

(19)



**Евразийское
патентное
ведомство**

(21) **202192143** (13) **A1**

(12) ОПИСАНИЕ ИЗОБРЕТЕНИЯ К ЕВРАЗИЙСКОЙ ЗАЯВКЕ

(43) Дата публикации заявки
2021.12.17

(22) Дата подачи заявки
2020.02.05

(51) Int. Cl. *A01N 43/713* (2006.01)
A01N 43/76 (2006.01)
A01N 43/78 (2006.01)
A01N 43/80 (2006.01)
A01N 43/82 (2006.01)
A01N 57/20 (2006.01)
C07D 401/04 (2006.01)
C07D 413/04 (2006.01)
C07D 417/04 (2006.01)
A01P 13/00 (2006.01)

(54) ГЕРБИЦИДНЫЕ СОЕДИНЕНИЯ

(31) 1901617.9

(32) 2019.02.06

(33) GB

(86) PCT/EP2020/052814

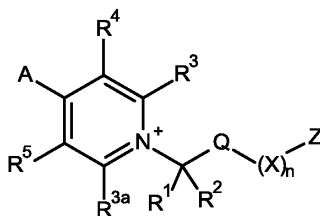
(87) WO 2020/161163 2020.08.13

(71) Заявитель:
СИНГЕНТА КРОП ПРОТЕКШН АГ
(CH)

(72) Изобретатель:
Скатт Джеймс Николас, Уиллеттс
Найджел Джеймс, Дилейни Джон
Стивен (GB)

(74) Представитель:
Веселицкий М.Б., Веселицкая И.А.,
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

202192143

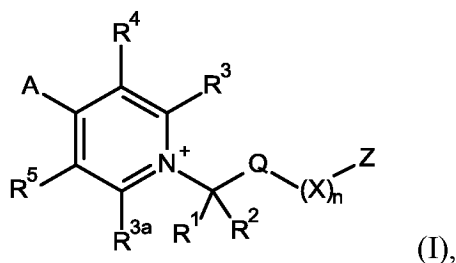
202192143

A1

ГЕРБИЦИДНЫЕ СОЕДИНЕНИЯ

5 Настоящее изобретение относится к гербицидно активным производным пиридиния, 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 производные пиридиния формулы (I), определенные в данном документе, проявляют на удивление хорошую гербицидную активность. Таким образом, в соответствии с настоящим изобретением представлено применение соединения формулы (I) или его агрономически приемлемой соли или цвиттер-ионных форм в качестве гербицида:



20 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 $-S(O)_tR^{15}$;

25 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

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

10

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

R^3 , R^{3a} , 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 $-N(R^6)_2$;

25

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 $-C(O)NR^{16}R^{17}$;

30

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 при этом указанный фенил

необязательно замещен 1, 2 или 3 заместителями R^9 , которые могут быть одинаковыми или различными; или

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

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 где гетероарил, если это возможно, может быть необязательно замещен 1, 2 или 3 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, $-NH_2$, $-NHR^7$, $-N(R^7)_2$, $-OH$, $-OR^7$, $-S(O)_rR^{15}$, $-NR^6S(O)_2R^{15}$, $-C(O)OR^{10}$, $-C(O)R^{15}$, $-C(O)NR^{16}R^{17}$, $-S(O)_2NR^{16}R^{17}$, 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, по отдельности 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;

и/или

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-, 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 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;

5 X выбран из группы, состоящей из C_3 - C_6 циклоалкила, фенила, 5- или 6-членного гетероарила, который содержит 1, 2, 3 или 4 гетероатома, по отдельности выбранные из N, O и S, и 4-6-членного гетероциклила, который содержит 1, 2 или 3 гетероатома, по
10 отдельности 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 , Q и Z могут быть присоединены в любом положении указанных циклоалкильных, фенильных, гетероарильных или гетероциклильных фрагментов;

n равняется 0 или 1;

15 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;

20

R^{10} выбран из группы, состоящей из водорода, C_1 - C_6 алкила, фенила и бензила, и при
25 этом 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 при этом
30 указанный фенил необязательно замещен 1, 2 или 3 заместителями R^9 , которые могут быть одинаковыми или различными;

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

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;

5

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

10 R^{15a} представляет собой фенил, где указанный фенил 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

15 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, отдельно выбранный из N, O и S; и

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 при этом указанный фенил необязательно замещен 1, 2

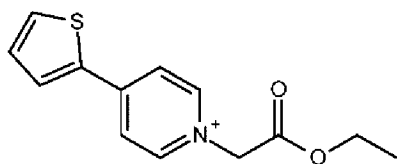
20 или 3 заместителями R^9 , которые могут быть одинаковыми или различными;

и

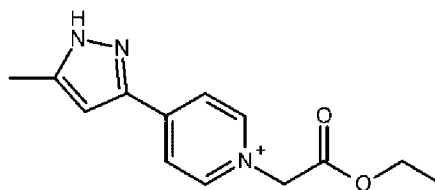
r равняется 0, 1 или 2.

25

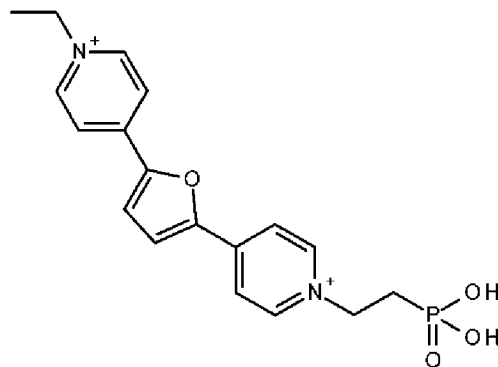
Известны определенные соединения формулы (I) (или их агрономически приемлемая соль или цвиттер-ионные формы).



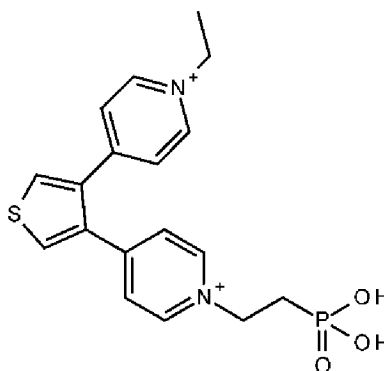
этил-2-[4-(2-тиенил)пиридин-1-ий-1-ил]ацетат,



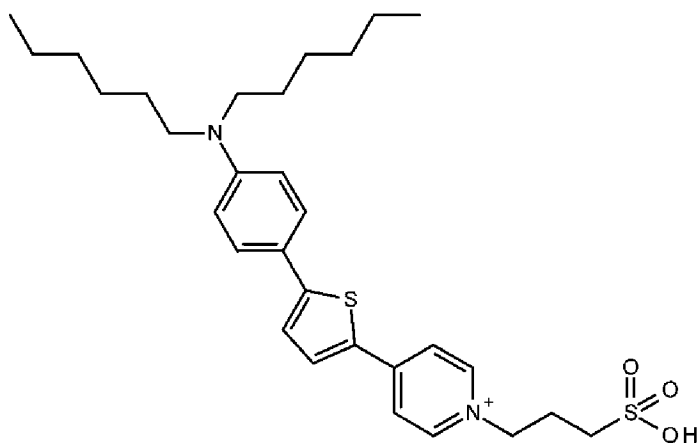
этил-2-[4-(5-метил-1Н-пиразол-3-ил)пиридин-1-ий-1-ил]ацетат,



2-[4-[5-(1-этилпиридин-1-ий-4-ил)-2-фурил]пиридин-1-ий-1-ил]этилфосфоная кислота,



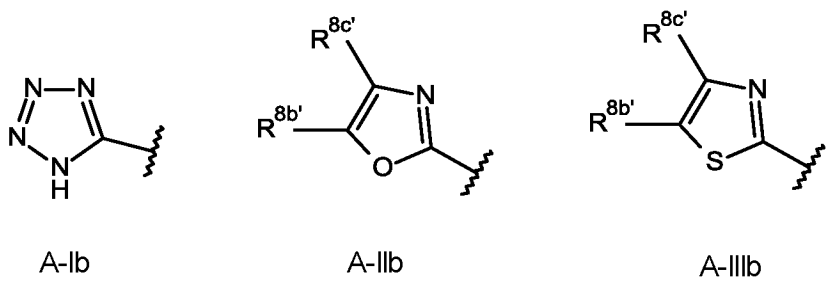
2-[4-[4-(1-этилпиридин-1-ий-4-ил)-3-тиенил]пиридин-1-ий-1-ил]этилфосфоная кислота и



3-[4-[5-[4-(дигексиламино)фенил]-2-тиенил]пиридин-1-ий-1-ил]пропан-1-сульфоная кислота.

Таким образом, во втором аспекте настоящего изобретения предусмотрено соединение формулы (I), где:

i) A не выбран из группы, состоящей из формул A-Ib – A-IIIb ниже,



5 где каждый $R^{8b'}$ независимо выбран из группы, состоящей из фенила, 4-метоксифенила, 4-бутоксифенила, 4-фторфенила и метокси, и каждый $R^{8c'}$ независимо представляет собой водород или метил;

или

10

ii) соединение формулы (I) не выбрано из группы, состоящей из этил-2-[4-(2-тиенил)пиридин-1-ий-1-ил]ацетата, этил-2-[4-(5-метил-1Н-пиразол-3-ил)пиридин-1-ий-1-ил]ацетата, 2-[4-[5-(1-этилпиридин-1-ий-4-ил)-2-фурил]пиридин-1-ий-1-ил]этилфосфоновой кислоты, 2-[4-[4-(1-этилпиридин-1-ий-4-ил)-3-тиенил]пиридин-1-ий-1-ил]этилфосфоновой кислоты и 3-[4-[5-[4-(дигексиламино)фенил]-2-тиенил]пиридин-1-ий-1-ил]пропан-1-сульфоновой кислоты, показанной выше.

15

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

20

25

В соответствии с четвертым аспектом настоящего изобретения предусмотрен способ контроля или предупреждения роста нежелательных растений, где гербицидно эффективное количество соединения формулы (I) или композицию, содержащую

данное соединение в качестве активного ингредиента, применяют в отношении растений, их частей или места их произрастания.

5 В соответствии с пятым аспектом настоящего изобретения предусмотрено применение соединения формулы (I), как определено в данном документе, для предуборочной десикации сельскохозяйственных культур.

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

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

15 Применяемый в данном документе термин "гидроксид" означает группу -OH.

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

20 Применяемый в данном документе термин "C₁-C₆алкил" относится к углеводородному радикалу с прямой или разветвленной цепью, состоящему 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*-бутил).

25 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 C₁-C₄алкокси включают без ограничения метокси, этокси, пропокси, 30 изопропокси и *трет*-бутокси.

Применяемый в данном документе термин "C₁-C₆галогеналкил" относится к C₁-C₆алкильному радикалу, который в целом определен выше, замещенному одним или несколькими одинаковыми или различными атомами галогена. C₁-C₄галогеналкил

следует истолковывать соответствующим образом. Примеры C_1 - C_6 галогеналкила включают без ограничения хлорметил, фторметил, фторэтил, дифторметил, трифторметил и 2,2,2-трифторэтил.

- 5 Применяемый в данном документе термин " C_2 - C_6 алкенил" относится к группе, представляющей собой углеводородный радикал с прямой или разветвленной цепью, состоящей исключительно из атомов углерода и водорода, содержащей 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
10 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.

- 15 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.

- 20 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
25 истолковывать соответствующим образом. Примеры C_2 - C_6 алкинила включают без ограничения, проп-1-инил, пропаргил (проп-2-инил) и бут-1-инил.

- 30 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.

Применяемый в данном документе термин "C₁-C₃галогеналкоксиC₁-C₃алкил" относится к радикалу формулы R_b-O-R_a-, где R_b представляет собой C₁-C₃галогеналкильный радикал, который в целом определен выше, и R_a представляет собой C₁-C₃алкиленовый радикал, который в целом определен выше.

5

Применяемый в данном документе термин "C₁-C₃алкоксиC₁-C₃алкил" относится к радикалу формулы R_b-O-R_a-, где R_b представляет собой C₁-C₃алкильный радикал, который в целом определен выше, и R_a представляет собой C₁-C₃алкиленовый радикал, который в целом определен выше.

10

Применяемый в данном документе термин "C₁-C₃алкоксиC₁-C₃алкокси-" относится к радикалу формулы R_b-O-R_a-O-, где R_b представляет собой C₁-C₃алкильный радикал, который в целом определен выше, и R_a представляет собой C₁-C₃алкиленовый радикал, который в целом определен выше.

15

Применяемый в данном документе термин "C₃-C₆алкенилокси" относится к радикалу формулы -OR_a, где R_a представляет собой C₃-C₆алкенильный радикал, который в целом определен выше.

20

Применяемый в данном документе термин "C₃-C₆алкинилокси" относится к радикалу формулы -OR_a, где R_a представляет собой C₃-C₆алкинильный радикал, который в целом определен выше.

25

Применяемый в данном документе термин "гидроксиC₁-C₆алкил" относится к C₁-C₆алкильному радикалу, который в целом определен выше, замещенному одной или несколькими гидроксигруппами.

30

Применяемый в данном документе термин "C₁-C₆алкилкарбонил" относится к радикалу формулы -C(O)R_a, где R_a представляет собой C₁-C₆алкильный радикал, который в целом определен выше.

Применяемый в данном документе термин "C₁-C₆алкоксикарбонил" относится к радикалу формулы -C(O)OR_a, где R_a представляет собой C₁-C₆алкильный радикал, который в целом определен выше.

Применяемый в данном документе термин "аминокарбонил" относится к радикалу формулы -C(O)NH_2 .

- 5 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, цикlopентил и циклогексил.

10

Применяемый в данном документе термин " C_3 - C_6 галогенциклоалкил" относится к C_3 - C_6 циклоалкильному радикалу, который в целом определен выше, замещенному одним или несколькими одинаковыми или различными атомами галогена. C_3 - C_4 галогенциклоалкил следует истолковывать соответствующим образом.

15

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

- 20 Применяемый в данном документе термин "N- C_3 - C_6 циклоалкиламино" относится к радикалу формулы -NHR_a , где R_a представляет собой C_3 - C_6 циклоалкильный радикал, который в целом определен выше.

- 25 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 из азота, кислорода и серы. Гетероарильный радикал может быть связан с остальной частью молекулы посредством атома углерода или гетероатома. Примеры гетероарила включают фурил, пирролил, имидазолил, тиенил, пиразолил, тиазолил, изотиазолил, оксазолил, изоксазолил, триазолил, тетразолил, пиазинил, пиридазинил, пиримидил или пиридил.
- 30

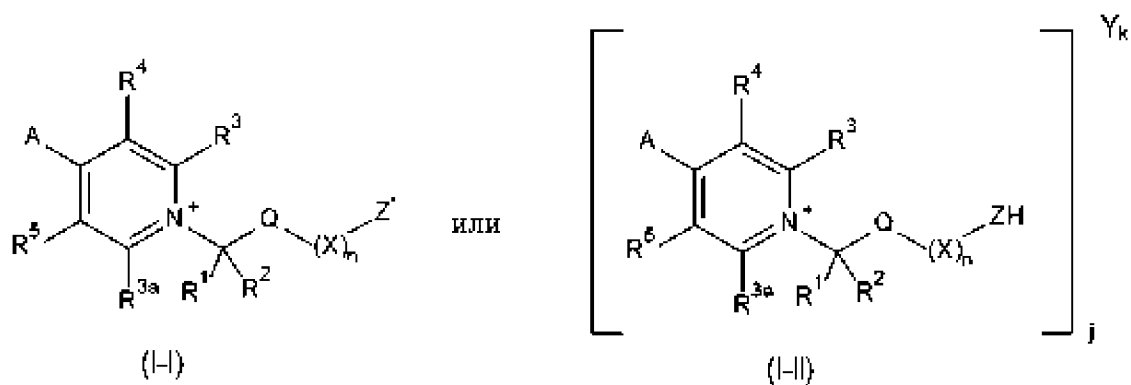
За исключением случаев, когда явно указано иное, применяемый в данном документе термин "гетероцикл" или "гетероциклический" относится к стабильному 4-6-

членному неароматическому моноциклическому кольцевому радикалу, который содержит 1, 2 или 3 гетероатома, по отдельности выбранные из азота, кислорода и серы. Гетероциклический радикал может быть связан с остальной частью молекулы посредством атома углерода или гетероатома. Примеры гетероциклила включают без
 5 ограничения пирролинил, пирролидил, тетрагидрофурил, тетрагидротиенил, тетрагидротиопиранил, пиперидил, пиперазинил, тетрагидропиранил, дигидроизоксазол, диоксолан, морфолин или δ -лактамы.

