) 8,28-8,22 (m, 1H) 7,64-7,57 (m, 1H) 5,09 (d, 2H) (один протон РОН отсутствует)
A103		(400 МГц, D ₂ O) 9,91-9,83 (m, 1H) 9,68-9,58 (m, 1H) 8,97-8,83 (m, 1H) 8,27-8,18 (m, 1H) 7,65-7,54 (m, 1H) 5,18-5,07 (m, 2H) 3,64-3,54 (m, 3H)
A104		(400 МГц, D ₂ O) 9,81 (br d, 2H) 8,86 (dd, 1H) 8,21 (s, 1H) 8,08 (s, 1H) 8,02-7,95 (m, 1H) 7,78-7,71 (m, 1H) 7,60-7,56 (m, 1H) 7,52 (s, 1H) 6,04 (s, 2H) (один протон CO ₂ H отсутствует)
A105		(400 МГц, D ₂ O) 10,04 (d, 1H), 9,76 (d, 1H), 9,16 (d, 1H), 8,94 (dd, 1H), 8,19 (d, 1H), 5,21 (t, 2H), 3,70 (t, 2H)
A106		(400 МГц, D ₂ O) 9,94-9,91 (m, 1H) 9,79-9,75 (m, 1H) 8,91-8,87 (m, 1H) 8,26-8,23 (m, 1H) 7,62-7,60 (m, 1H) 5,04-4,93 (m, 2H) 3,47 (d, 3H) 2,49-2,37 (m, 2H) (один протон РОН отсутствует)
A107		(400 МГц, DMSO-d ₆) 10,16-10,10 (m, 2H) 8,98 (dd, 1H) 8,74 (s, 1H) 7,87 (s, 1H) 3,28 (s, 2H) 1,91-1,83 (m, 6H) (один протон CO ₂ H отсутствует)
A108		(400 МГц, D ₂ O) 9,95-9,92 (m, 1H) 9,81-9,77 (m, 1H) 8,94-8,88 (m, 1H) 8,26-8,23 (m, 1H) 7,61 (d, 1H) 5,14-5,04 (m, 2H) 3,73-3,67 (m, 6H) 2,87-2,76 (m, 2H)

Номер соединения	Структура	^1H ЯМР
A109		(400 МГц, D ₂ O) 9,95-9,91 (m, 1H) 9,80-9,74 (m, 1H) 8,93-8,88 (m, 1H) 8,24 (s, 1H) 7,62-7,58 (m, 1H) 5,11-5,04 (m, 2H) 4,32-4,25 (m, 1H) 3,79 (s, 3H) 2,84-2,61 (m, 2H) (два протона NH отсутствуют)
A110		(400 МГц, D ₂ O) 9,99-9,86 (m, 1H) 9,78 (d, 1H) 8,90 (dd, 1H) 8,24 (s, 1H) 7,61 (s, 1H) 5,05 (br t, 2H) 4,00-3,92 (m, 1H) 2,74-2,61 (m, 2H) (один протон CO ₂ H отсутствуют)
A111		(400 МГц, D ₂ O) 9,91-9,86 (m, 1H) 9,69 (d, 1H) 8,85-8,80 (m, 1H) 8,21-8,18 (m, 1H) 8,11-8,07 (m, 1H) 5,03 (t, 2H) 3,21 (t, 2H) (один протон CO ₂ H отсутствует)
A112		(400 МГц, D ₂ O) 9,89-9,86 (m, 1H) 9,72-9,68 (m, 1H) 8,85-8,80 (m, 1H) 8,20-8,17 (m, 1H) 8,11-8,07 (m, 1H) 5,07-5,01 (m, 2H) 3,60 (s, 3H) 3,26-3,20 (m, 2H)
A113		(400 МГц, D ₂ O) 9,94-9,91 (m, 1H) 9,66-9,63 (m, 1H) 8,89-8,84 (m, 1H) 8,21 (d, 1H) 8,12-8,09 (m, 1H) 5,10-5,06 (m, 2H) 4,60-4,55 (m, 2H)
A114		(400 МГц, D ₂ O) 9,94-9,90 (m, 1H) 9,70-9,65 (m, 1H) 8,90-8,85 (m, 1H) 8,25-8,21 (m, 1H) 8,14-8,11 (m, 1H) 4,89-4,83 (m, 2H) 3,63 (s, 3H) 2,58-2,51 (m, 2H) 2,43-2,34 (m, 2H)
A115		(400 МГц, D ₂ O) 9,87 (d, 1H) 9,63 (d, 1H) 8,82 (dd, 1H) 8,19-8,16 (m, 1H) 8,09-8,06 (m, 1H) 4,85-4,79 (m, 2H) 2,56-2,40 (m, 2H) 2,40-2,25 (m, 2H) (один протон CO ₂ H отсутствует)

Номер соединения	Структура	^1H ЯМР
A116		(400 МГц, D ₂ O) 9,92-9,89 (m, 1H) 9,67-9,63 (m, 1H) 8,87-8,82 (m, 1H) 8,20 (d, 1H) 8,11-8,08 (m, 1H) 4,97-4,91 (m, 2H) 3,01-2,95 (m, 2H) 2,57-2,46 (m, 2H)
A117		(400 МГц, D ₂ O) 9,90 (d, 1H) 9,68 (d, 1H) 8,85 (dd, 1H) 8,57 (s, 1H) 4,95 (t, 2H) 4,01 (s, 3H) 2,97 (t, 2H) 2,55-2,47 (m, 2H)
A118		(400 МГц, D ₂ O) 9,95-9,91 (m, 1H) 9,68 (dd, 1H) 8,91-8,87 (m, 1H) 8,58 (s, 1H) 5,13-5,09 (m, 2H) 4,62-4,57 (m, 2H) 4,03 (s, 3H)
A119		(400 МГц, D ₂ O) 9,92-9,89 (m, 1H) 9,72-9,68 (m, 1H) 8,89-8,85 (m, 1H) 8,59 (s, 1H) 4,91-4,85 (m, 2H) 4,03 (s, 3H) 2,55-2,50 (m, 2H) 2,41-2,32 (m, 2H) (один протон CO ₂ H отсутствует)
A120		(400 МГц, D ₂ O) 9,92 (d, 1H) 9,66 (dd, 1H) 8,92 (dd, 1H) 8,22 (d, 1H) 8,13 (d, 1H) 5,75 (s, 2H) 3,79 (s, 3H)
A121		(400 МГц, D ₂ O) 9,91 (d, 1H) 9,71 (d, 1H) 8,89 (dd, 1H) 8,61 (s, 1H) 4,88 (t, 2H) 4,05 (s, 3H) 3,63 (s, 3H) 2,55 (t, 2H) 2,44-2,34 (m, 2H)
A122		(400 МГц, D ₂ O) 9,74 (d, 1H), 9,61 (d, 1H), 9,39 (s, 1H) 8,84 (s, 1H), 8,65 (dd, 1H), 5,04 (t, 2H), 3,25 (t, 2H) (протон CO ₂ H отсутствует)
A123		(400 МГц, CD ₃ OD) 10,11 (d, 1H), 9,80 (dd, 1H), 9,09 (dd, 1H), 8,34 (d, 1H), 8,28 (d, 1H), 5,71 (s, 2H) (протон CO ₂ H отсутствует)

Номер соединения	Структура	¹ H ЯМР
A124		(400 МГц, D ₂ O) 10,01-9,98 (m, 1H), 9,91-9,87 (m, 1H), 9,03-8,98 (m, 1H), 8,85 (s, 1H), 5,28-5,22 (m, 2H), 4,40 (q, 2H), 3,72-3,66 (m, 2H), 1,34 (t, 3H)
A125		(400 МГц, D ₂ O) 9,99 (s, 1H), 9,86 (d, 1H), 9,01-8,96 (m, 1H), 8,68 (s, 1H), 5,27-5,21 (m, 2H), 4,76 (s, 3H), 3,72-3,66 (m, 2H) (протон NH отсутствует)
A126		(400 МГц, D ₂ O) 9,94 (s, 1H), 9,89-9,85 (m, 1H), 8,98-8,93 (m, 1H), 8,81 (s, 1H), 5,13-5,07 (m, 2H), 4,37 (q, 2H), 3,27-3,21 (m, 2H), 1,34-1,27 (m, 3H) (протон CO ₂ H отсутствует)
A127		(400 МГц, D ₂ O) 9,94-9,91 (m, 1H), 9,86-9,82 (m, 1H), 8,95-8,91 (m, 1H), 8,64 (s, 1H), 5,10-5,05 (m, 2H), 3,23-3,18 (m, 2H), 2,87 (s, 3H) (протоны NH и CO ₂ H отсутствуют)
A128		(400 МГц, D ₂ O) 9,84 (s, 1H), 9,74-9,69 (m, 1H), 8,85-8,79 (m, 1H), 7,99 (s, 1H), 4,90-4,84 (m, 2H), 3,62 (s, 3H), 2,57-2,51 (m, 2H), 2,43-2,34 (m, 2H), 2,26 (s, 3H)
A129		(400 МГц, D ₂ O) 9,87-9,85 (m, 1H), 9,85-9,82 (m, 1H), 8,89-8,85 (m, 1H), 5,11-5,06 (m, 2H), 3,25-3,20 (m, 2H), 2,86 (s, 3H), 2,46 (s, 3H) (протоны NH и CO ₂ H отсутствуют)
A130		(400 МГц, D ₂ O) 9,94-9,89 (m, 1H), 9,89-9,84 (m, 1H), 8,97-8,92 (m, 1H), 5,09 (br t, 2H), 4,45-4,34 (m, 2H), 3,23 (br t, 2H), 2,49 (s, 3H), 1,32 (t, 3H) (протон CO ₂ H отсутствует)

Номер соединения	Структура	^1H ЯМР
A131		(400 МГц, D ₂ O) 9,91-9,88 (m, 1H), 9,88-9,83 (m, 1H), 8,96-8,91 (m, 1H), 5,12-5,06 (m, 2H), 4,40-4,32 (m, 2H), 3,58 (s, 3H), 3,25-3,20 (m, 2H), 2,47 (s, 3H), 1,30 (t, 3H)
A132		(400 МГц, D ₂ O) 9,79 (s, 1H), 9,64 (d, 1H), 8,82 (dd, 1H), 7,95 (s, 1H), 5,54 (s, 2H), 2,21 (s, 3H) (протон CO ₂ H отсутствует)
A133		(400 МГц, D ₂ O) 9,86-9,83 (m, 1H), 9,75-9,71 (m, 1H), 8,91-8,85 (m, 1H), 8,00 (s, 1H), 5,78 (s, 2H), 3,79 (s, 3H), 2,24 (s, 3H)
A134		(400 МГц, D ₂ O) 9,86-9,82 (m, 1H), 9,69 (d, 1H), 8,81 (dd, 1H), 7,97 (s, 1H), 5,13-5,06 (m, 2H), 4,60-4,55 (m, 2H), 2,24 (s, 3H)
A135		(400 МГц, D ₂ O) 9,85-9,82 (m, 1H), 9,74-9,69 (m, 1H), 8,84-8,79 (m, 1H), 7,98 (s, 1H), 4,91-4,84 (m, 2H), 2,55-2,50 (m, 2H), 2,41-2,33 (m, 2H), 2,25 (s, 3H) (протон CO ₂ H отсутствует)
A136		(400 МГц, D ₂ O) 9,84-9,80 (m, 1H), 9,70 (d, 1H), 8,79 (dd, 1H), 7,96 (s, 1H), 4,95 (t, 2H), 2,97 (t, 2H), 2,55-2,45 (m, 2H), 2,23 (s, 3H)
A137		(400 МГц, D ₂ O) 9,91-9,86 (m, 2H), 8,94-8,90 (m, 1H), 5,16-5,11 (m, 2H), 3,64 (s, 3H), 3,31-3,25 (m, 2H), 2,90 (s, 3H), 2,51 (s, 3H) (протон NH отсутствует)

Номер соединения	Структура	^1H ЯМР
A138		(400 МГц, CD_3OD) 10,00 (d, 1H), 9,98 (d, 1H), 9,67 (s, 1H), 9,01 (dd, 1H), 5,13 (t, 2H), 3,25 (t, 2H) (протон CO_2H отсутствует)
A139		(400 МГц, CD_3OD) 10,26 (d, 1H), 10,23 (s, 1H), 9,97 (d, 1H), 9,24 (dd, 1H), 5,13 (t, 2H), 3,27 (t, 2H) (протон CO_2H отсутствует)
A140		(400 МГц, D_2O) 10,05 (d, 1H), 10,03 (d, 1H), 9,08 (dd, 1H), 5,21 (t, 2H), 3,30 (t, 2H), 2,76 (s, 3H) (протон CO_2H отсутствует)
A141		(400 МГц, D_2O) 9,95 (d, 1H), 9,90 (d, 1H), 8,98 (dd, 1H), 5,28 (t, 2H), 3,73 (t, 2H) (протоны NH отсутствуют)
A142		(400 МГц, D_2O) 10,35 (s, 1H), 10,19 (d, 1H), 9,90 (d, 1H), 9,18 (dd, 1H), 5,14 (t, 2H), 3,26 (t, 2H) (протон CO_2H отсутствует)
A143		(400 МГц, D_2O) 10,35 (s, 1H), 10,23 (d, 1H), 9,90 (d, 1H), 9,21 (dd, 1H), 5,28 (t, 2H), 3,73 (t, 2H)
A144		(400 МГц, D_2O) 10,03 (d, 1H), 9,89 (d, 1H), 9,01-9,04 (m, 1H), 8,95 (s, 1H), 5,15 (t, 2H), 3,26 (t, 2H) (протон CO_2H отсутствует)