Наличие одного или нескольких возможных асимметричных атомов углерода в соединении формулы (I) означает, что соединения могут встречаться в хиральных
 10 изомерных формах, т.е. энантиомерных или диастереомерных формах. Также атропоизомеры могут встречаться в результате ограниченного вращения вокруг одинарной связи. Подразумевается, что формула (I) включает все такие возможные изомерные формы и их смеси. Настоящее изобретение включает все такие возможные
 15 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
 20 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
 25 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.

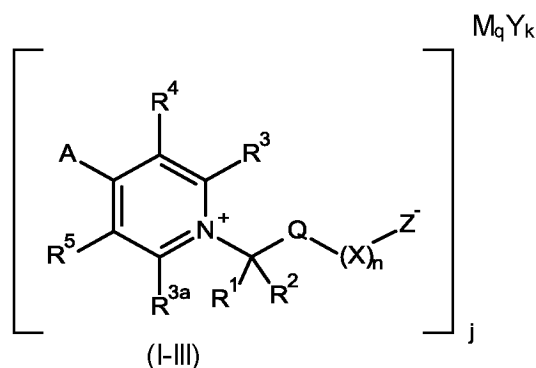
Например, соединение формулы (I), где Z предусматривает кислотный протон, может
 30 существовать в виде цвиттер-иона, что соответствует соединению формулы (I-I), или в виде агрономически приемлемой соли, что соответствует соединению формулы (I-II), как показано ниже:



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.

5

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



10

где Y представляет собой агрономически приемлемый анион, M представляет собой агрономически приемлемый катион (в дополнение к катиону пиридиния), 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.

15

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

20

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 R^1 , R^2 , 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, содержащем A , является протонированным.

Подходящие агрономически приемлемые соли по настоящему изобретению, представленные анионом Y , включают без ограничения хлорид, бромид, йодид, 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, гептадеканоат, гексадеканоат, гидросульфат, гидроксид, гидроксинафтоат, изетионат, лактат, лактобионат, лаурат, малат, малеат, манделат, мезилат, метандисульфонат, метилсульфат, мукат, мирилат, 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 M , 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, диоксиламин, дипропанолламин, дипропаргиламин, дипропиламин, додециламин, этанолламин, этиламин, этилбутиламин, этилендиамин, этилгептиламин, этилоктиламин, этилпропанолламин, гептадециламин, гептиламин, гексадециламин, гексенил-2-амин, гексиламин, гексилгептиламин, гексиллактиламин, гистидин, индолин, изоамиламин,

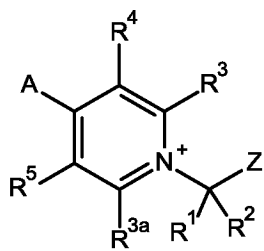
изобутаноламин, изобутиламин, изопропаноламин, изопропиламин, лизин, меглюмин, метоксиэтиламин, метиламин, метилбутиламин, метилэтиламин, метилгексиламин, метилизопропиламин, метилнониламмин, метилоктадециламин, метилпентадециламин, морфолин, N,N-диэтилэтанолламин, N-метилпиперазин, нониламин, октадециламин, октиламин, олеиламин, пентадециламин, пентенил-2-амин, феноксиэтиламин, пиколин, пиперазин, пиперидин, пропаноламин, 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) выделяют соли, если Y представляет собой хлорид, бромид, йодид, гидроксид, бикарбонат, ацетат, пентафторпропионат, трифлат, трифторацетат, метилсульфат, тозилат и нитрат, где j и k равняются 1. 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.

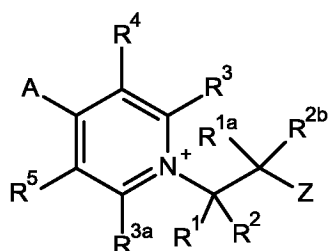
Соединения формулы (I), где m равняется 0, и n равняется 0, могут быть представлены соединением формулы (I-Ia), как показано ниже:



(I-Ia)

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

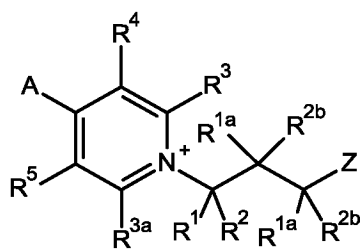
Соединения формулы (I), где m равняется 1, и n равняется 0, могут быть представлены соединением формулы (I-Ib), как показано ниже:



(I-Ib)

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

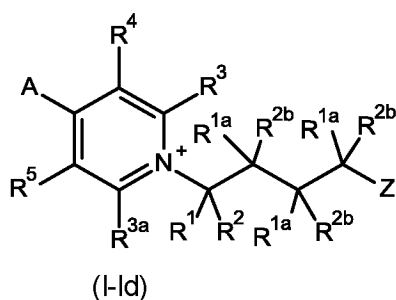
Соединения формулы (I), где m равняется 2, и n равняется 0, могут быть представлены соединением формулы (I-Ic), как показано ниже:



(I-Ic)

где R^1 , R^2 , R^{1a} , R^{2b} , R^3 , R^{3a} , 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:



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

В следующем перечне представлены определения, в том числе предпочтительные определения, для заместителей n, m, r, A, Q, X, Z, R^1 , R^2 , R^{1a} , R^{2b} , R^3 , R^{3a} , 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} 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.

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 $-S(O)_tR^{15}$.

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, галогена и C_1 - C_6 алкила.

Еще более предпочтительно R^1 представляет собой водород или C_1 - C_6 алкил. Еще более предпочтительно R^1 представляет собой водород или метил. Наиболее предпочтительно R^1 представляет собой водород.

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.

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.

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.

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

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

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 $-S(O)_tR^{15}$. 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, $-OH$, $-NH_2$ и $-NHR^7$. Более предпочтительно каждые R^{1a} и R^{2b} независимо выбраны из группы, состоящей из водорода, C_1 - C_6 алкила, $-OH$ и $-NH_2$. Еще более предпочтительно каждые R^{1a} и R^{2b} независимо выбраны из группы, состоящей из водорода, метила, $-OH$ и $-NH_2$.

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.

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

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 гетероцикл, 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.

15 R^3 , R^{3a} , 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 $-N(R^6)_2$. Предпочтительно R^3 , R^{3a} , R^4 и R^5 независимо выбраны из группы, состоящей из водорода, галогена, циано, 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 $-N(R^6)_2$. Более предпочтительно R^3 , R^{3a} , R^4 и R^5 независимо выбраны из группы, состоящей из водорода, галогена, циано, C_1 - C_6 алкила и C_1 - C_6 фторалкила. Еще более предпочтительно R^3 , R^{3a} , R^4 и R^5 независимо выбраны из группы, состоящей из водорода, хлора, фтора, брома, циано, метила и трифторметила. Еще более предпочтительно R^3 , R^{3a} , R^4 и R^5 независимо выбраны из группы, состоящей из водорода, хлора, фтора, брома и метила. Все еще более предпочтительно R^3 , R^{3a} , R^4 и R^5 независимо выбраны из группы, состоящей из водорода, хлора и фтора. Наиболее предпочтительно R^3 , R^{3a} , R^4 и R^5 представляют собой водород.

30 В одном варианте осуществления R^3 и R^{3a} представляют собой водород, и R^4 и R^5 независимо выбраны из группы, состоящей из водорода, брома, хлора, фтора и $-S(O)_2Me$ (предпочтительно, водорода, хлора и фтор).

Каждый R^6 независимо выбран из водорода и C_1 - C_6 алкила. Предпочтительно каждый R^6 независимо выбран из водорода и метила.

5 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 $-C(O)NR^{16}R^{17}$. Предпочтительно каждый R^7 независимо выбран из группы, состоящей из C_1 - C_6 алкила, $-C(O)R^{15}$ и $-C(O)NR^{16}R^{17}$. Более предпочтительно каждый R^7 представляет собой C_1 - C_6 алкил. Наиболее предпочтительно каждый R^7 представляет собой метил.

10 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 $-C(O)NR^{16}R^{15a}$. Предпочтительно каждый R^{7a} независимо представляет собой $-C(O)R^{15}$ или $-C(O)NR^{16}R^{17}$.

15 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 при этом указанный фенил необязательно замещен 1, 2 или 3 заместителями R^9 , которые могут быть одинаковыми или различными. Предпочтительно R^{7b} и R^{7c} независимо выбраны из группы, состоящей из C_1 - C_6 алкила, $-C(O)R^{15}$ и $-C(O)NR^{16}R^{17}$. Более предпочтительно R^{7b} и R^{7c} представляют собой C_1 - C_6 алкил. Наиболее предпочтительно R^{7b} и R^{7c} представляют собой метил.

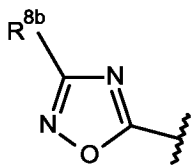
20 Альтернативно R^{7b} и R^{7c} вместе с атомом азота, к которому они присоединены, образуют 4-6-членное гетероциклическое кольцо, которое необязательно содержит один дополнительный гетероатом, отдельно выбранный из N, O и S. Предпочтительно R^{7b} и R^{7c} вместе с атомом азота, к которому они присоединены, 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 пирролидинильную, оксазолидинильную, имидазолидинильную, пиперидильную, пиперазинильную или морфолинийную группу.

30 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 где

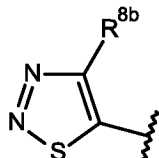
гетероарил, если это возможно, может быть необязательно замещен 1, 2 или 3 заместителями R^8 , которые могут быть одинаковыми или различными.

Предпочтительно А представляет собой гетероарил, выбранный из группы, состоящей из 1,2,4-оксадиазол-5-ила, тиадиазол-5-ила, 1,2,4-тиадиазол-5-ила, тиадиазол-4-ила, 1,2,4-тиадиазол-3-ила, 1,2,5-тиадиазол-3-ила, 1,3,4-тиадиазол-2-ила, 1,3,4-оксадиазол-2-ила, 1,2,4-оксадиазол-3-ила, 1,2,5-оксадиазол-3-ила, 1,2,4-триазол-3-ила, 1,2,4-триазол-5-ила, триазол-4-ила, триазол-5-ила, 2-метилтетразол-5-ила, 1-метилтетразол-5-ила, тиазол-2-ила, тиазол-4-ила, изотиазол-5-ила, изотиазол-4-ила, изотиазол-3-ила, оксазол-2-ила, оксазол-4-ила, изоксазол-3-ила, изоксазол-5-ила, имидазол-5-ила, имидазол-2-ила, 3-фурила, 2-фурила, 3-тиенила, пиразол-5-ила, пиразол-3-ила и 2-тиенила, где гетероарил может, если это возможно, быть необязательно замещен 1, 2 или 3 заместителями R^8 , которые могут быть одинаковыми или различными.

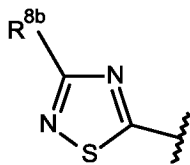
Более предпочтительно А выбран из группы, состоящей из формул А-I – А-XXXV ниже,



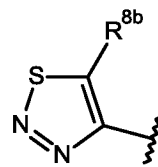
A-I



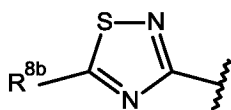
A-II



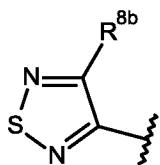
A-III



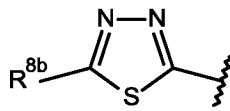
A-IV



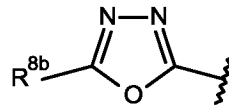
A-V



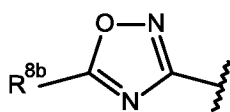
A-VI



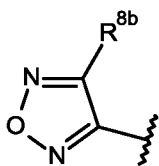
A-VII



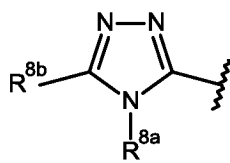
A-VIII



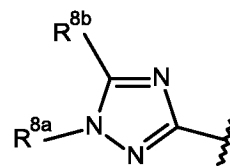
A-IX



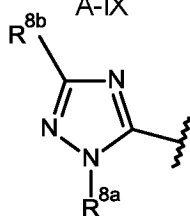
A-X



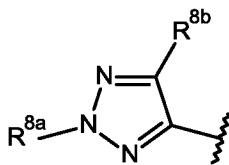
A-XI



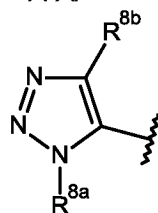
A-XII



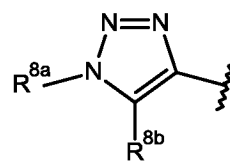
A-XIII



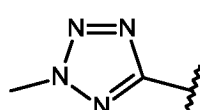
A-XIV



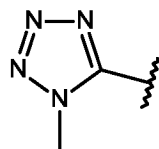
A-XV



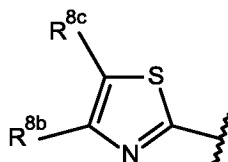
A-XVI



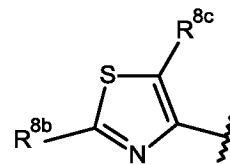
A-XVII



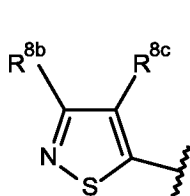
A-XVIII



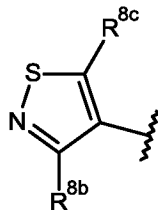
A-XIX



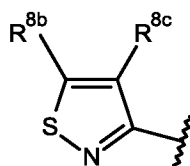
A-XX



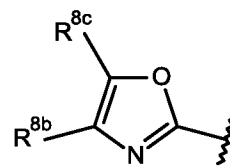
A-XXI



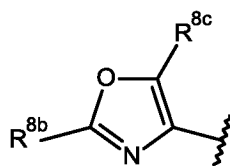
A-XXII



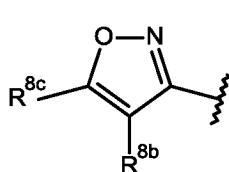
A-XXIII



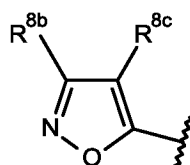
A-XXIV



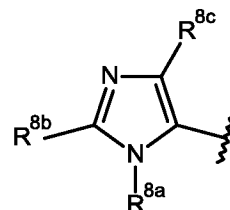
A-XXV



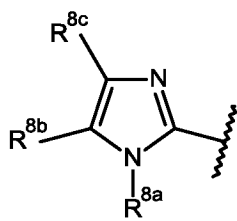
A-XXVI



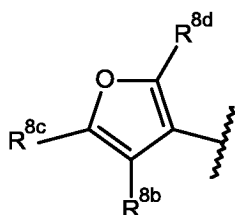
A-XXVII



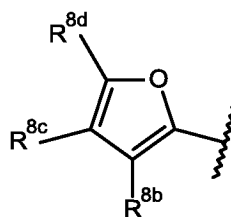
A-XXVIII



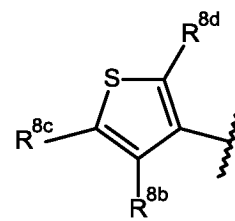
A-XXIX



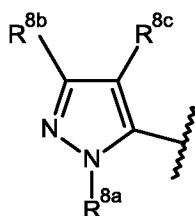
A-XXX



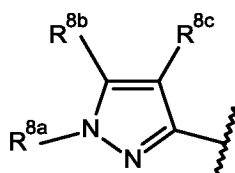
A-XXXI



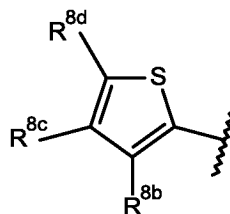
A-XXXII



A-XXXIII



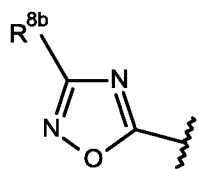
A-XXXIV



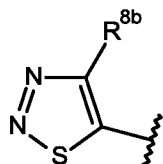
A-XXXV

где изломанная линия обозначает точку присоединения к соединению формулы (I), и
 5 R^{8a} , R^{8b} , R^{8c} , R^{8d} , R^{10} , R^{15} , R^{16} , R^{17} и γ 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-XXXV).

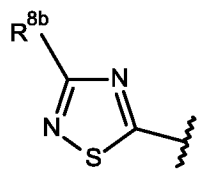
Еще более предпочтительно A выбран из группы, состоящей из формул A-I – A-XXXII,
 10 указанных ниже,



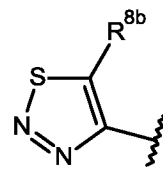
A-I



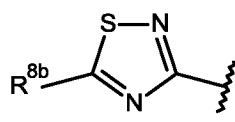
A-II



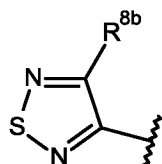
A-III



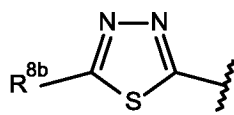
A-IV



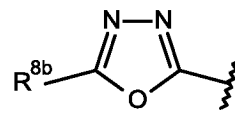
A-V



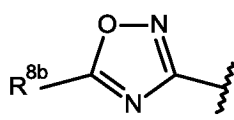
A-VI



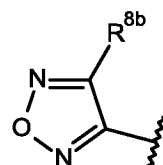
A-VII



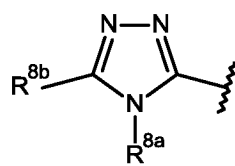
A-VIII



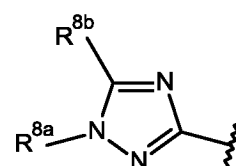
A-IX



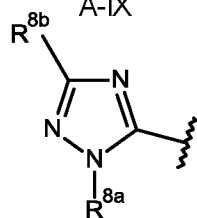
A-X



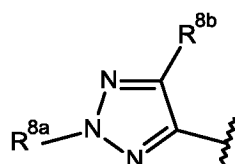
A-XI



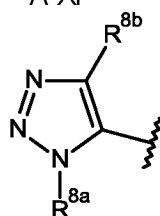
A-XII



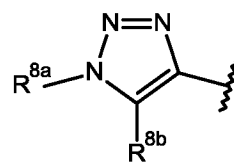
A-XIII



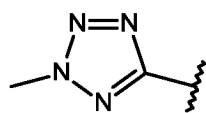
A-XIV



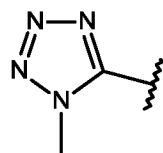
A-XV



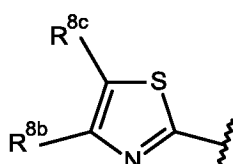
A-XVI



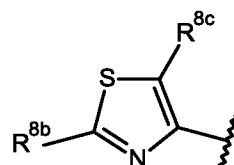
A-XVII



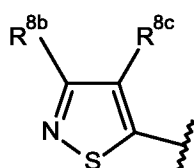
A-XVIII



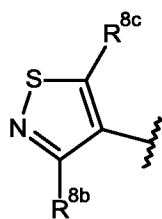
A-XIX



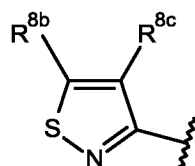
A-XX



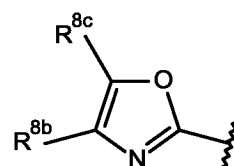
A-XXI



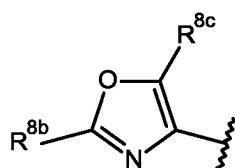
A-XXII



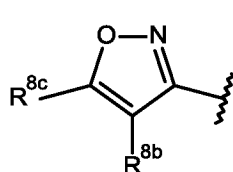
A-XXIII



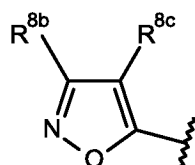
A-XXIV



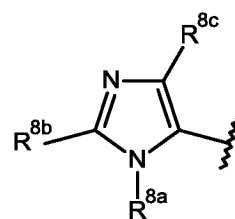
A-XXV



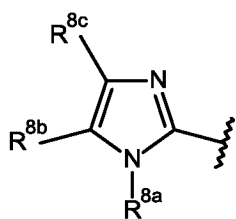
A-XXVI



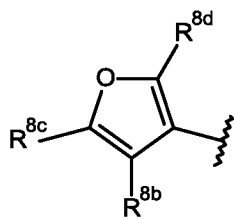
A-XXVII



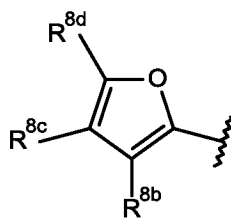
A-XXVIII



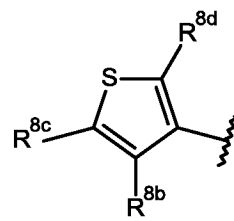
A-XXIX



A-XXX



A-XXXI

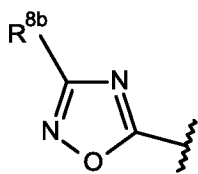


A-XXXII

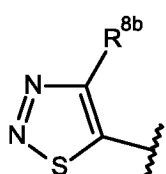
где изломанная линия обозначает точку присоединения к соединению формулы (I), и R^{8a} , R^{8b} , R^{8c} , R^{8d} , R^{10} , R^{15} , R^{16} , R^{17} и Γ определены в данном документе.

5

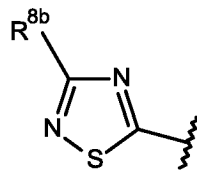
Еще более предпочтительно А выбран из группы, состоящей из формул А-I – А-X, А-XVII, А-XVIII, А-XIX, А-XXIII, А-XXIV и А-XXVII ниже,



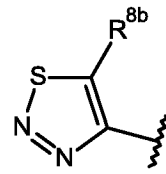
A-I



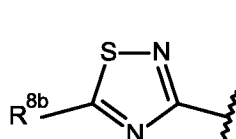
A-II



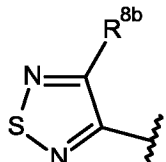
A-III



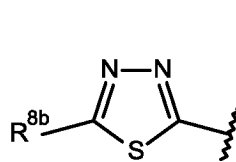
A-IV



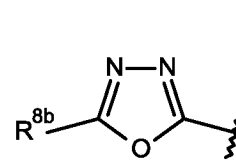
A-V



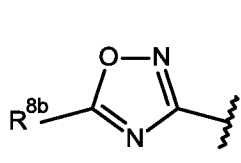
A-VI



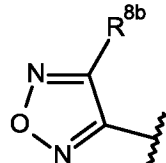
A-VII



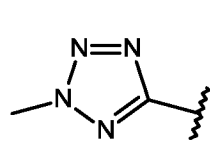
A-VIII



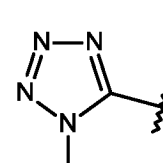
A-IX



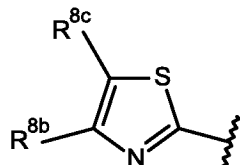
A-X



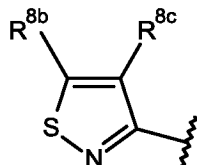
A-XVII



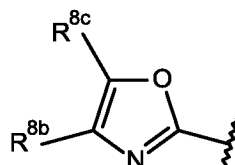
A-XVIII



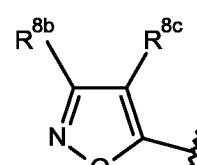
A-XIX



A-XXIII



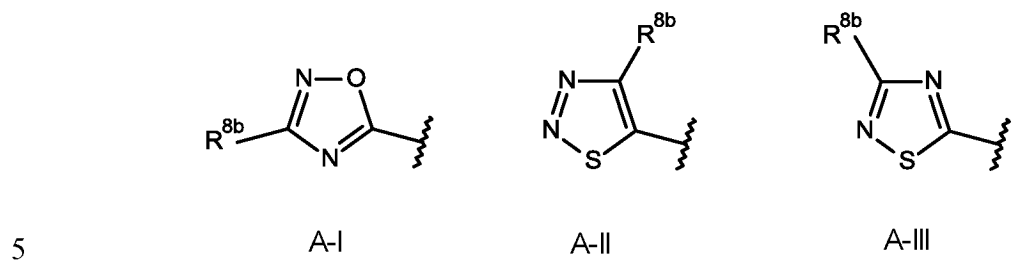
A-XXIV



A-XXVII

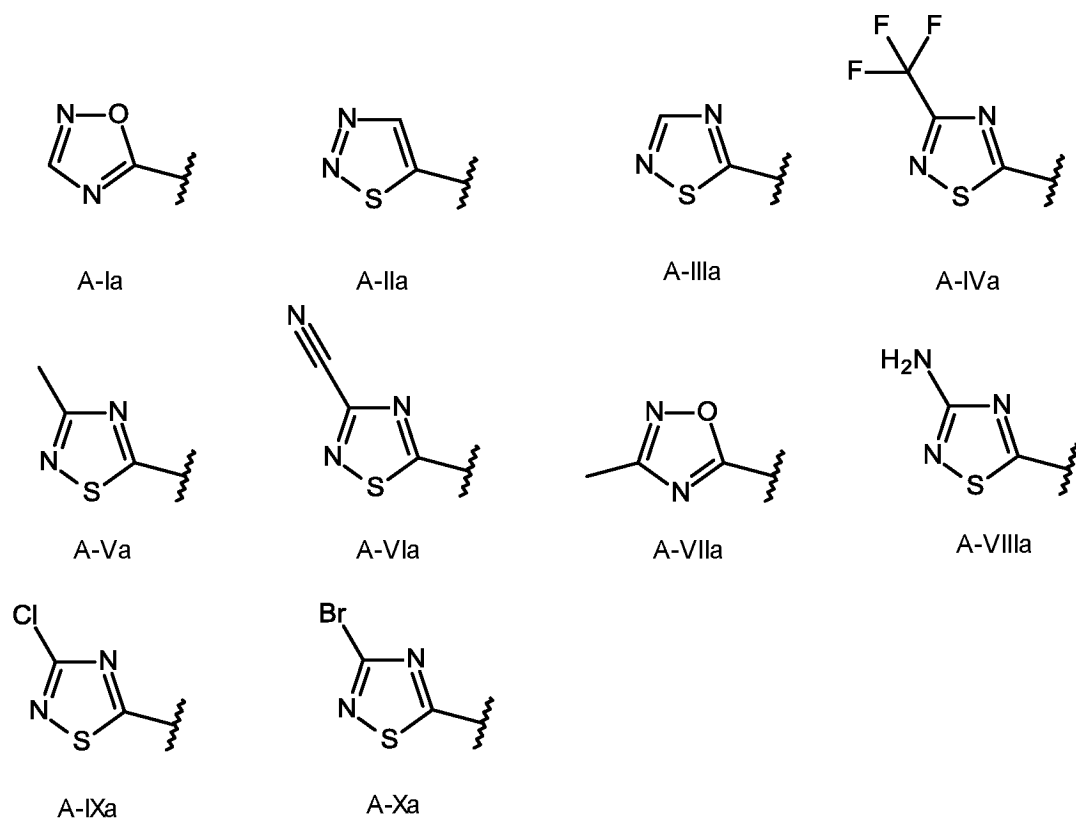
10 где изломанная линия обозначает точку присоединения к соединению формулы (I), и R^{8a} , R^{8b} , R^{8c} , R^{8d} , R^{10} , R^{15} , R^{16} , R^{17} и Γ определены в данном документе.

Все еще более предпочтительно А выбран из группы, состоящей из формул А-I – А-III ниже,



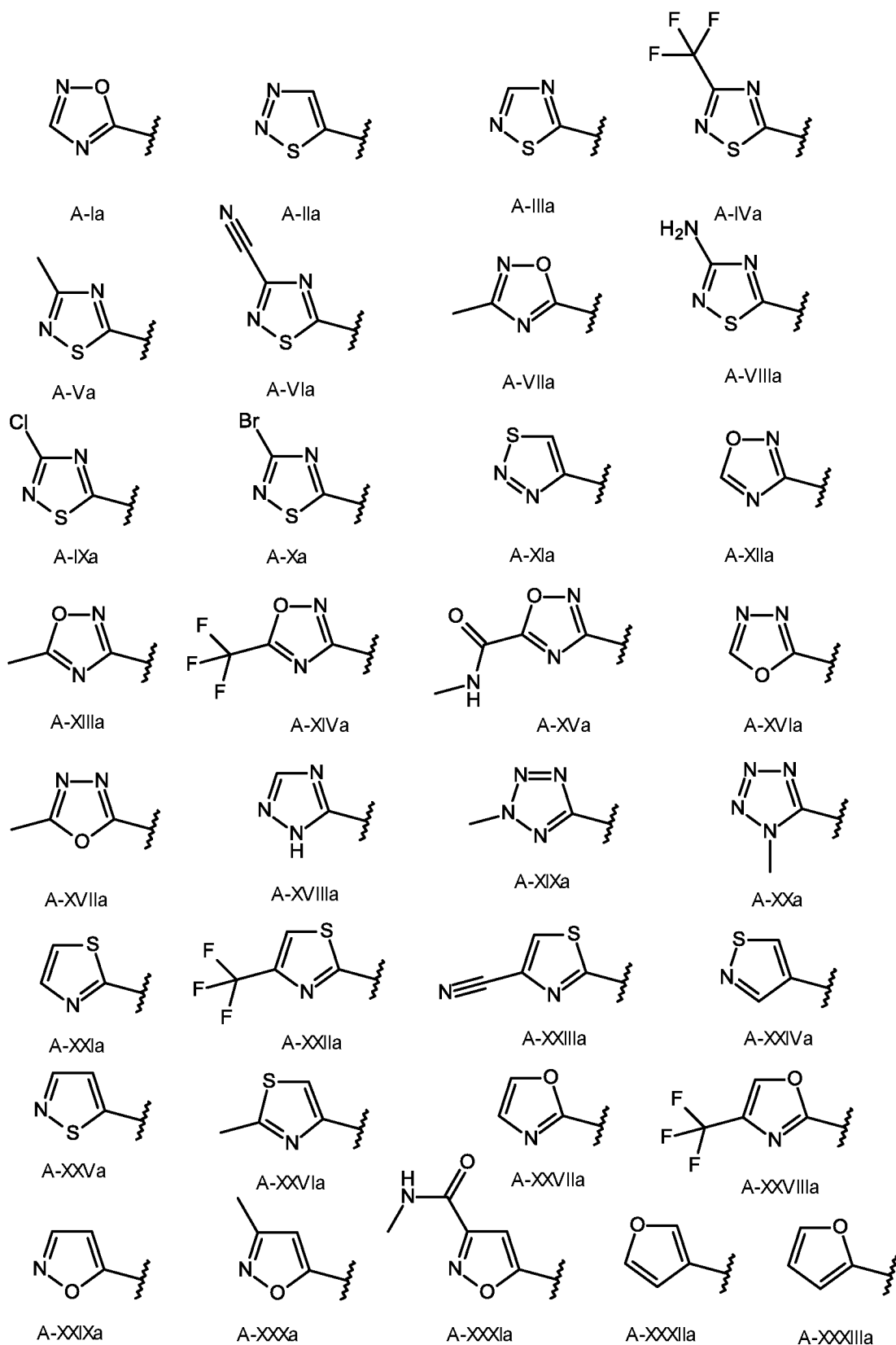
где изломанная линия обозначает точку присоединения к соединению формулы (I), и каждые R^{8b} и R^{16} и R^{17} определены в данном документе.

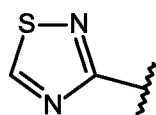
10 Дополнительно еще более предпочтительно А выбран из группы, состоящей из формул А-Ia – А-Xa ниже,



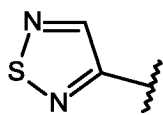
где изломанная линия обозначает точку присоединения к соединению формулы (I).