Номер соединения	Структура	¹ H ЯМР
A145		(400 МГц, D ₂ O) 9,92 - 9,93 (m, 2H), 8,89 - 8,94 (m, 1H), 8,77 (s, 1H), 5,16 (t, 2H), 4,02 (s, 3H), 3,29 (t, 2H) (протон CO ₂ H отсутствует)
A146		(400 МГц, CD ₃ OD) 10,06 (d, 1H), 10,03 (d, 1H), 9,12 - 9,02 (m, 2H), 7,42 (d, 1H), 5,15 (t, 2H), 3,27 (t, 2H) (протон CO ₂ H отсутствует)
A147		(400 МГц, D ₂ O) 9,65 - 9,73 (m, 2H), 8,69 - 8,74 (m, 1H), 8,62 - 8,67 (m, 1H), 8,04 - 8,11 (m, 1H), 4,96 - 5,05 (m, 2H), 3,16 - 3,22 (m, 2H) (протон CO ₂ H отсутствует)

БИОЛОГИЧЕСКИЕ ПРИМЕРЫ

Послевсходовая эффективность

Семена сортов тестируемых видов высевали в стандартную почву в горшках. После культивирования в течение 14 дней (после появления всходов) в контролируемых условиях в теплице (при 24/16°C, день/ночь; 14-часовой световой период; влажность 65%) на растения распыляли водный раствор для распыления, полученным посредством растворения технического активного ингредиента формулы (I) в небольшом количестве ацетона и специальной смеси растворителя и эмульгатора, называемой IF50 (11,12% Emulsogen EL360 TM + 44,44% N-метилпирролидона + 44,44% гликолевого эфира Dowanol DPM), с получением 50 г/л раствора, который затем разбавляли до необходимой концентрации с применением 0,25% или 1% Empicol ESC70 (лаурилэфирсульфат натрия) + 1% сульфата аммония в качестве разбавителя.

Затем тестируемые растения выращивали в теплице в контролируемых условиях (при 24/16°C, день/ночь; 14-часовой световой период; влажность 65%) и поливали дважды в день. Через 13 дней проводили оценку результатов тестирования (100 = повреждение всего растения; 0 = отсутствие повреждения у растения).

Результаты показаны в таблице В (ниже). Значение н. д. указывает на то, что данную комбинацию сорняка и тестируемого соединения не тестировали/оценивали.

Тестируемые растения:

- 5 *Ipomoea hederacea* (IPOHE), *Euphorbia heterophylla* (EPHHL), *Chenopodium album* (CHEAL), *Amaranthus palmeri* (AMAPA), *Lolium perenne* (LOLPE), *Digitaria sanguinalis* (DIGSA), *Eleusine indica* (ELEIN), *Echinochloa crus-galli* (ECHCG), *Setaria faberi* (SETFA).

Таблица В. Контроль некоторых видов сорняков с помощью соединений формулы (I) после послевсходового применения

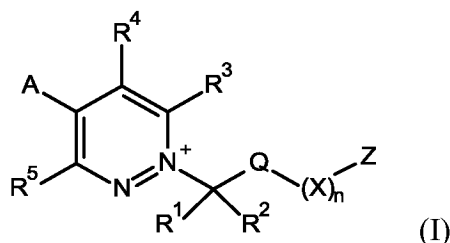
Номер соединения	Норма применения, г/га	AMAPA	CHEAL	EPHHL	IPOHE	ELEIN	LOLPE	DIGSA	SETFA	ECHCG
A1	500	100	70	70	50	50	90	100	50	60
A2	125	0	0	30	10	10	0	20	20	10
A3	125	20	60	70	40	50	20	80	80	70
A4	500	10	30	40	10	10	0	30	20	20
A5	500	100	100	100	70	80	100	60	60	70
A6	500	90	40	20	10	60	60	60	70	60
A7 (тестировали в виде смеси 1:1 региоизомеров)	500	0	0	20	10	20	10	30	10	10
A8 (тестировали в виде смеси 1:1 региоизомеров)	500	10	10	30	30	20	10	50	40	50
A9	500	90	70	90	80	80	30	70	60	60
A10	500	60	80	60	50	60	60	50	60	30
A11	500	100	90	100	60	100	80	90	100	100
A12	500	60	30	20	20	30	70	60	40	30
A13	500	90	70	90	40	80	60	30	60	40
A14	500	100	40	50	40	70	40	50	50	40
A15	500	100	80	100	30	100	60	80	70	80
A16	500	100	100	90	80	80	90	70	80	80
A17	500	30	30	40	30	60	50	50	50	40
A18	500	90	10	50	30	30	40	30	40	30
A19	500	40	100	100	70	100	90	70	60	80
A20	500	40	20	10	10	50	10	60	20	30
A21	500	10	40	40	10	10	0	10	10	10
A22	500	30	20	30	10	20	10	20	20	20
A23	500	50	10	70	30	60	40	50	40	30
A24	500	0	0	Н. д.	10	20	10	10	20	30
A25	500	80	70	80	40	40	20	40	40	30
A26	500	20	40	Н. д.	40	40	30	30	40	20
A27	500	100	90	90	70	50	30	90	90	90
A28	500	100	90	Н. д.	30	100	70	70	100	100
A29	500	20	50	20	20	30	20	30	20	20
A30	500	80	40	40	20	40	50	30	40	20
A31	500	30	20	30	10	50	20	50	60	40
A32	500	80	90	80	60	90	40	90	80	90
A33	500	100	70	80	10	50	30	70	30	20
A34	500	60	20	30	20	20	20	30	40	50
A35	500	100	100	90	50	70	70	50	60	50
A36	500	100	60	30	30	20	20	10	10	0
A37	500	30	50	30	20	10	0	10	10	10