В одном варианте осуществления А выбран из группы, состоящей из формул А-Ia – А-XXXXVIIa ниже

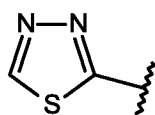




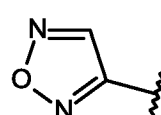
A-XXXIVa



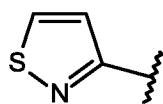
A-XXXVa



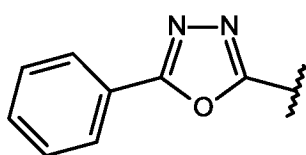
A-XXXVIa



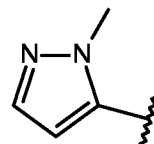
A-XXXVIIa



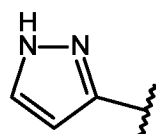
A-XXXVIIIa



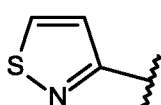
A-XXXIXa



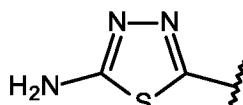
A-XXXXa



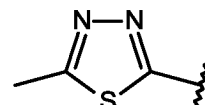
A-XXXXIa



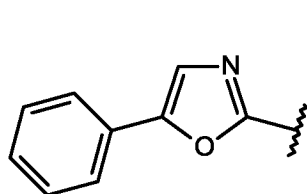
A-XXXXIIa



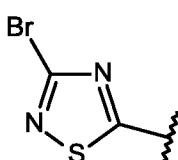
A-XXXXIIIa



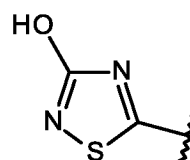
A-XXXXIVa



A-XXXXVa



A-XXXXVIa



A-XXXXVIIa

где изломанная линия обозначает точку присоединения к соединению формулы (I).

- 5 Если А замещен на одном или нескольких атомах 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-, 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, по отдельности выбранных из N, O и S, и при этом указанный фенил, гетероциклил или
- 10
- 15

гетероарил необязательно замещены 1, 2 или 3 заместителями R^9 , которые могут быть одинаковыми или различными.

Предпочтительно, если А замещен на одном или нескольких атомах 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, N - C_3 - C_6 циклоалкиламино, $-C(R^6)=NOR^6$, фенила и 5- или 6-членного гетероарила, который содержит 1, 2, 3 или 4 гетероатома, по отдельности выбранные из N, O и S, и при этом указанный фенил или гетероарил необязательно замещены 1 или 2 заместителями R^9 , которые могут быть одинаковыми или различными.

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, $-NH_2$, $-NHR^7$, $-N(R^7)_2$, $-OH$, $-OR^7$, $-S(O)_tR^{15}$, $-NR^6S(O)_2R^{15}$, $-C(O)OR^{10}$, $-C(O)R^{15}$, $-C(O)NR^{16}R^{17}$, $-S(O)_2NR^{16}R^{17}$, C_1 - C_6 алкила, C_1 - C_6 галогеналкила, C_3 - C_6 циклоалкила, C_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- и C_1 - C_6 галогеналкокси.

Еще более предпочтительно, если А замещен на одном или нескольких атомах углерода в кольце, каждый R^8 независимо выбран из группы, состоящей из галогена, нитро, циано, $-NH_2$, $-OH$, $-S(O)_tR^{15}$, $-C(O)OR^{10}$, $-C(O)R^{15}$, $-C(O)NR^{16}R^{17}$, $-S(O)_2NR^{16}R^{17}$, C_1 - C_6 алкила и C_1 - C_6 галогеналкила.

Все еще более предпочтительно, если А замещен на одном или нескольких атомах углерода в кольце, каждый R^8 независимо выбран из группы, состоящей из галогена, циано, $-NH_2$, $-OH$, $-C(O)NR^{16}R^{17}$, C_1 - C_6 алкила и C_1 - C_6 галогеналкила.

Все еще более предпочтительно, если А замещен на одном или нескольких атомах углерода в кольце, каждый R^8 независимо выбран из группы, состоящей из галогена, циано, $-NH_2$, $-C(O)NR^{16}R^{17}$, C_1 - C_6 алкила и C_1 - C_6 галогеналкила.

Дополнительно еще более предпочтительно каждый R^8 независимо выбран из группы, состоящей из брома, хлора, фтора, циано, $-NH_2$, $-C(O)NH_2$, $-C(O)NHMe$, $-C(O)N(Me)_2$, метила и трифторметила.

5

Наиболее предпочтительно, если А замещен на одном или нескольких атомах углерода в кольце, каждый R^8 независимо выбран из группы, состоящей из брома, $-NH_2$, $-C(O)NHMe$, метила и трифторметила.

10 В одном варианте осуществления, если А замещен на одном или нескольких атомах углерода в кольце, каждый R^8 независимо выбран из группы, состоящей из брома, циано, $-NH_2$, $-C(O)NHMe$, метила, трифторметила и фенила (предпочтительно каждый R^8 независимо выбран из группы, состоящей из $-C(O)NHMe$, метила и трифторметила).

15 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-, 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 и C_3 -
20 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 каждый R^8 представляет собой C_1 - C_6 алкил или C_1 - C_6 галогеналкил. Еще более предпочтительно R^8 представляет собой C_1 - C_6 алкил. Наиболее предпочтительно R^8 представляет собой метил.

25 Если А выбран из группы, состоящей из формул А-I – А-XXXV, R^{8a} (замещенный на атоме азота в кольце) выбран из группы, состоящей из водорода, C_1 - C_6 алкила и C_1 - C_6 галогеналкила, и
каждые R^{8b} , R^{8c} и R^{8d} (замещенные на атоме углерода в кольце) независимо выбраны из
группы, состоящей из водорода, галогена, нитро, циано, $-NH_2$, $-S(O)_2R^{15}$, $-C(O)OR^{10}$, $-$
30 $C(O)R^{15}$, $-C(O)NR^{16}R^{17}$, $-S(O)_2NR^{16}R^{17}$, C_1 - C_6 алкила и C_1 - C_6 галогеналкила.
Предпочтительно R^{8a} представляет собой водород или C_1 - C_6 алкил, и каждые R^{8b} , R^{8c} и
 R^{8d} независимо выбраны из группы, состоящей из водорода, галогена, циано, $-NH_2$, $-$
 $C(O)NR^{16}R^{17}$, C_1 - C_6 алкила и C_1 - C_6 галогеналкила. Более предпочтительно R^{8a}
представляет собой водород или метил, и каждые R^{8b} , R^{8c} и R^{8d} независимо выбраны из

группы, состоящей из водорода, брома, хлора, фтора, циано, $-\text{NH}_2$, $-\text{C}(\text{O})\text{NH}_2$, $-\text{C}(\text{O})\text{NHMe}$, $-\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{Me})_2$, метила и трифторметила. Еще более предпочтительно R^{8a} представляет собой водород или метил, и каждые R^{8b} , R^{8c} и R^{8d} независимо выбраны из группы, состоящей из водорода, брома, $-\text{NH}_2$, $-\text{C}(\text{O})\text{NHMe}$, метила и трифторметила.

5 Еще более предпочтительно R^{8a} представляет собой водород или метил, и каждые R^{8b} , R^{8c} и R^{8d} независимо выбраны из группы, состоящей из водорода, $-\text{C}(\text{O})\text{NHMe}$, метила и трифторметила.

10 Если А выбран из группы, состоящей из формул А-I – А-XXXII, R^{8a} (замещенный на атоме азота в кольце) выбран из группы, состоящей из водорода, C_1 - C_6 алкила и C_1 - C_6 галогеналкила, и

каждые R^{8b} , R^{8c} и R^{8d} (замещенные на атоме углерода в кольце) независимо выбраны из группы, состоящей из водорода, галогена, нитро, циано, $-\text{NH}_2$, $-\text{S}(\text{O})_t\text{R}^{15}$, $-\text{C}(\text{O})\text{OR}^{10}$, $-\text{C}(\text{O})\text{R}^{15}$, $-\text{C}(\text{O})\text{NR}^{16}\text{R}^{17}$, $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}^{16}\text{R}^{17}$, C_1 - C_6 алкила и C_1 - C_6 галогеналкила.

15 Предпочтительно R^{8a} представляет собой водород или C_1 - C_6 алкил, и каждые R^{8b} , R^{8c} и R^{8d} независимо выбраны из группы, состоящей из водорода, галогена, циано, $-\text{NH}_2$, $-\text{C}(\text{O})\text{NR}^{16}\text{R}^{17}$, C_1 - C_6 алкила и C_1 - C_6 галогеналкила. Более предпочтительно R^{8a} представляет собой водород или метил, и каждые R^{8b} , R^{8c} и R^{8d} независимо выбраны из группы, состоящей из водорода, брома, хлора, фтора, циано, $-\text{NH}_2$, $-\text{C}(\text{O})\text{NH}_2$, $-\text{C}(\text{O})\text{NHMe}$, $-\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{Me})_2$, метила и трифторметила. Еще более предпочтительно R^{8a} представляет собой водород или метил, и каждые R^{8b} , R^{8c} и R^{8d} независимо выбраны из группы, состоящей из водорода, брома, $-\text{NH}_2$, $-\text{C}(\text{O})\text{NHMe}$, метила и трифторметила. Еще более предпочтительно R^{8a} представляет собой водород или метил, и каждые R^{8b} , R^{8c} и R^{8d} независимо выбраны из группы, состоящей из водорода, $-\text{C}(\text{O})\text{NHMe}$, метила и трифторметила.

20

25

Если А выбран из группы, состоящей из формул А-I – А-X, А-XVII, А-XVIII, А-XIX, А-XXIII, А-XXIV и А-XXVII, R^{8a} (замещенный на атоме азота в кольце) выбран из группы, состоящей из водорода, C_1 - C_6 алкила и C_1 - C_6 галогеналкила, и каждые R^{8b} , R^{8c} и R^{8d} (замещенные на атоме углерода в кольце) независимо выбраны из группы, состоящей из водорода, галогена, нитро, циано, $-\text{NH}_2$, $-\text{S}(\text{O})_t\text{R}^{15}$, $-\text{C}(\text{O})\text{OR}^{10}$, $-\text{C}(\text{O})\text{R}^{15}$, $-\text{C}(\text{O})\text{NR}^{16}\text{R}^{17}$, $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}^{16}\text{R}^{17}$, C_1 - C_6 алкила и C_1 - C_6 галогеналкила. Предпочтительно R^{8a} представляет собой водород или C_1 - C_6 алкил, и каждые R^{8b} , R^{8c} и R^{8d} независимо выбраны из группы, состоящей из водорода, галогена, циано, $-\text{NH}_2$, $-\text{C}(\text{O})\text{NR}^{16}\text{R}^{17}$, C_1 -

30

С₆алкила и С₁-С₆галогеналкила. Более предпочтительно R^{8a} представляет собой водород или метил, и каждые R^{8b}, R^{8c} и R^{8d} независимо выбраны из группы, состоящей из водорода, брома, хлора, фтора, циано, -NH₂, -C(O)NH₂, -C(O)NHMe, -C(O)N(Me)₂, метила и трифторметила. Еще более предпочтительно R^{8a} представляет собой водород или метил, и каждые R^{8b}, R^{8c} и R^{8d} независимо выбраны из группы, состоящей из водорода, брома, -NH₂, -C(O)NHMe, метила и трифторметила. Еще более предпочтительно R^{8a} представляет собой водород или метил, и каждые R^{8b}, R^{8c} и R^{8d} независимо выбраны из группы, состоящей из водорода, -C(O)NHMe, метила и трифторметила.

Если А выбран из группы, состоящей из формул А-I – А-III, каждый R^{8b} (замещенный на атоме углерода в кольце) независимо выбран из группы, состоящей из водорода, галогена, циано, -NH₂, -C(O)NR¹⁶R¹⁷, С₁-С₆алкила и С₁-С₆галогеналкила. Предпочтительно каждый R^{8b} независимо выбран из группы, состоящей из водорода, брома, хлора, фтора, циано, -NH₂, -C(O)NH₂, -C(O)NHMe, -C(O)N(Me)₂, метила и трифторметила. Более предпочтительно каждый R^{8b} независимо выбран из группы, состоящей из водорода, брома, -NH₂, -C(O)NHMe, метила и трифторметила. Еще более предпочтительно каждый R^{8b} независимо выбран из группы, состоящей из водорода, -C(O)NHMe, метила и трифторметила.

Каждый R⁹ независимо выбран из группы, состоящей из галогена, циано, -OH, -N(R⁶)₂, С₁-С₄алкила, С₁-С₄алкокси, С₁-С₄галогеналкила и С₁-С₄галогеналкокси. Предпочтительно каждый R⁹ независимо выбран из группы, состоящей из галогена, циано, -N(R⁶)₂, С₁-С₄алкила, С₁-С₄алкокси, С₁-С₄галогеналкила и С₁-С₄галогеналкокси. Более предпочтительно каждый R⁹ независимо выбран из группы, состоящей из галогена, С₁-С₄алкила, С₁-С₄алкокси и С₁-С₄галогеналкила. Еще более предпочтительно каждый R⁹ независимо выбран из группы, состоящей из галогена и С₁-С₄алкила.

Х выбран из группы, состоящей из С₃-С₆циклоалкила, фенила, 5- или 6-членного гетероарила, который содержит 1, 2, 3 или 4 гетероатома, по отдельности выбранные из N, O и S, и 4-6-членного гетероциклила, который содержит 1, 2 или 3 гетероатома, по отдельности 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 , Q и Z могут быть присоединены в любом положении указанных циклоалкильных, фенильных, гетероарильных или гетероциклильных фрагментов.

- 5 Предпочтительно X выбран из группы, состоящей из фенила и 4-6-членного гетероциклила, который содержит 1 или 2 гетероатома, по отдельности 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
10 присоединены в любом положении указанных фенильных или гетероциклильных фрагментов.

- Более предпочтительно X представляет собой 4-6-членный гетероциклил, который содержит 1 или 2 гетероатома, по отдельности выбранные из N и O, и при этом
15 указанные 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 указанного гетероциклильного фрагмента.

- 20 В одном варианте осуществления X представляет собой 5-членный гетероциклил, который содержит 1 гетероатом, где указанный гетероатом представляет собой N, и при этом вышеуказанные фрагменты CR^1R^2 , Q и Z могут быть присоединены в любом положении указанного гетероциклильного фрагмента. Предпочтительно X представляет собой 5-членный гетероциклил, который содержит 1 гетероатом, где
25 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.

- В другом варианте осуществления X представляет собой фенил, необязательно замещенный 1 или 2 заместителями, которые могут быть одинаковыми или
30 различными, выбранными из R^9 , и при этом вышеуказанные фрагменты CR^1R^2 , Q и Z могут быть присоединены в любом положении указанного фенильного фрагмента. Предпочтительно X представляет собой фенил, и вышеуказанные фрагменты CR^1R^2 и Q присоединены в *пара*-положении к фрагменту Z.

n равняется 0 или 1. Предпочтительно n равняется 0.

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.

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

20 Более предпочтительно Z выбран из группы, состоящей из $-\text{C}(\text{O})\text{OR}^{10}$, $-\text{C}(\text{O})\text{NHOR}^{11}$, $-\text{C}(\text{O})\text{NHS}(\text{O})_2\text{R}^{12}$, $-\text{S}(\text{O})_2\text{OR}^{10}$, $-\text{OS}(\text{O})_2\text{OR}^{10}$, $-\text{NR}^6\text{S}(\text{O})_2\text{OR}^{10}$, $-\text{NHS}(\text{O})_2\text{R}^{14}$, $-\text{S}(\text{O})\text{OR}^{10}$ и $-\text{P}(\text{O})(\text{R}^{13})(\text{OR}^{10})$.

25 Еще более предпочтительно Z выбран из группы, состоящей из $-\text{C}(\text{O})\text{OR}^{10}$, $-\text{C}(\text{O})\text{NHS}(\text{O})_2\text{R}^{12}$, $-\text{S}(\text{O})_2\text{OR}^{10}$, $-\text{OS}(\text{O})_2\text{OR}^{10}$ и $-\text{P}(\text{O})(\text{R}^{13})(\text{OR}^{10})$.

30 Все еще более предпочтительно Z выбран из группы, состоящей из $-\text{C}(\text{O})\text{OH}$, $-\text{C}(\text{O})\text{OCH}_3$, $-\text{C}(\text{O})\text{OCH}_2\text{CH}_3$, $-\text{C}(\text{O})\text{OCH}(\text{CH}_3)_2$, $-\text{C}(\text{O})\text{OC}(\text{CH}_3)_3$, $-\text{C}(\text{O})\text{OCH}_2\text{C}_6\text{H}_5$, $-\text{C}(\text{O})\text{OC}_6\text{H}_5$, $-\text{C}(\text{O})\text{NHS}(\text{O})_2\text{CH}_3$, $-\text{S}(\text{O})_2\text{OH}$, $-\text{OS}(\text{O})_2\text{OH}$, $-\text{P}(\text{O})(\text{OH})(\text{OH})$, $-\text{P}(\text{O})(\text{OH})(\text{OCH}_2\text{CH}_3)$, $-\text{P}(\text{O})(\text{OH})(\text{OCH}_3)$, $-\text{P}(\text{O})(\text{OCH}_3)(\text{OCH}_3)$, $-\text{P}(\text{O})(\text{OCH}_2\text{CH}_3)(\text{OCH}_2\text{CH}_3)$, $-\text{P}(\text{O})(\text{CH}_3)(\text{OH})$ и $-\text{P}(\text{O})(\text{CH}_3)(\text{OCH}_2\text{CH}_3)$.

Все еще более предпочтительно Z выбран из группы, состоящей из $-\text{C}(\text{O})\text{OH}$, $-\text{C}(\text{O})\text{OCH}_3$, $-\text{C}(\text{O})\text{OCH}_2\text{CH}_3$, $-\text{C}(\text{O})\text{OC}(\text{CH}_3)_3$, $-\text{C}(\text{O})\text{NHS}(\text{O})_2\text{CH}_3$, $-\text{S}(\text{O})_2\text{OH}$, $-\text{OS}(\text{O})_2\text{OH}$, $-\text{P}(\text{O})(\text{OH})(\text{OH})$, $-\text{P}(\text{O})(\text{OH})(\text{OCH}_2\text{CH}_3)$, $-\text{P}(\text{O})(\text{OH})(\text{OCH}_3)$, $-\text{P}(\text{O})(\text{OCH}_3)(\text{OCH}_3)$, $-\text{P}(\text{O})(\text{OCH}_2\text{CH}_3)(\text{OCH}_2\text{CH}_3)$, $-\text{P}(\text{O})(\text{CH}_3)(\text{OH})$ и $-\text{P}(\text{O})(\text{CH}_3)(\text{OCH}_2\text{CH}_3)$.

$P(O)(OH)(OH)$, $-P(O)(OH)(OCH_2CH_3)$, $-P(O)(OH)(OCH_3)$, $-P(O)(OCH_3)(OCH_3)$, $-P(O)(OCH_2CH_3)(OCH_2CH_3)$, $-P(O)(CH_3)(OH)$ и $-P(O)(CH_3)(OCH_2CH_3)$.

Дополнительно еще более предпочтительно Z выбран из группы, состоящей из -
 5 $C(O)OH$, $-C(O)NHS(O)_2CH_3$, $-S(O)_2OH$, $-OS(O)_2OH$, $-P(O)(OH)(OH)$, $-P(O)(OH)(OCH_2CH_3)$, $-P(O)(OH)(OCH_3)$ и $-P(O)(CH_3)(OH)$.

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

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

15 R^{10} выбран из группы, состоящей из водорода, C_1 - C_6 алкила, фенила и бензила, и при этом 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
 20 предпочтительно R^{10} выбран из группы, состоящей из водорода и C_1 - C_6 алкила. Еще более предпочтительно R^{10} выбран из группы, состоящей из водорода, метила, этила и *трет*-бутила. Наиболее предпочтительно R^{10} представляет собой водород.

R^{11} выбран из группы, состоящей из водорода, C_1 - C_6 алкила и фенила, и при этом
 25 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
 30 метил.

R^{12} выбран из группы, состоящей из C_1 - C_6 алкила, C_1 - C_6 галогеналкила, C_1 - C_6 алкокси, $-OH$, $-N(R^6)_2$ и фенила, и при этом 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, $-OH$, $-N(R^6)_2$ 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 $-OH$, C_1 - C_6 алкила, C_1 - C_6 алкокси и фенила. Предпочтительно R^{13} выбран из группы, состоящей из $-OH$, C_1 - C_6 алкила и C_1 - C_6 алкокси. Более предпочтительно R^{13} выбран из группы, состоящей из $-OH$ и C_1 - C_6 алкокси. Еще более предпочтительно R^{13} выбран из группы, состоящей из $-OH$, метокси и этокси. Наиболее предпочтительно R^{13} представляет собой $-OH$.

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 при этом 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.

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, отдельно 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, отдельно 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.

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 при этом 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.

g равняется 0, 1 или 2. Предпочтительно g 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;

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^{3a} , R^4 и R^5 независимо выбраны из группы, состоящей из водорода, хлора, фтора, брома и метила;

каждый R^6 независимо выбран из водорода и метила;

каждый R^7 представляет собой C_1 - C_6 алкил;

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 заместителями R^8 , которые могут быть одинаковыми или различными;

если А замещен на одном или нескольких атомах углерода в кольце, каждый R^8 независимо выбран из группы, состоящей из галогена, нитро, циано, $-NH_2$, $-S(O)_tR^{15}$, -

5 $C(O)OR^{10}$, $-C(O)R^{15}$, $-C(O)NR^{16}R^{17}$, $-S(O)_2NR^{16}R^{17}$, C_1 - C_6 алкила и C_1 - C_6 галогеналкила; и/или

если А замещен на атоме азота в кольце, R^8 представляет собой C_1 - C_6 алкил или C_1 - C_6 галогеналкил; и

n равняется 0;

10 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;

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 $-OH$, C_1 - C_6 алкила и C_1 - C_6 алкокси;

15 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.

Более предпочтительно:

20 R^1 представляет собой водород или метил;

R^2 представляет собой водород или метил;

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

m равняется 0 или 1;

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

25 R^3 , R^{3a} , R^4 и R^5 независимо выбраны из группы, состоящей из водорода, хлора и фтора;

А представляет собой гетероарил, выбранный из группы, состоящей из 1,2,4-оксадиазол-5-ила, тиadiaзол-5-ила, 1,2,4-тиadiaзол-5-ила, тиadiaзол-4-ила, 1,2,4-тиadiaзол-3-ила, 1,2,5-тиadiaзол-3-ила, 1,3,4-тиadiaзол-2-ила, 1,3,4-оксадиазол-2-ила, 1,2,4-оксадиазол-3-ила, 1,2,5-оксадиазол-3-ила, 1,2,4-триазол-3-ила, 1,2,4-триазол-5-ила, 30 триазол-4-ила, триазол-5-ила, 2-метилтетразол-5-ила, 1-метилтетразол-5-ила, тиазол-2-ила, тиазол-4-ила, изотиазол-5-ила, изотиазол-4-ила, изотиазол-3-ила, оксазол-2-ила, оксазол-4-ила, изоксазол-3-ила, изоксазол-5-ила, имидазол-5-ила, имидазол-2-ила, 3-фурила, 2-фурила, 3-тиенила, пиразол-5-ила, пиразол-3-ила и 2-тиенила, где гетероарил

может, если это возможно, 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 галогена, циано, $-NH_2$, $-C(O)NR^{16}R^{17}$, C_1 -

5 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

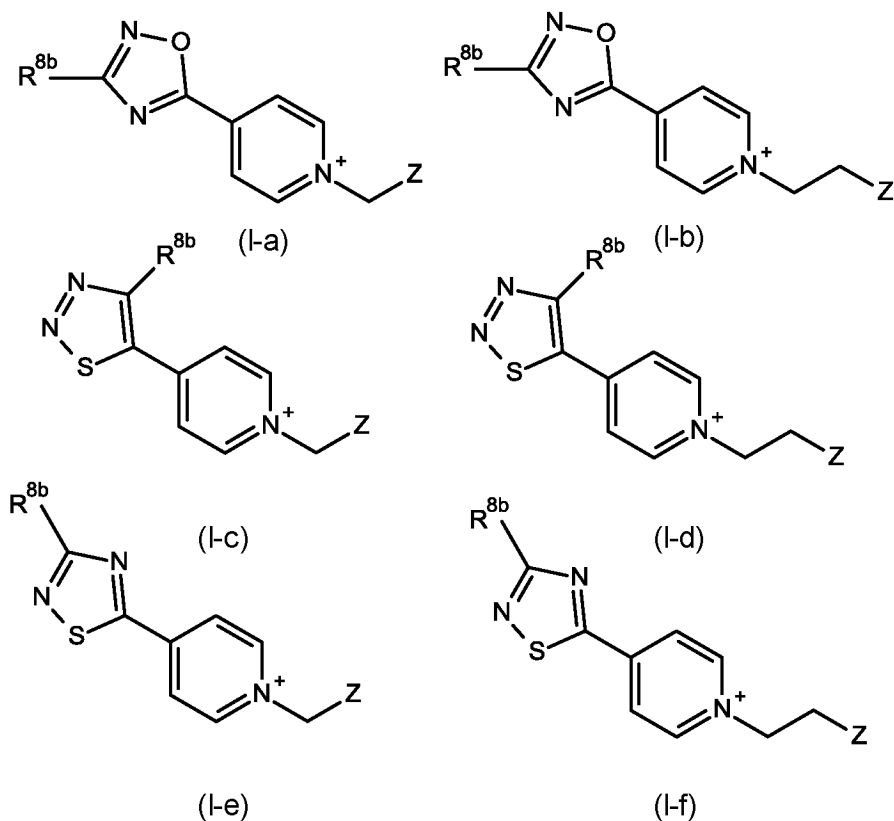
n равняется 0;

10 Z выбран из группы, состоящей из $-C(O)OH$, $-C(O)OCH_3$, $-C(O)OCH_2CH_3$, $-C(O)OCH(CH_3)_2$, $-C(O)OC(CH_3)_3$, $-C(O)OCH_2C_6H_5$, $-C(O)OC_6H_5$, $-C(O)NHS(O)_2CH_3$, $-S(O)_2OH$, $-OS(O)_2OH$, $-P(O)(OH)(OH)$, $-P(O)(OH)(OCH_2CH_3)$, $-P(O)(OH)(OCH_3)$, $-P(O)(OCH_3)(OCH_3)$, $-P(O)(OCH_2CH_3)(OCH_2CH_3)$, $-P(O)(CH_3)(OH)$ и $-P(O)(CH_3)(OCH_2CH_3)$; и

R^{16} и R^{17} независимо выбран из группы, состоящей из водорода и метила.

15

В дополнительной группе предпочтительных вариантов осуществления соединение в соответствии с формулой (I) выбрано из соединения формулы (I-a), (I-b), (I-c), (I-d), (I-e) или (I-f),

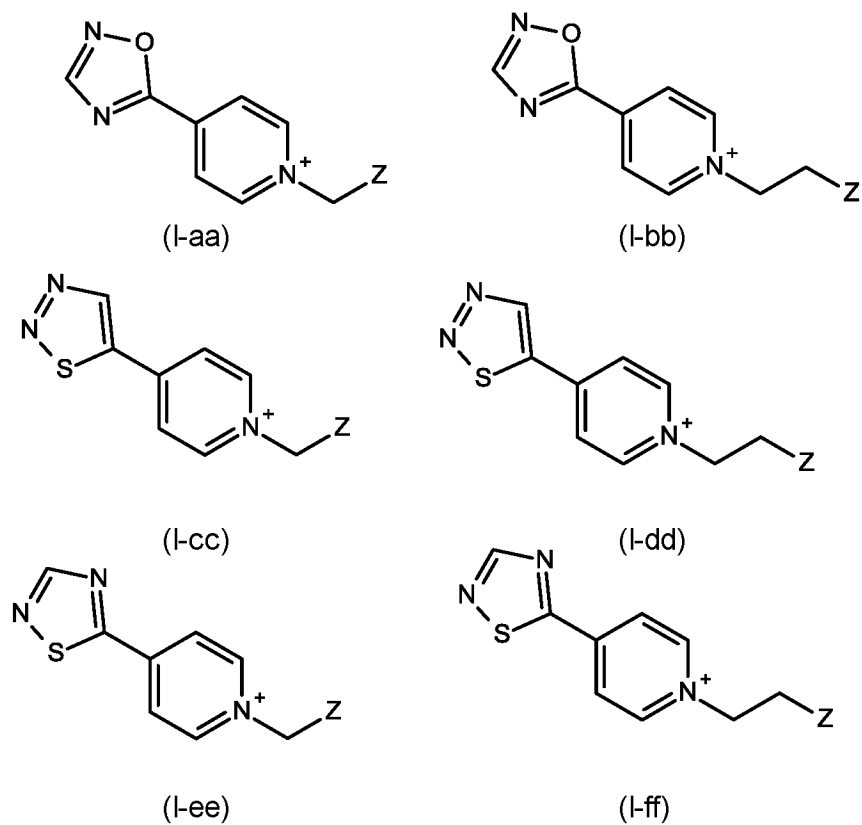


где в соединении формулы (I-a), (I-b), (I-c), (I-d), (I-e) и (I-f)

каждый R^{8b} независимо выбран из группы, состоящей из водорода, брома, хлора, фтора, циано, -NH₂, -C(O)NH₂, -C(O)NHMe, -C(O)N(Me)₂, метила и трифторметила; и

Z выбран из группы, состоящей из -C(O)OH, -C(O)OCH₃, -C(O)OCH₂CH₃, -C(O)OC(CH₃)₃, -C(O)NHS(O)₂CH₃, -S(O)₂OH, -OS(O)₂OH, -P(O)(OH)(OH), -P(O)(OH)(OCH₂CH₃), -P(O)(OH)(OCH₃), -P(O)(OCH₃)(OCH₃), -P(O)(OCH₂CH₃)(OCH₂CH₃), -P(O)(CH₃)(OH) и -P(O)(CH₃)(OCH₂CH₃).