Номер соединения	Норма применения, г/га	АМАРА	CHEAL	ЕРННЛ	ІРОНЕ	ELEIN	LOLPE	DIGSA	SETFA	ECHCG
A38	500	20	30	20	20	0	10	20	10	10
A39	500	90	90	90	80	80	70	90	90	80
A40	500	100	100	100	90	100	80	80	80	80
A41	500	0	60	Н. д.	10	0	0	0	0	0
A42	500	20	40	30	20	20	0	20	10	10
A43	500	100	90	80	20	10	0	20	10	10
A44	500	100	Н. д.	Н. д.	60	50	30	50	60	30
A45	500	100	80	90	20	70	70	50	70	40
A46	500	Н. д.	70	Н. д.	50	60	40	60	60	80
A47	500	100	100	100	30	100	100	90	90	90
A48	500	100	90	90	90	70	40	100	90	70
A49	500	100	100	90	70	60	40	70	60	60
A50	500	100	100	100	70	70	80	100	100	100
A51	500	100	100	90	30	70	60	90	90	90
A52	500	50	Н. д.	Н. д.	10	10	0	30	10	10
A53	500	60	Н. д.	Н. д.	50	60	20	90	40	30
A54	500	80	50	Н. д.	10	80	60	90	70	70
A55	500	100	80	Н. д.	20	100	70	100	100	100
A56	500	100	80	90	30	80	50	70	80	90
A57	500	100	100	90	60	60	50	70	60	80
A58	500	80	50	Н. д.	20	40	30	90	90	70
A59	500	90	90	100	80	90	70	70	80	70
A60	500	90	90	50	10	70	30	50	50	40
A61	500	100	70	40	20	60	30	80	70	50
A62	500	0	20	40	20	0	0	10	0	0
A63	500	0	30	40	20	20	10	20	30	20
A64	500	100	90	100	90	30	40	90	80	80
A65	500	80	70	90	60	100	90	100	100	60
A66	500	50	60	Н. д.	10	90	20	60	70	70
A67	500	100	80	80	80	90	60	90	80	70
A68	500	100	90	90	50	70	70	70	80	60
A69	500	90	90	Н. д.	40	90	30	90	90	80
A70	500	40	40	Н. д.	30	40	20	80	40	40
A71	500	100	90	90	60	100	80	90	90	100
A72	500	90	70	70	70	80	40	60	60	40
A73	500	80	70	50	30	70	10	70	60	50
A74	500	100	90	70	80	100	60	90	80	40
A75	125	0	40	Н. д.	0	0	0	10	0	0
A76	500	30	20	40	30	70	30	60	40	30
A77	500	50	70	Н. д.	60	0	0	90	80	60
A78	500	70	80	Н. д.	50	0	10	60	50	20
A79	500	100	90	Н. д.	80	100	70	90	90	80
A80	500	40	10	Н. д.	10	10	0	60	40	0
A81	500	50	40	Н. д.	10	10	10	70	50	30
A83	500	100	70	70	40	70	50	60	60	60
A84	500	100	90	90	40	70	50	70	50	70
A85	500	10	0	20	30	30	10	40	20	20
A86	500	40	30	30	40	20	20	30	20	10
A87	500	80	20	80	10	80	0	90	40	50
A88	500	100	100	50	30	30	30	70	60	80
A89	500	100	90	100	30	70	60	90	60	60
A90	500	20	20	20	10	10	0	10	10	10
A91	500	40	60	Н. д.	20	40	10	40	20	20
A92	500	10	10	20	10	10	0	20	0	0
A93	500	0	0	10	20	30	10	50	40	30
A94	500	90	90	100	90	100	40	100	90	90
A95	500	10	0	30	10	10	0	30	20	10
A96	500	100	90	100	80	80	70	40	80	30
A97	500	100	80	50	20	70	30	50	40	60

Номер соединения	Норма применения, г/га	АМАРА	CHEAL	ЕРННЛ	ІРОНЕ	ELEIN	LOLPE	DIGSA	SETFA	ECHCG
A98	500	100	90	90	40	80	80	90	100	70
A99	500	30	90	90	40	40	60	60	70	20
A100	500	0	0	30	20	30	10	40	30	30
A101	500	70	60	70	40	30	20	70	60	40
A102	500	100	90	90	60	30	10	60	60	70
A103	500	70	40	70	40	60	30	90	80	70
A104	500	40	20	30	10	20	10	50	60	50
A105	500	90	90	100	70	90	70	100	90	80
A106	500	10	0	60	20	20	0	80	50	40
A107	500	100	50	30	20	30	20	70	50	40
A108	500	20	20	30	30	20	10	60	30	30
A109	500	90	90	60	0	Н. д.	10	Н. д.	90	Н. д.
A110	500	90	80	40	20	100	20	90	80	100
A111	500	90	90	90	70	100	90	100	100	100
A112	500	50	60	50	20	90	30	90	60	50
A113	500	100	60	70	50	70	60	70	70	70
A114	500	100	60	Н. д.	10	90	30	70	50	40
A115	500	100	70	100	20	100	60	90	100	90
A116	500	100	40	70	20	80	80	60	60	60
A117	500	40	20	70	30	20	40	80	90	70
A118	500	50	30	70	30	70	40	90	90	90
A119	500	100	50	80	30	90	30	90	100	80
A120	500	100	50	70	10	90	0	80	60	70
A121	500	30	10	40	10	50	10	60	40	100
A122	500	90	0	70	30	70	20	90	50	30
A123	500	0	0	30	10	20	10	20	10	10
A124	500	90	30	90	40	80	40	90	70	40
A125	500	30	10	40	10	40	40	60	70	60
A126	500	90	70	70	30	90	60	90	70	60
A127	500	100	100	70	60	70	20	90	70	80
A128	500	90	20	70	20	100	60	90	90	80
A129	500	100	70	90	80	90	60	70	100	60
A130	500	100	50	100	50	80	50	60	30	60
A131	500	10	0	10	10	10	10	30	20	20
A132	500	90	70	70	10	90	50	90	80	90
A133	500	0	0	0	10	10	0	20	0	10
A134	500	90	30	70	50	80	40	60	70	70
A135	500	90	20	90	10	80	40	90	90	90
A136	500	70	30	70	20	60	60	70	80	40
A137	500	20	10	20	10	30	10	50	30	40
A138	500	90	40	100	70	70	0	60	30	40
A139	500	80	70	100	60	70	10	70	60	60
A140	500	10	0	0	0	90	10	70	70	20
A141	500	100	100	100	100	10	30	10	50	30
A142	500	100	90	100	30	100	90	100	90	100
A143	500	100	90	100	60	100	100	100	90	100

ФОРМУЛА ИЗОБРЕТЕНИЯ

1. Соединение формулы (I) или его агрономически приемлемая соль или цвиттер-ионные формы:



где

R^1 выбран из группы, состоящей из водорода, галогена, C_1 - C_6 алкила, C_2 - C_6 алкенила, C_2 - C_6 алкинила, C_3 - C_6 циклоалкила, C_1 - C_6 галогеналкила, $-OR^7$, $-OR^{15a}$, $-N(R^6)S(O)_2R^{15}$, $-N(R^6)C(O)R^{15}$, $-N(R^6)C(O)OR^{15}$, $-N(R^6)C(O)NR^{16}R^{17}$, $-N(R^6)CHO$, $-N(R^{7a})_2$ и $-S(O)_tR^{15}$;

R^2 выбран из группы, состоящей из водорода, галогена, C_1 - C_6 алкила и C_1 - C_6 галогеналкила;

и при этом, если R^1 выбран из группы, состоящей из $-OR^7$, $-OR^{15a}$, $-N(R^6)S(O)_2R^{15}$, $-N(R^6)C(O)R^{15}$, $-N(R^6)C(O)OR^{15}$, $-N(R^6)C(O)NR^{16}R^{17}$, $-N(R^6)CHO$, $-N(R^{7a})_2$ и $-S(O)_tR^{15}$, R^2 выбран из группы, состоящей из водорода и C_1 - C_6 алкила; или

R^1 и R^2 вместе с атомом углерода, к которому они присоединены, образуют C_3 - C_6 циклоалкильное кольцо или 3-6-членный гетероцикл, который содержит 1 или 2 гетероатома, по отдельности выбранные из N и O; и

Q представляет собой $(CR^{1a}R^{2b})_m$;

m равняется 0, 1, 2 или 3;

каждые R^{1a} и R^{2b} независимо выбраны из группы, состоящей из водорода, галогена, C_1 - C_6 алкила, C_1 - C_6 галогеналкила, $-OH$, $-OR^7$, $-OR^{15a}$, $-NH_2$, $-NHR^7$, $-NHR^{15a}$, $-N(R^6)CHO$, $-NR^{7b}R^{7c}$ и $-S(O)_tR^{15}$; или