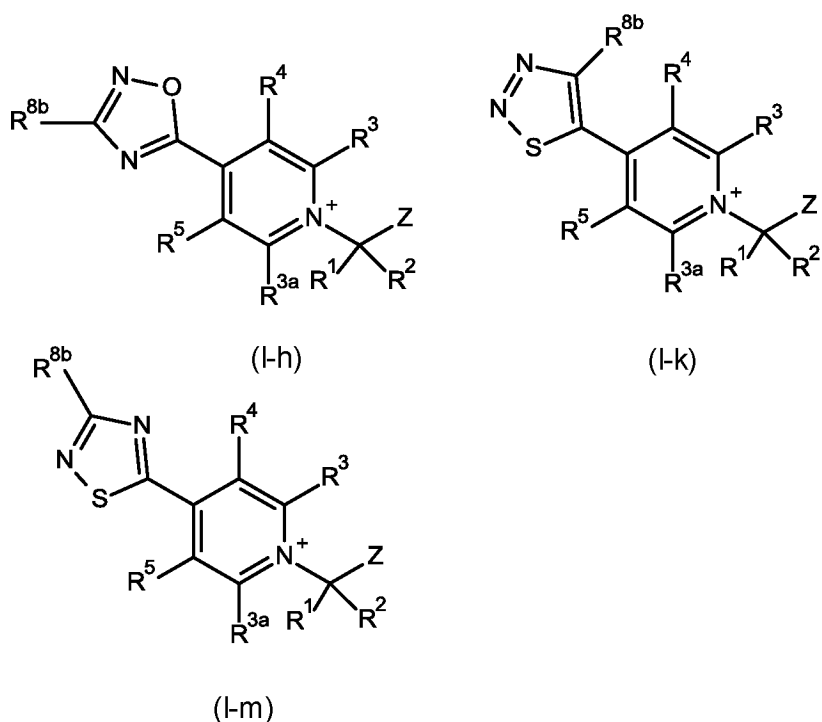
В дополнительной более предпочтительной группе вариантов осуществления соединение в соответствии с формулой (I) выбрано из соединения формулы (I-aa), (I-bb), (I-cc), (I-dd), (I-ee) или (I-ff),



где в соединении формулы (I-aa), (I-bb), (I-cc), (I-dd), (I-ee) и (I-ff),

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

В другой группе предпочтительных вариантов осуществления соединение в соответствии с формулой (I) выбрано из соединения формулы (I-h), (I-k) или (I-m),



где в соединении формулы (I-h), (I-k) или (I-m),

R^1 представляет собой водород или метил;

R^2 представляет собой водород или метил;

5 R^3 , R^{3a} , R^4 и R^5 независимо выбраны из группы, состоящей из водорода, хлора, фтора, брома, циано, метила и трифторметила;

каждый R^6 независимо представляет собой водород или метил;

каждый R^{8b} независимо выбран из группы, состоящей из водорода, галогена, циано, - NH_2 , - $C(O)NR^{16}R^{17}$, C_1 - C_6 алкила и C_1 - C_6 галогеналкила;

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

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

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, C_1 - C_6 алкила и C_1 - C_6 алкокси; и

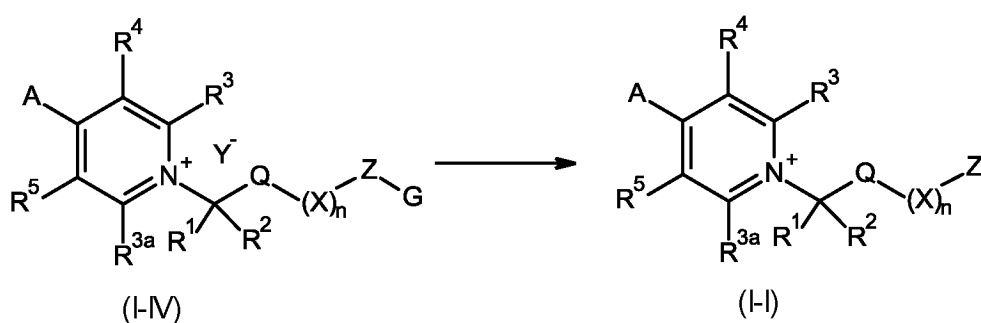
15 R^{16} и R^{17} независимо выбраны из группы, состоящей из водорода и метила.

В одной группе вариантов осуществления соединение в соответствии с формулой (I) выбрано из соединений A1 - A101, перечисленных в таблице A.

20 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).

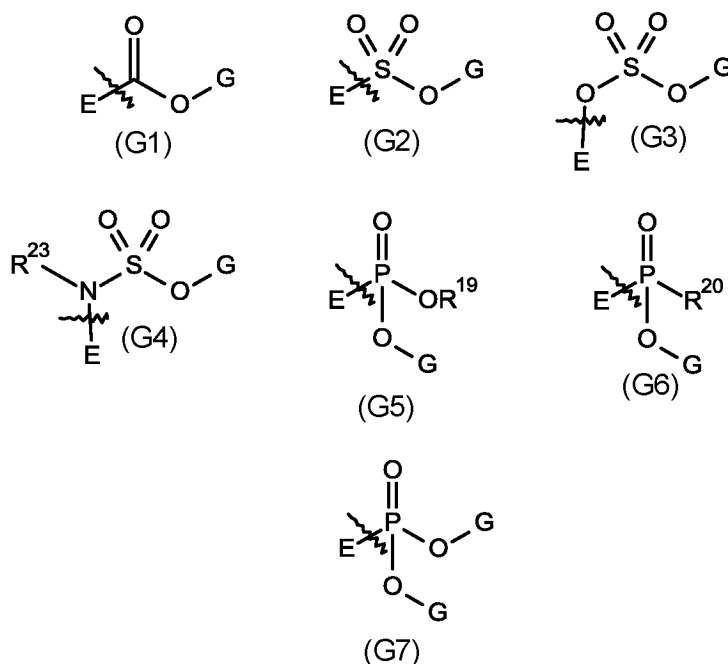
5 G представляет собой группу, которая может быть удалена в растении путем любого соответствующего механизма, в том числе без ограничения метаболизма и химического расщепления, с получением соединений формул (I-I), (I-II) или (I-III), где Z содержит кислотный протон, например, см. схему ниже.



10

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

15 включать без ограничения любую из (G1) - (G7), указанных ниже, и E указывает на точку присоединения к остальной части соединения формулы (I).



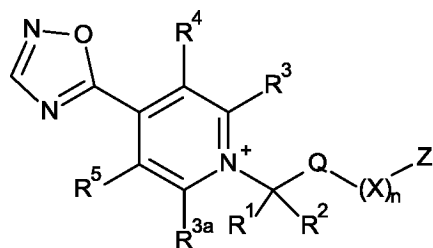
В вариантах осуществления, где Z-G предусматривает (G1) - (G7), G, R¹⁹, R²⁰, R²¹, R²² и R²³ определяются следующим образом:

- 5 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,
- 10 R²⁰ представляет собой гидроксильную, C₁-C₆алкильную, C₁-C₆алкоксильную или фенильную,
- R²¹ представляет собой водород или метил,
- R²² представляет собой водород или метил,
- R²³ представляет собой водород или C₁-C₆алкил.
- 15 Соединения в таблицах 1-27 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 ранее.

20

Таблица 1

В данной таблице раскрыты 53 конкретных соединения (1.001–1.053) формулы (Т-1):



(T-1),

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

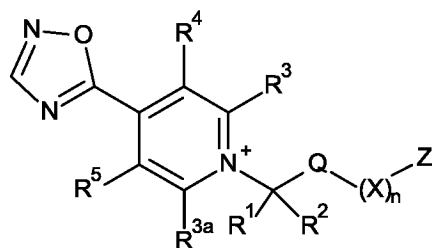
5

Номер соединения	R^3	R^{3a}	R^4	R^5	Z	m	Q
1.001	H	H	H	H	-C(O)OH	0	-
1.002	H	H	H	H	-C(OMe)	0	-
1.003	H	H	H	H	-C(O)NHOMe	0	-
1.004	H	H	H	H	-OC(O)NHOMe	0	-
1.005	H	H	H	H	-NHC(O)NHOMe	0	-
1.006	H	H	H	H	-NMeC(O)NHOMe	0	-
1.007	H	H	H	H	-C(O)NHS(O) ₂ Me	0	-
1.008	H	H	H	H	-OC(O)NHS(O) ₂ Me	0	-
1.009	H	H	H	H	-NHC(O)NHS(O) ₂ Me	0	-
1.010	H	H	H	H	-NMeC(O)NHS(O) ₂ Me	0	-
1.011	H	H	H	H	-S(O) ₂ OH	0	-
1.012	H	H	H	H	-OS(O) ₂ OH	0	-
1.013	H	H	H	H	-NHS(O) ₂ OH	0	-
1.014	H	H	H	H	-NMeS(O) ₂ OH	0	-
1.015	H	H	H	H	-S(O)OH	0	-
1.016	H	H	H	H	-OS(O)OH	0	-
1.017	H	H	H	H	-NHS(O)OH	0	-
1.018	H	H	H	H	-NMeS(O)OH	0	-
1.019	H	H	H	H	-NHS(O) ₂ CF ₃	0	-
1.020	H	H	H	H	-S(O) ₂ NHC(O)Me	0	-
1.021	H	H	H	H	-OS(O) ₂ NHC(O)Me	0	-
1.022	H	H	H	H	-NHS(O) ₂ NHC(O)Me	0	-
1.023	H	H	H	H	-NMeS(O) ₂ NHC(O)Me	0	-
1.024	H	H	H	H	-P(O)(OH)(OMe)	0	-
1.025	H	H	H	H	-P(O)(OH)(OH)	0	-
1.026	H	H	H	H	-OP(O)(OH)(OMe)	0	-
1.027	H	H	H	H	-OP(O)(OH)(OH)	0	-
1.028	H	H	H	H	-NHP(O)(OH)(OMe)	0	-
1.029	H	H	H	H	-NHP(O)(OH)(OH)	0	-
1.030	H	H	H	H	-NMeP(O)(OH)(OMe)	0	-
1.031	H	H	H	H	-NMeP(O)(OH)(OH)	0	-

Номер соединения	R ³	R ^{3a}	R ⁴	R ⁵	Z	m	Q
1.032	H	H	H	H	-тетразол	0	-
1.033	H	H	H	H	-S(O) ₂ OH	1	CH(NH ₂)
1.033	H	H	H	H	-C(O)OH	1	CH(NH ₂)
1.035	H	H	H	H	-S(O) ₂ OH	2	CH(OH)CH ₂
1.036	H	H	H	H	-C(O)OH	2	CH(OH)CH ₂
1.037	H	H	H	H	-S(O) ₂ OH	1	CH(OH)
1.038	H	H	H	H	-C(O)OH	1	CH(OH)
1.039	H	H	H	H	-C(O)NHCN	0	-
1.040	H	H	H	H	-OC(O)NHCN	0	-
1.041	H	H	H	H	-NHC(O)NHCN	0	-
1.042	H	H	H	H	-NMeC(O)NHCN	0	-
1.043	H	H	H	H	-S(O) ₂ NHCN	0	-
1.044	H	H	H	H	-OS(O) ₂ NHCN	0	-
1.045	H	H	H	H	-NHS(O) ₂ NHCN	0	-
1.046	H	H	H	H	-NMeS(O) ₂ NHCN	0	-
1.047	H	H	H	H	-S(O) ₂ NHS(O) ₂ Me	0	-
1.048	H	H	H	H	-OS(O) ₂ NHS(O) ₂ Me	0	-
1.049	H	H	H	H	-NHS(O) ₂ NHS(O) ₂ Me	0	-
1.050	H	H	H	H	- NMeS(O) ₂ NHS(O) ₂ Me	0	-
1.051	H	H	H	H	-P(O)H(OH)	0	-
1.052	H	H	H	H	-N(OH)C(O)Me	0	-
1.053	H	H	H	H	-ONHC(O)Me	0	-

Таблица 2

В данной таблице раскрыты 49 конкретных соединений (2.001–2.049) формулы (Т-2):



5 (Т-2),

где m, Q, R³, R^{3a}, R⁴, R⁵ и Z определены в таблице 2, R¹ и R² представляют собой водород, и n равняется 0.

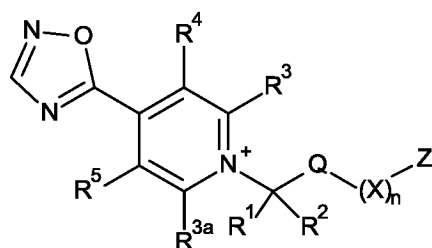
Номер соединения	R ³	R ^{3a}	R ⁴	R ⁵	Z	m	Q
2.001	H	H	H	H	-C(O)OH	1	CH ₂
2.002	H	H	H	H	-C(O)OMe	1	CH ₂
2.003	H	H	H	H	-C(O)NHOMe	1	CH ₂

Номер соединения	R ³	R ^{3a}	R ⁴	R ⁵	Z	m	Q
2.004	H	H	H	H	-OC(O)NHOMe	1	CH ₂
2.005	H	H	H	H	-NHC(O)NHOMe	1	CH ₂
2.006	H	H	H	H	-NMeC(O)NHOMe	1	CH ₂
2.007	H	H	H	H	-C(O)NHS(O) ₂ Me	1	CH ₂
2.008	H	H	H	H	-OC(O)NHS(O) ₂ Me	1	CH ₂
2.009	H	H	H	H	-NHC(O)NHS(O) ₂ Me	1	CH ₂
2.010	H	H	H	H	- NMeC(O)NHS(O) ₂ Me	1	CH ₂
2.011	H	H	H	H	-S(O) ₂ OH	1	CH ₂
2.012	H	H	H	H	-OS(O) ₂ OH	1	CH ₂
2.013	H	H	H	H	-NHS(O) ₂ OH	1	CH ₂
2.014	H	H	H	H	-NMeS(O) ₂ OH	1	CH ₂
2.015	H	H	H	H	-S(O)OH	1	CH ₂
2.016	H	H	H	H	-OS(O)OH	1	CH ₂
2.017	H	H	H	H	-NHS(O)OH	1	CH ₂
2.018	H	H	H	H	-NMeS(O)OH	1	CH ₂
2.019	H	H	H	H	-NHS(O) ₂ CF ₃	1	CH ₂
2.020	H	H	H	H	-S(O) ₂ NHC(O)Me	1	CH ₂
2.021	H	H	H	H	-OS(O) ₂ NHC(O)Me	1	CH ₂
2.022	H	H	H	H	-NHS(O) ₂ NHC(O)Me	1	CH ₂
2.023	H	H	H	H	- NMeS(O) ₂ NHC(O)Me	1	CH ₂
2.024	H	H	H	H	-P(O)(OH)(OMe)	1	CH ₂
2.025	H	H	H	H	-P(O)(OH)(OH)	1	CH ₂
2.026	H	H	H	H	-OP(O)(OH)(OMe)	1	CH ₂
2.027	H	H	H	H	-OP(O)(OH)(OH)	1	CH ₂
2.028	H	H	H	H	-NHP(O)(OH)(OMe)	1	CH ₂
2.029	H	H	H	H	-NHP(O)(OH)(OH)	1	CH ₂
2.030	H	H	H	H	-NMeP(O)(OH)(OMe)	1	CH ₂
2.031	H	H	H	H	-NMeP(O)(OH)(OH)	1	CH ₂
2.032	H	H	H	H	-тетразол	1	CH ₂
2.033	H	H	H	H	-S(O) ₂ OH	2	CH ₂ CH(NH ₂)
2.034	H	H	H	H	-C(O)OH	2	CH ₂ CH(NH ₂)
2.035	H	H	H	H	-C(O)NHCN	1	CH ₂
2.036	H	H	H	H	-OC(O)NHCN	1	CH ₂
2.037	H	H	H	H	-NHC(O)NHCN	1	CH ₂
2.038	H	H	H	H	-NMeC(O)NHCN	1	CH ₂
2.039	H	H	H	H	-S(O) ₂ NHCN	1	CH ₂
2.040	H	H	H	H	-OS(O) ₂ NHCN	1	CH ₂
2.041	H	H	H	H	-NHS(O) ₂ NHCN	1	CH ₂
2.042	H	H	H	H	-NMeS(O) ₂ NHCN	1	CH ₂
2.043	H	H	H	H	-S(O) ₂ NHS(O) ₂ Me	1	CH ₂
2.044	H	H	H	H	-OS(O) ₂ NHS(O) ₂ Me	1	CH ₂
2.045	H	H	H	H	-NHS(O) ₂ NHS(O) ₂ Me	1	CH ₂
2.046	H	H	H	H	- NMeS(O) ₂ NHS(O) ₂ Me	1	CH ₂
2.047	H	H	H	H	-P(O)H(OH)	1	CH ₂

Номер соединения	R ³	R ^{3a}	R ⁴	R ⁵	Z	m	Q
2.048	H	H	H	H	-N(OH)C(O)Me	1	CH ₂
2.049	H	H	H	H	-ONHC(O)Me	1	CH ₂

Таблица 3

В данной таблице раскрыты 49 конкретных соединений (3.001–3.049) формулы (Т-3):



5 (Т-3),

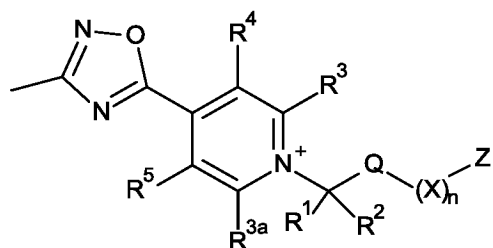
где m, Q, R³, R^{3a}, R⁴, R⁵ и Z определены в таблице 3, R¹ и R² представляют собой водород, и n равняется 0.