5 каждые R^{1a} и R^{2b} вместе с атомом углерода, к которому они присоединены, образуют C_3 - C_6 циклоалкильное кольцо или 3-6-членный гетероциклический, который содержит 1 или 2 гетероатома, по отдельности выбранные из N и O; и

10 R^3 , R^4 и R^5 независимо выбраны из группы, состоящей из водорода, галогена, циано, нитро, $-S(O)_tR^{15}$, C_1 - C_6 алкила, C_1 - C_6 фторалкила, C_1 - C_6 фторалкокси, C_1 - C_6 алкокси, C_3 - C_6 циклоалкила и $-N(R^6)_2$;

каждый R^6 независимо выбран из водорода и C_1 - C_6 алкила;

15 каждый R^7 независимо выбран из группы, состоящей из C_1 - C_6 алкила, $-S(O)_2R^{15}$, $-C(O)R^{15}$, $-C(O)OR^{15}$ и $-C(O)NR^{16}R^{17}$;

каждый R^{7a} независимо выбран из группы, состоящей из $-S(O)_2R^{15}$, $-C(O)R^{15}$, $-C(O)OR^{15}$, $-C(O)NR^{16}R^{17}$ и $-C(O)NR^{6}R^{15a}$;

20 R^{7b} и R^{7c} независимо выбраны из группы, состоящей из C_1 - C_6 алкила, $-S(O)_2R^{15}$, $-C(O)R^{15}$, $-C(O)OR^{15}$, $-C(O)NR^{16}R^{17}$ и фенила, и где указанный фенил необязательно замещен 1, 2 или 3 заместителями R^9 , которые могут быть одинаковыми или различными; или

25 R^{7b} и R^{7c} вместе с атомом азота, к которому они присоединены, образуют 4-6-членное гетероциклическое кольцо, которое необязательно содержит один дополнительный гетероатом, отдельно выбранный из N, O и S; и

30 A представляет собой 5-членный гетероарил, присоединенный к остальной части молекулы посредством атома углерода в кольце, который содержит 1, 2, 3 или 4 гетероатома, независимо выбранные из группы, состоящей из N, O и S, и при этом гетероарил необязательно замещен 1, 2 или 3 заместителями R^8 , которые могут быть одинаковыми или различными,

и при этом, если А замещен по одному или нескольким атомам углерода в кольце, каждый R^8 независимо выбран из группы, состоящей из галогена, нитро, циано, $-NH_2$, $-NHR^7$, $-N(R^7)_2$, $-OH$, $-OR^7$, $-S(O)_tR^{15}$, $-NR^6S(O)_2R^{15}$, $-C(O)OR^{10}$, $-C(O)R^{15}$, $-C(O)NR^{16}R^{17}$, $-S(O)_2NR^{16}R^{17}$, C_1 - C_6 алкила, C_1 - C_6 галогеналкила, C_3 - C_6 циклоалкила, C_3 - C_6 галогенциклоалкила, C_3 - C_6 циклоалкокси, C_2 - C_6 алкенила, C_2 - C_6 галогеналкенила, C_2 - C_6 алкинила, C_1 - C_3 алкокси C_1 - C_3 алкил-, гидроксис C_1 - C_6 алкил-, C_1 - C_3 алкокси C_1 - C_3 алкокси-, C_1 - C_6 галогеналкокси, C_1 - C_3 галогеналкокси C_1 - C_3 алкил-, C_3 - C_6 алкенилокси, C_3 - C_6 алкинилокси, N - C_3 - C_6 циклоалкиламино, $-C(R^6)=NOR^6$, фенила, 3-6-членного гетероциклила, который содержит 1 или 2 гетероатома, по отдельности выбранные из N и O, и 5- или 6-членного гетероарила, который содержит 1, 2, 3 или 4 гетероатома, независимо выбранные из N, O и S, и при этом указанные фенил, гетероциклил или гетероарил необязательно замещены 1, 2 или 3 заместителями R^9 , которые могут быть одинаковыми или различными;

15

и/или

если А замещен по атому азота в кольце, R^8 выбран из группы, состоящей из $-OR^7$, C_1 - C_6 алкила, C_1 - C_6 галогеналкила, C_3 - C_6 циклоалкила, C_3 - C_6 галогенциклоалкила, C_3 - C_6 циклоалкокси, C_2 - C_6 алкенила, C_2 - C_6 галогеналкенила, C_2 - C_6 алкинила, C_1 - C_3 алкокси C_1 - C_3 алкил-, гидроксис C_1 - C_6 алкил-, C_1 - C_3 алкокси C_1 - C_3 алкокси-, C_1 - C_6 галогеналкокси, C_1 - C_3 галогеналкокси C_1 - C_3 алкил-, C_3 - C_6 алкенилокси и C_3 - C_6 алкинилокси; и

каждый R^9 независимо выбран из группы, состоящей из галогена, циано, $-OH$, $-N(R^6)_2$, C_1 - C_4 алкила, C_1 - C_4 алкокси, C_1 - C_4 галогеналкила и C_1 - C_4 галогеналкокси;

Х независимо выбран из группы, состоящей из C_3 - C_6 циклоалкила, фенила, 5- или 6-членного гетероарила, который содержит 1, 2, 3 или 4 гетероатома, независимо выбранные из N, O и S, и 4-6-членного гетероциклила, который содержит 1, 2 или 3 гетероатома, независимо выбранные из N, O и S, и при этом указанные циклоалкильные, фенильные, гетероарильные или гетероциклильные фрагменты необязательно замещены 1 или 2 заместителями R^9 , и при этом вышеуказанные фрагменты CR^1R^2 и Z или Q и Z могут быть присоединены в

любом положении указанных циклоалкильных, фенильных, гетероарильных или гетероциклильных фрагментов;

n равняется 0 или 1;

5

Z выбран из группы, состоящей из $-\text{C}(\text{O})\text{OR}^{10}$, $-\text{CH}_2\text{OH}$, $-\text{CHO}$, $-\text{C}(\text{O})\text{NHOR}^{11}$, $-\text{C}(\text{O})\text{NHCN}$, $-\text{OC}(\text{O})\text{NHOR}^{11}$, $-\text{OC}(\text{O})\text{NHCN}$, $-\text{NR}^6\text{C}(\text{O})\text{NHOR}^{11}$, $-\text{NR}^6\text{C}(\text{O})\text{NHCN}$, $-\text{C}(\text{O})\text{NHS}(\text{O})_2\text{R}^{12}$, $-\text{OC}(\text{O})\text{NHS}(\text{O})_2\text{R}^{12}$, $-\text{NR}^6\text{C}(\text{O})\text{NHS}(\text{O})_2\text{R}^{12}$, $-\text{S}(\text{O})_2\text{OR}^{10}$, $-\text{OS}(\text{O})_2\text{OR}^{10}$, $-\text{NR}^6\text{S}(\text{O})_2\text{OR}^{10}$, $-\text{NR}^6\text{S}(\text{O})\text{OR}^{10}$, $-\text{NHS}(\text{O})_2\text{R}^{14}$, $-\text{S}(\text{O})\text{OR}^{10}$, $-\text{OS}(\text{O})\text{OR}^{10}$, $-\text{S}(\text{O})_2\text{NHCN}$, $-\text{S}(\text{O})_2\text{NHC}(\text{O})\text{R}^{18}$, $-\text{S}(\text{O})_2\text{NHS}(\text{O})_2\text{R}^{12}$, $-\text{OS}(\text{O})_2\text{NHCN}$, $-\text{OS}(\text{O})_2\text{NHS}(\text{O})_2\text{R}^{12}$, $-\text{OS}(\text{O})_2\text{NHC}(\text{O})\text{R}^{18}$, $-\text{NR}^6\text{S}(\text{O})_2\text{NHCN}$, $-\text{NR}^6\text{S}(\text{O})_2\text{NHC}(\text{O})\text{R}^{18}$, $-\text{N}(\text{OH})\text{C}(\text{O})\text{R}^{15}$, $-\text{ONHC}(\text{O})\text{R}^{15}$, $-\text{NR}^6\text{S}(\text{O})_2\text{NHS}(\text{O})_2\text{R}^{12}$, $-\text{P}(\text{O})(\text{R}^{13})(\text{OR}^{10})$, $-\text{P}(\text{O})\text{H}(\text{OR}^{10})$, $-\text{OP}(\text{O})(\text{R}^{13})(\text{OR}^{10})$, $-\text{NR}^6\text{P}(\text{O})(\text{R}^{13})(\text{OR}^{10})$ и тетразола;

10

15

R^{10} выбран из группы, состоящей из водорода, C_1 - C_6 алкила, фенила и бензила, и где указанные фенил или бензил необязательно замещены 1, 2 или 3 заместителями R^9 , которые могут быть одинаковыми или различными;

20

R^{11} выбран из группы, состоящей из водорода, C_1 - C_6 алкила и фенила, и где указанный фенил необязательно замещен 1, 2 или 3 заместителями R^9 , которые могут быть одинаковыми или различными;

25

R^{12} выбран из группы, состоящей из C_1 - C_6 алкила, C_1 - C_6 галогеналкила, C_1 - C_6 алкокси, $-\text{OH}$, $-\text{N}(\text{R}^6)_2$ и фенила, и где указанный фенил необязательно замещен 1, 2 или 3 заместителями R^9 , которые могут быть одинаковыми или различными;

30

R^{13} выбран из группы, состоящей из $-\text{OH}$, C_1 - C_6 алкила, C_1 - C_6 алкокси и фенила;

R^{14} представляет собой C_1 - C_6 галогеналкил;

R^{15} выбран из группы, состоящей из C_1 - C_6 алкила и фенила, и где указанный фенил необязательно замещен 1, 2 или 3 заместителями R^9 , которые могут быть одинаковыми или различными;

R^{15a} представляет собой фенил, где указанный фенил необязательно замещен 1, 2 или 3 заместителями R^9 , которые могут быть одинаковыми или различными;

5 R^{16} и R^{17} независимо выбраны из группы, состоящей из водорода и C_1 - C_6 алкила; или

R^{16} и R^{17} вместе с атомом азота, к которому они присоединены, образуют 4-6-членное гетероциклическое кольцо, которое необязательно содержит один дополнительный гетероатом, независимо выбранный из N, O и S; и

10 R^{18} выбран из группы, состоящей из водорода, C_1 - C_6 алкила, C_1 - C_6 галогеналкила, C_1 - C_6 алкокси, $-N(R^6)_2$ и фенила, и где указанный фенил необязательно замещен 1, 2 или 3 заместителями R^9 , которые могут быть одинаковыми или различными;

15 и

r равняется 0, 1 или 2.

2. Соединение по п. 1, где каждый из R^1 и R^2 независимо представляет собой
20 водород или C_1 - C_6 алкил.

3. Соединение по п. 1 или п. 2, где каждое R^{1a} и R^{2b} независимо выбраны из группы, состоящей из водорода, C_1 - C_6 алкила, $-OH$ и $-NH_2$.

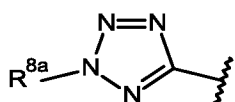
25 4. Соединение по любому из пп. 1-3, где m равняется 1 или 2.

5. Соединение по любому из пп. 1-4, где R^3 , R^4 и R^5 представляют собой водород.

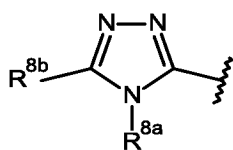
6. Соединение по любому из пп. 1-5, где A представляет собой гетероарил,
30 выбранный из группы, состоящей из тетразолила, 1,2,4-триазиолила, изоксазолила, оксазолила, тиазолила, 1,3,4-тиадиазолила, 1,2,3-триазиолила, пиразолила, 1,3,4-оксадиазолила, 1,2,4-тиадиазолила, имидазолила, изотиазолила, тиенила, фурила, 1,2,4-оксадиазолила, 1,2,3-тиадиазолила и 1,2,5-

тиадиазолила, где гетероарил необязательно замещен 1, 2 или 3 заместителями R^8 , которые могут быть одинаковыми или различными, и R^8 определен в п. 1.

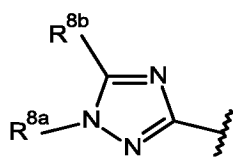
- 5 7. Соединение по любому из пп. 1-6, где А выбран из группы, состоящей из формул А-I - А-XXXIV, указанных ниже,