Номер соединения	R ³	R ^{3a}	R ⁴	R ⁵	Z	m	Q
3.001	H	H	H	H	-C(O)OH	2	CH ₂ CH ₂
3.002	H	H	H	H	-C(O)OMe	2	CH ₂ CH ₂
3.003	H	H	H	H	-C(O)NHOMe	2	CH ₂ CH ₂
3.004	H	H	H	H	-OC(O)NHOMe	2	CH ₂ CH ₂
3.005	H	H	H	H	-NHC(O)NHOMe	2	CH ₂ CH ₂
3.006	H	H	H	H	-NMeC(O)NHOMe	2	CH ₂ CH ₂
3.007	H	H	H	H	-C(O)NHS(O) ₂ Me	2	CH ₂ CH ₂
3.008	H	H	H	H	-OC(O)NHS(O) ₂ Me	2	CH ₂ CH ₂
3.009	H	H	H	H	-NHC(O)NHS(O) ₂ Me	2	CH ₂ CH ₂
3.010	H	H	H	H	-NMeC(O)NHS(O) ₂ Me	2	CH ₂ CH ₂
3.011	H	H	H	H	-S(O) ₂ OH	2	CH ₂ CH ₂
3.012	H	H	H	H	-OS(O) ₂ OH	2	CH ₂ CH ₂
3.013	H	H	H	H	-NHS(O) ₂ OH	2	CH ₂ CH ₂
3.014	H	H	H	H	-NMeS(O) ₂ OH	2	CH ₂ CH ₂
3.015	H	H	H	H	-S(O)OH	2	CH ₂ CH ₂
3.016	H	H	H	H	-OS(O)OH	2	CH ₂ CH ₂
3.017	H	H	H	H	-NHS(O)OH	2	CH ₂ CH ₂
3.018	H	H	H	H	-NMeS(O)OH	2	CH ₂ CH ₂
3.019	H	H	H	H	-NHS(O) ₂ CF ₃	2	CH ₂ CH ₂
3.020	H	H	H	H	-S(O) ₂ NHC(O)Me	2	CH ₂ CH ₂
3.021	H	H	H	H	-OS(O) ₂ NHC(O)Me	2	CH ₂ CH ₂
3.022	H	H	H	H	-NHS(O) ₂ NHC(O)Me	2	CH ₂ CH ₂
3.023	H	H	H	H	-NMeS(O) ₂ NHC(O)Me	2	CH ₂ CH ₂

Номер соединения	R ³	R ^{3a}	R ⁴	R ⁵	Z	m	Q
3.024	H	H	H	H	-P(O)(OH)(OMe)	2	CH ₂ CH ₂
3.025	H	H	H	H	-P(O)(OH)(OH)	2	CH ₂ CH ₂
3.026	H	H	H	H	-OP(O)(OH)(OMe)	2	CH ₂ CH ₂
3.027	H	H	H	H	-OP(O)(OH)(OH)	2	CH ₂ CH ₂
3.028	H	H	H	H	-NHP(O)(OH)(OMe)	2	CH ₂ CH ₂
3.029	H	H	H	H	-NHP(O)(OH)(OH)	2	CH ₂ CH ₂
3.030	H	H	H	H	-NMeP(O)(OH)(OMe)	2	CH ₂ CH ₂
3.031	H	H	H	H	-NMeP(O)(OH)(OH)	2	CH ₂ CH ₂
3.032	H	H	H	H	-тетразол	2	CH ₂ CH ₂
3.033	H	H	H	H	-S(O) ₂ OH	3	CH ₂ CH ₂ CH(NH ₂)
3.034	H	H	H	H	-C(O)OH	3	CH ₂ CH ₂ CH(NH ₂)
3.035	H	H	H	H	-C(O)NHCN	2	CH ₂ CH ₂
3.036	H	H	H	H	-OC(O)NHCN	2	CH ₂ CH ₂
3.037	H	H	H	H	-NHC(O)NHCN	2	CH ₂ CH ₂
3.038	H	H	H	H	-NMeC(O)NHCN	2	CH ₂ CH ₂
3.039	H	H	H	H	-S(O) ₂ NHCN	2	CH ₂ CH ₂
3.040	H	H	H	H	-OS(O) ₂ NHCN	2	CH ₂ CH ₂
3.041	H	H	H	H	-NHS(O) ₂ NHCN	2	CH ₂ CH ₂
3.042	H	H	H	H	-NMeS(O) ₂ NHCN	2	CH ₂ CH ₂
3.043	H	H	H	H	-S(O) ₂ NHS(O) ₂ Me	2	CH ₂ CH ₂
3.044	H	H	H	H	-OS(O) ₂ NHS(O) ₂ Me	2	CH ₂ CH ₂
3.045	H	H	H	H	-NHS(O) ₂ NHS(O) ₂ Me	2	CH ₂ CH ₂
3.046	H	H	H	H	-NMeS(O) ₂ NHS(O) ₂ Me	2	CH ₂ CH ₂
3.047	H	H	H	H	-P(O)H(OH)	2	CH ₂ CH ₂
3.048	H	H	H	H	-N(OH)C(O)Me	2	CH ₂ CH ₂
3.049	H	H	H	H	-ONHC(O)Me	2	CH ₂ CH ₂

Таблица 4

В данной таблице раскрыты 53 конкретных соединения (4.001–4.053) формулы (Т-4):

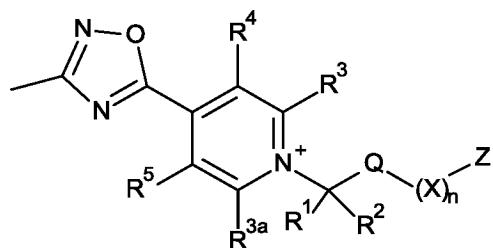


5 (Т-4),

где m, Q, R³, R^{3a}, R⁴, R⁵ и Z определены выше в таблице 1, R¹ и R² представляют собой водород, и n равняется 0.

Таблица 5

10 В данной таблице раскрыты 49 конкретных соединений (5.001–5.049) формулы (Т-5):

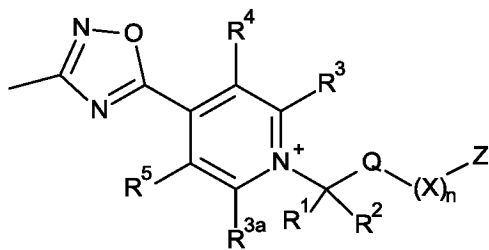


(T-5),

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

Таблица 6

В данной таблице раскрыты 49 конкретных соединений (6.001–6.049) формулы (Т-6):

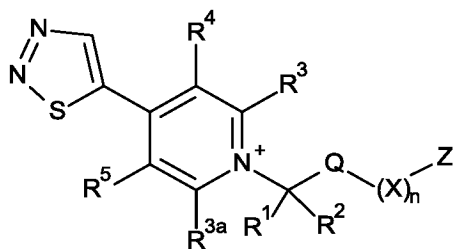


(T-6),

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

Таблица 7

В данной таблице раскрыты 53 конкретных соединения (7.001–7.053) формулы (Т-7):

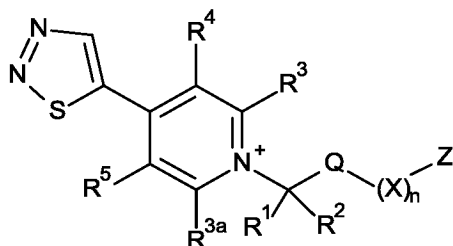


(T-7),

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

Таблица 8

В данной таблице раскрыты 49 конкретных соединений (8.001–8.049) формулы (Т-8):

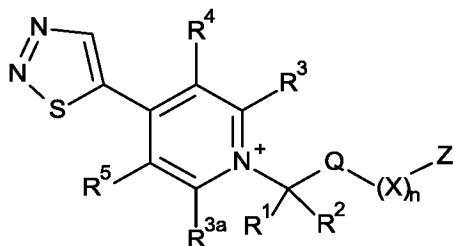


5 (Т-8),

где m , Q , R^3 , R^{3a} , 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 9

В данной таблице раскрыты 49 конкретных соединений (9.001–9.049) формулы (Т-9):

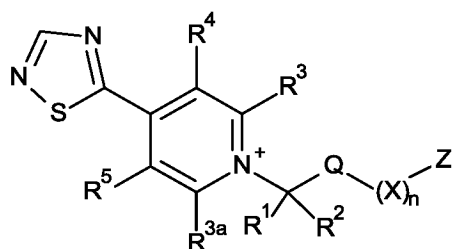


(Т-9),

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

Таблица 10

В данной таблице раскрыты 53 конкретных соединения (10.001–10.053) формулы (Т-10):



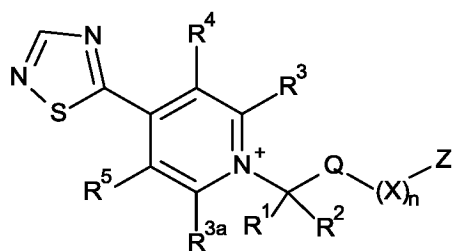
(T-10),

где m , Q , R^3 , R^{3a} , 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 11

В данной таблице раскрыты 49 конкретных соединений (11.001–11.049) формулы (T-11):

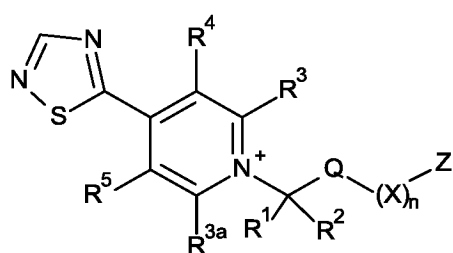


10 (T-11),

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

15 Таблица 12

В данной таблице раскрыты 49 конкретных соединений (12.001–12.049) формулы (T-12):



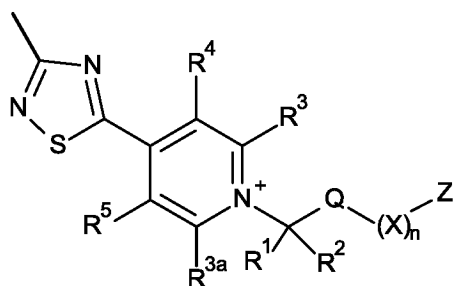
(T-12),

20

где m , Q , R^3 , R^{3a} , 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 конкретных соединения (13.001–13.053) формулы (T-13):



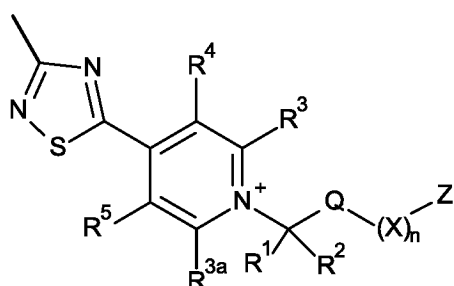
(T-13),

5

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

Таблица 14

10 В данной таблице раскрыты 49 конкретных соединений (14.001–14.049) формулы (T-14):

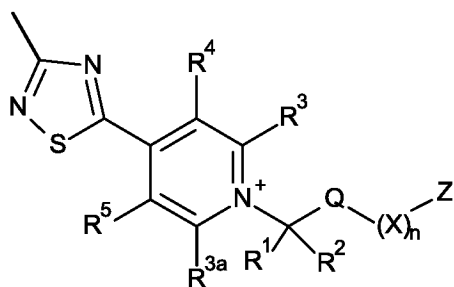


(T-14),

15 где m , Q , R^3 , R^{3a} , 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

20 В данной таблице раскрыты 49 конкретных соединения (15.001–15.049) формулы (T-15):

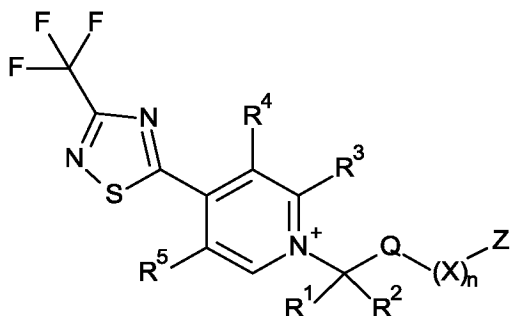


(T-15),

где m , Q , R^3 , R^{3a} , 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 конкретных соединения (16.001–16.053) формулы (T-16):

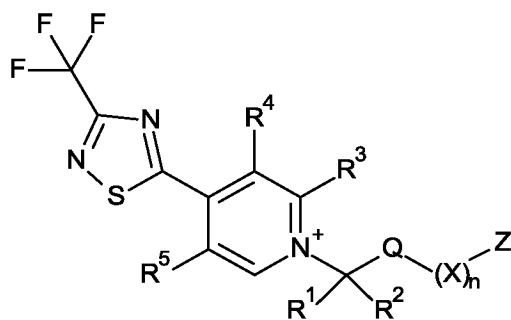


(T-16),

где m , Q , R^3 , R^{3a} , 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

В данной таблице раскрыты 49 конкретных соединений (17.001–17.049) формулы (T-17):

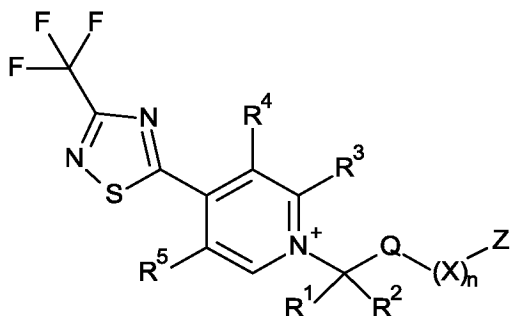


(T-17),

где m , Q , R^3 , R^{3a} , 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 (18.001–18.049) формулы (Т-18):

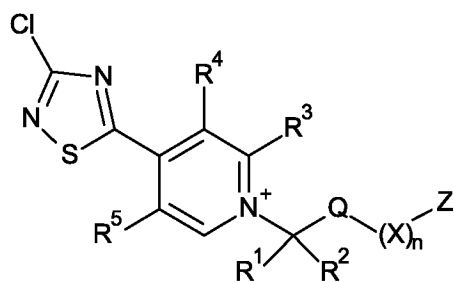


(T-18),

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

Таблица 19

В данной таблице раскрыты 53 конкретных соединения (19.001–19.053) формулы (Т-19):

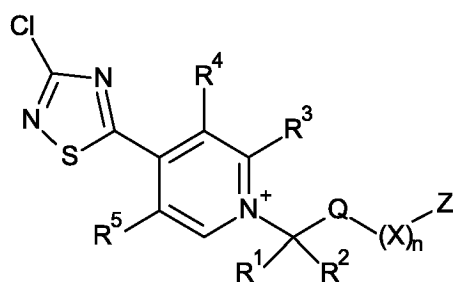


(T-19),

- 5 где m , Q , R^3 , R^{3a} , 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 (20.001–20.049) формулы (T-20):

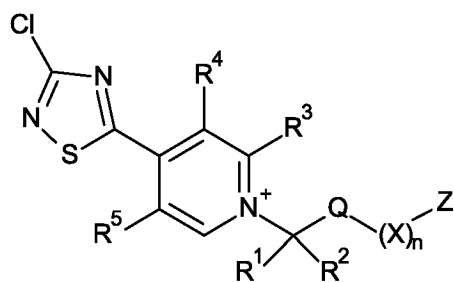


(T-20),

- 15 где m , Q , R^3 , R^{3a} , 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

- 20 В данной таблице раскрыты 49 конкретных соединений (21.001–21.049) формулы (T-21):

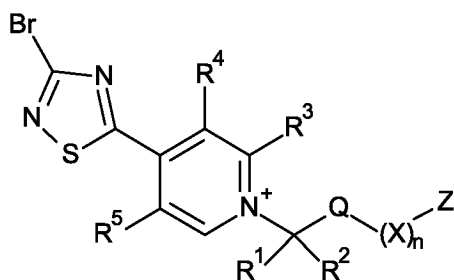


(T-21),

- 5 где m , Q , R^3 , R^{3a} , 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

- 10 В данной таблице раскрыты 53 конкретных соединения (22.001–22.053) формулы (T-22):