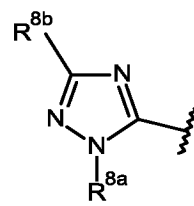
A-I



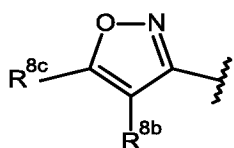
A-II



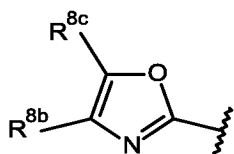
A-III



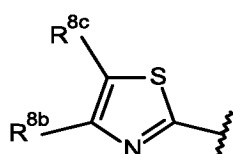
A-IV



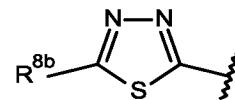
A-V



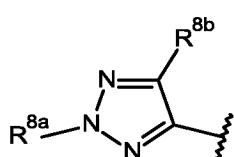
A-VI



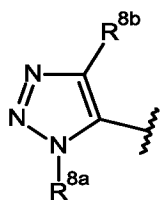
A-VII



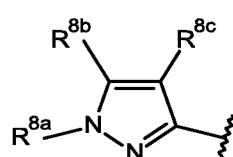
A-VIII



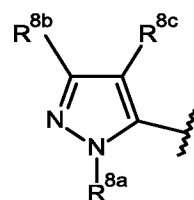
A-IX



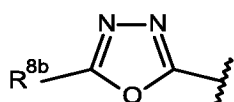
A-X



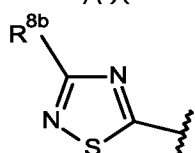
A-XI



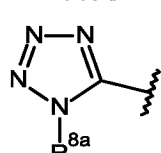
A-XII



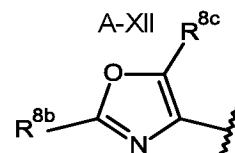
A-XIII



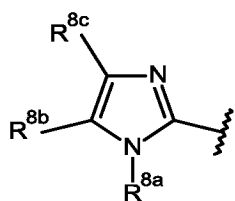
A-XIV



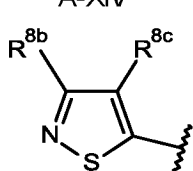
A-XV



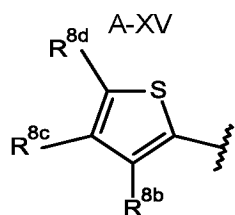
A-XVI



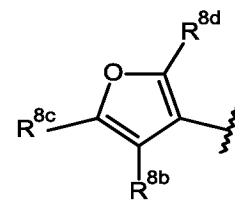
A-XVII



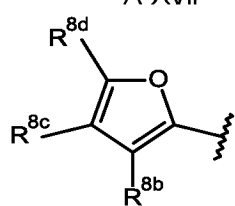
A-XVIII



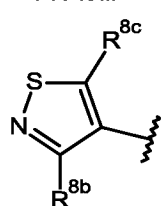
A-XIX



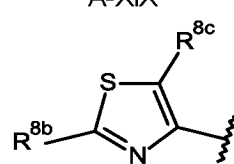
A-XX



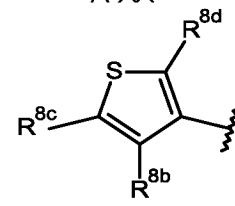
A-XXI



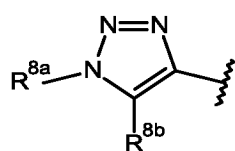
A-XXII



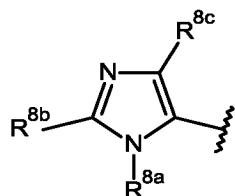
A-XXIII



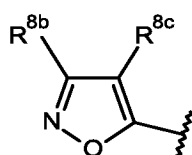
A-XXIV



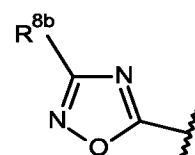
A-XXV



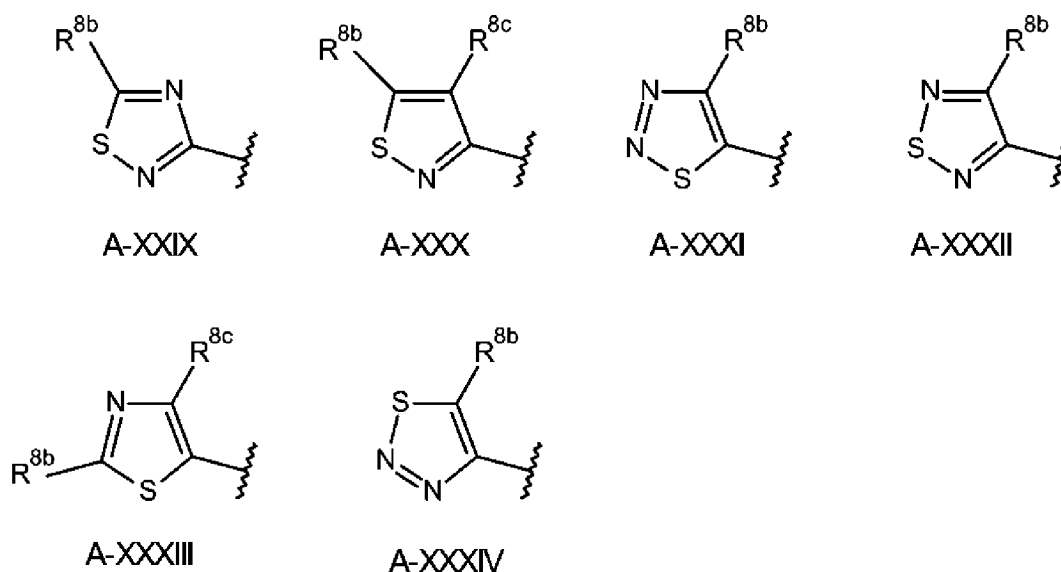
A-XXVI



A-XXVII



A-XXVIII



где волнистая линия обозначает точку присоединения к остальной части соединения формулы (I);

5 R^{8a} выбран из группы, состоящей из водорода, C_1 - C_6 алкила и C_1 - C_6 галогеналкила;

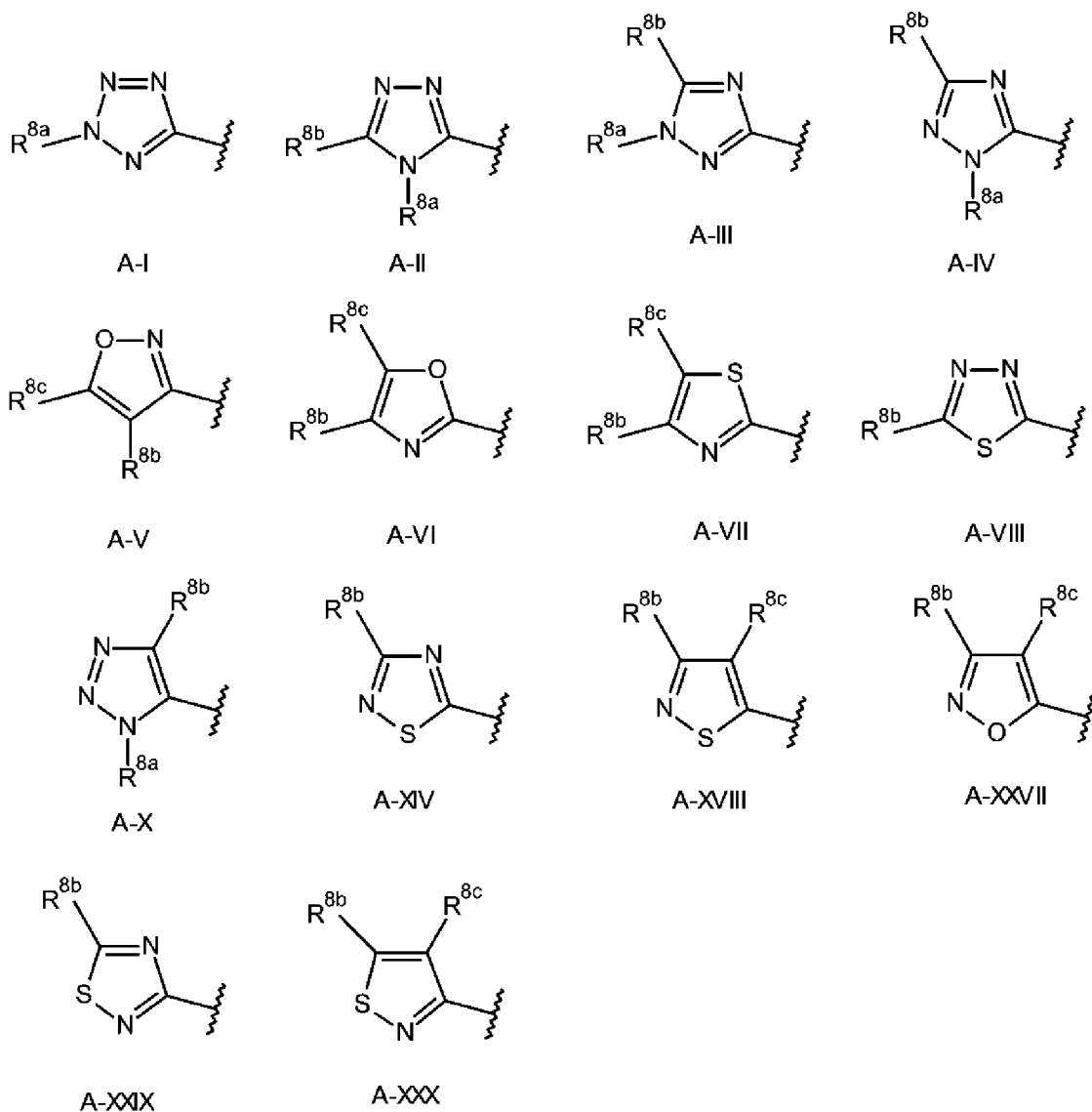
каждый из R^{8b} , R^{8c} и R^{8d} независимо выбран из группы, состоящей из водорода, галогена, нитро, циано, $-NH_2$, $-NHR^7$, $-N(R^7)_2$, $-OH$, $-OR^7$, $-S(O)_rR^{15}$, $-NR^6S(O)_2R^{15}$, $-C(O)OR^{10}$, $-C(O)R^{15}$, $-C(O)NR^{16}R^{17}$, $-S(O)_2NR^{16}R^{17}$, C_1 - C_6 алкила и C_1 -

10 C_6 галогеналкила;

и R^6 , R^7 , R^{10} , R^{15} , R^{16} , R^{17} и r определены в п. 1.

8. Соединение по любому из пп. 1-7, где А выбран из группы, состоящей из формул А-I - А-VIII, А-X, А-XIV, А-XVIII, А-XXVII, А-XXIX и А-XXX, указанных ниже,

15



где волнистая линия обозначает точку присоединения к остальной части соединения формулы (I);

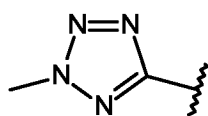
- 5 R^{8a} представляет собой водород или C_1 - C_6 алкил;
 каждый из R^{8b} , R^{8c} и R^{8d} независимо выбран из группы, состоящей из водорода, галогена, циано, $-NH_2$, $-NHR^7$, $-N(R^7)_2$, $-OH$, $-OR^7$, $-S(O)_rR^{15}$, $-C(O)OR^{10}$, $-C(O)R^{15}$, $-C(O)NR^{16}R^{17}$, C_1 - C_6 алкила и C_1 - C_6 галогеналкила;
 и R^7 , R^{10} , R^{15} , R^{16} , R^{17} и r определены в п. 1.

10

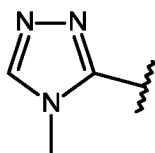
9. Соединение по п. 7 или п. 8, где R^{8a} представляет собой водород или метил, и каждый из R^{8b} , R^{8c} и R^{8d} независимо выбран из группы, состоящей из водорода,

хлора, циано, $-\text{NH}_2$, $-\text{NHMe}$, $-\text{OMe}$, $-\text{C(O)OEt}$, $-\text{C(O)NHMe}$, метила, изопропила и трифторметила.

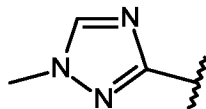
10. Соединение по любому из пп. 1-9, где А выбран из группы, состоящей из формул A-Ia, A-IIa, A-IIIa, A-IVa, A-Va, A-VIa, A-VIb, A-VIc, A-VIIa, A-VIIb, A-VIIIa, A-VIIIb, A-Xa, A-XIVa, A-XVIIIa, A-XVIIIb, A-XXVIIa, A-XXIXa и A-XXXa, указанных ниже,



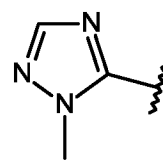
A-Ia



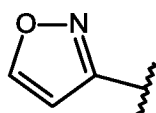
A-IIa



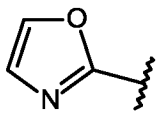
A-IIIa



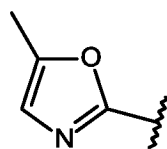
A-IVa



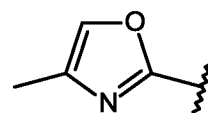
A-Va



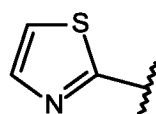
A-VIa



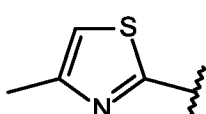
A-VIb



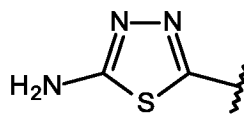
A-VIc



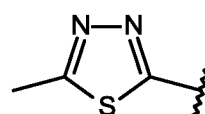
A-VIIa



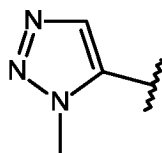
A-VIIb



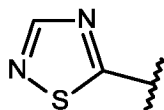
A-VIIIa



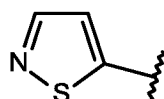
A-VIIIb



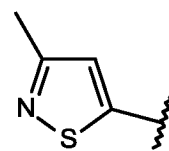
A-Xa



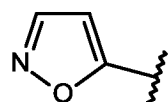
A-XIVa



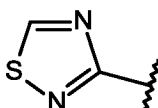
A-XVIIIa



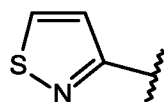
A-XVIIIb



A-XXVIIa



A-XXIXa



A-XXXa

11. Соединение по любому из пп. 1-10, где Z выбран из группы, состоящей из $-\text{C(O)OR}^{10}$, $-\text{CH}_2\text{OH}$, $-\text{C(O)NHS(O)}_2\text{R}^{12}$, $-\text{S(O)}_2\text{OR}^{10}$, $-\text{OS(O)}_2\text{OR}^{10}$, $-\text{NR}^6\text{S(O)}_2\text{OR}^{10}$ и $-\text{P(O)(R}^{13})\text{(OR}^{10})$.

12. Соединение по любому из пп. 1-11, где Z представляет собой $-C(O)OH$ или $-S(O)_2OH$.

5 13. Гербицидная композиция, содержащая гербицидно эффективное количество соединения формулы (I) по любому из пп. 1-12 и агрохимически приемлемый разбавитель или носитель.

10 14. Композиция по п. 13, дополнительно содержащая по меньшей мере один дополнительный активный ингредиент.

15 15. Способ контроля роста нежелательных растений, включающий применение соединения формулы (I) по любому из пп. 1-12 или гербицидной композиции по п. 13 или п. 14 в отношении нежелательных растений или места их произрастания.