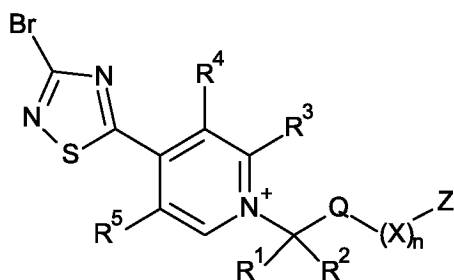


(T-22),

- 15 где m , Q , R^3 , R^{3a} , 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 (23.001–23.049) формулы (T-23):

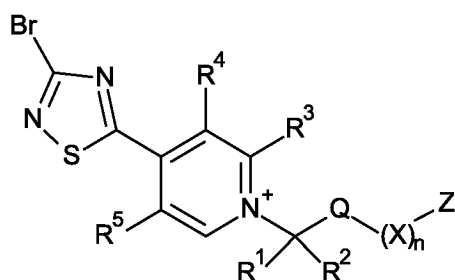


(T-23),

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

Таблица 24

В данной таблице раскрыты 49 конкретных соединений (24.001–24.049) формулы (T-24):

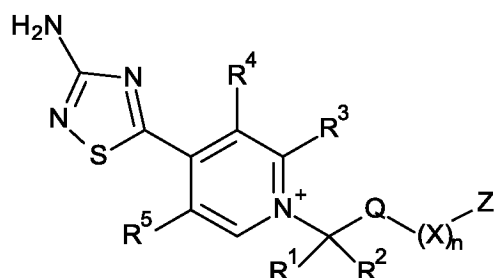


(T-24),

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

Таблица 25

В данной таблице раскрыты 53 конкретных соединения (25.001–25.053) формулы (T-25):

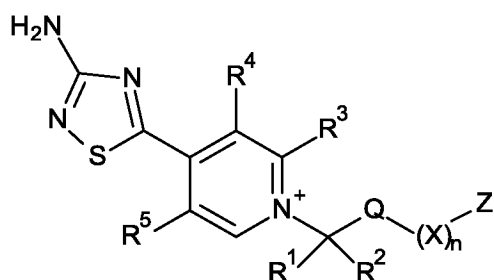


(T-25),

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

Таблица 26

- 5 В данной таблице раскрыты 49 конкретных соединений (26.001–26.049) формулы (T-26):



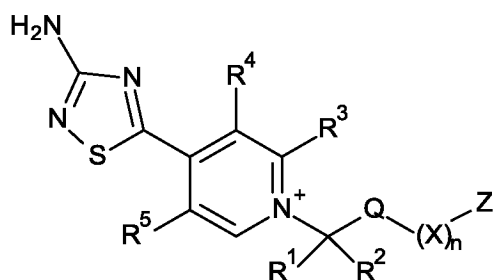
(T-26),

10

где m , Q , R^3 , R^{3a} , 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

- 15 В данной таблице раскрыты 49 конкретных соединений (27.001–27.049) формулы (T-27):



(T-27),

20

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

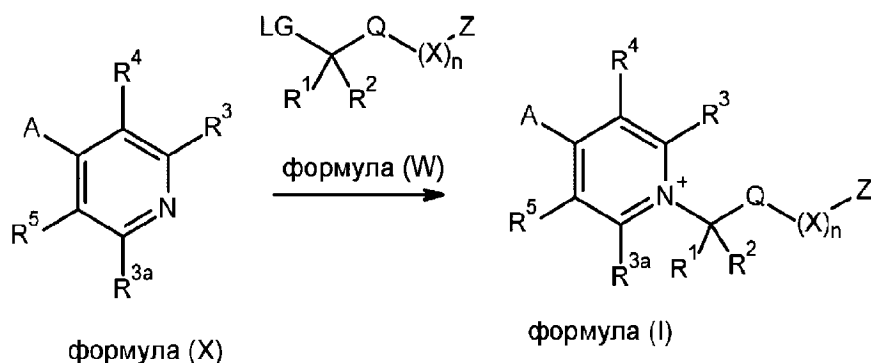
25

Соединения по настоящему изобретению могут быть получены в соответствии со следующими схемами, на которых заместители n , m , r , A , Q , X , Z , R^1 , R^2 , R^{1a} , R^{2b} , R^2 ,

$R^3, R^{3a}, R^4, R^5, R^6, R^7, R^{7a}, R^{7b}, R^{7c}, R^8, R^9, R^{10}, R^{11}, R^{12}, R^{13}, R^{14}, R^{15}, R^{15a}, R^{16}, R^{17}$ и R^{18} определены в данном документе ранее, если явно не указано иное. Таким образом, соединения из предыдущих таблиц 1-27 могут быть получены аналогичным образом.

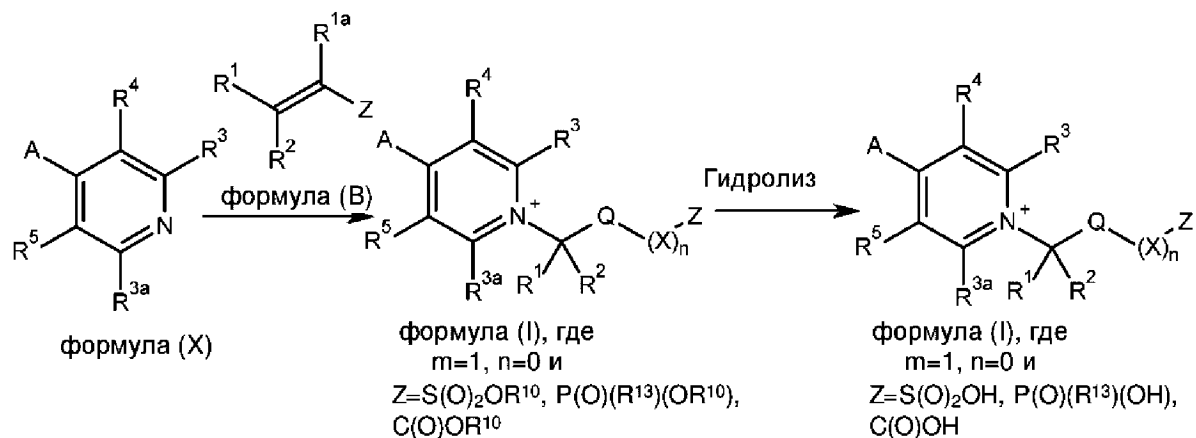
- 5 Соединения формулы (I) могут быть получены путем алкилирования соединений формулы (X), где R^3, R^{3a}, R^4, R^5 и A определены для соединений формулы (I), с помощью подходящего алкилирующего средства формулы (W), где R^1, R^2, Q, X, n и Z определены для соединений формулы (I), и LG представляет 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
- 10 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-
- 20 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
- 25 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
- 30 триметилсилилбромидом, в подходящем растворителе при подходящей температуре от 0°C до 100°C .

Схема реакции 1



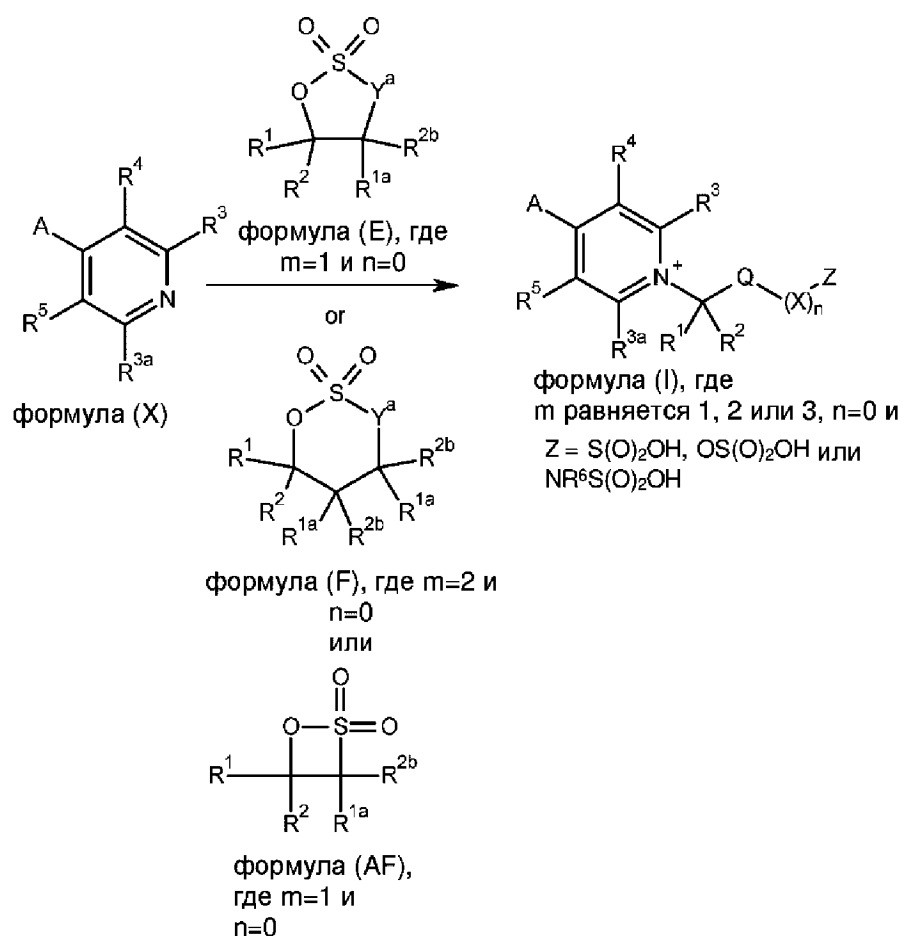
Кроме того, соединения формулы (I) могут быть получены путем осуществления реакции соединений формулы (X), где R^3 , R^{3a} , R^4 , R^5 и A определены для соединений формулы (I), с соответствующим образом активированным электрофильным алкеном формулы (B), где Z представляет собой $-\text{S}(\text{O})_2\text{OR}^{10}$, $-\text{P}(\text{O})(\text{R}^{13})(\text{OR}^{10})$ или $-\text{C}(\text{O})\text{OR}^{10}$, и R^1 , R^2 , R^{1a} , R^{10} и R^{13} 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 гидролизваны путем обработки подходящим реагентом в подходящем растворителе при подходящей температуре, как описано на схеме реакции 2.



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^{3a} , 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.

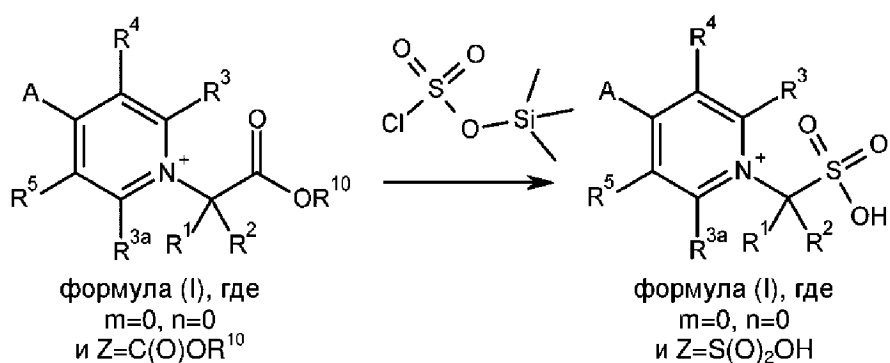
Схема реакции 3



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

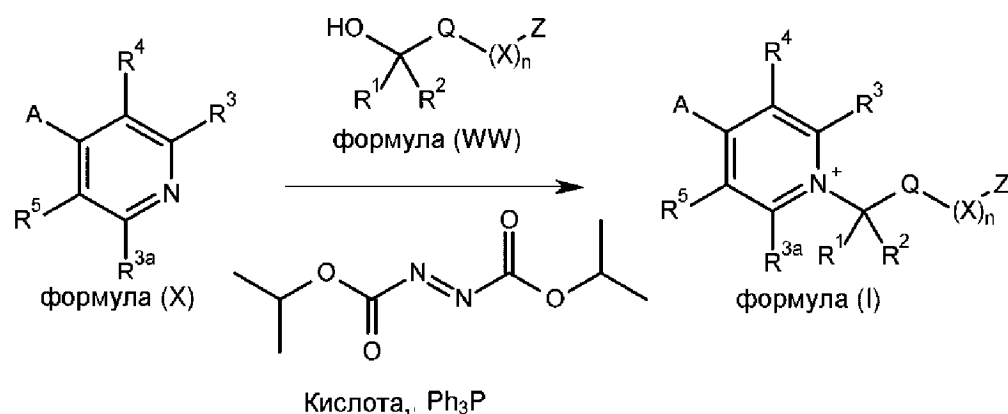
5 триметилсилилхлорсульфоната в подходящем растворителе при подходящей температуре, как описано на схеме реакции 4. Предпочтительные условия включают нагревание карбоксилатного предшественника в чистом триметилсилилхлорсульфонате при температуре от $25^\circ C$ до $150^\circ C$.

10 Схема реакции 4



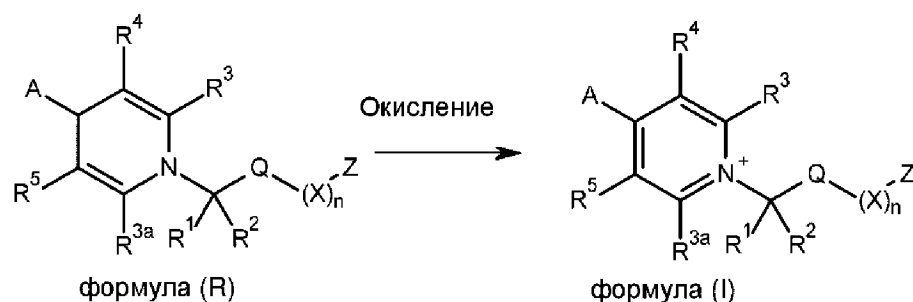
Кроме того, соединения формулы (I) могут быть получены путем осуществления реакций соединений формулы (X), где R^3 , R^{3a} , R^4 , R^5 и A определены для соединений формулы (I), с подходящим спиртом формулы (WW), где R^1 , R^2 , Q, X, n и Z определены для соединений формулы (I), в условиях типа реакции Мицунобу, таких как условия, описанные Petit et al, Tet. Lett. 2008, 49 (22), 3663. Подходящие фосфины включают трифенилфосфин, подходящие азодикарбоксилаты включают 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.

Схема реакции 5



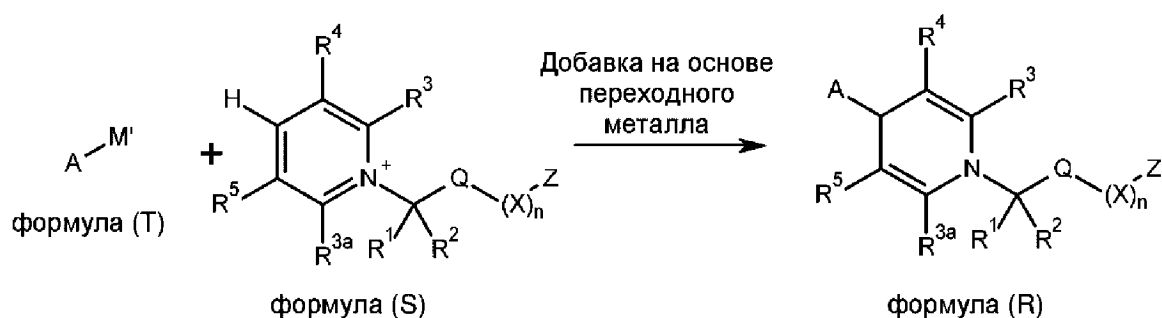
В другом подходе соединение формулы (I), где n, Q, Z, X, R^1 , R^2 , R^3 , R^{3a} , R^4 , R^5 и A определены для соединений формулы (I), может быть получено из соединения формулы (R) и окислителя в подходящем растворителе при подходящей температуре, как указано на схеме реакции 6. Иллюстративные окислители 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 6



Соединение формулы (R), где n , Q , Z , X , R^1 , R^2 , R^3 , R^{3a} , R^4 , R^5 и A определены для соединений формулы (I), может быть получено из соединения формулы (S) и металлоорганического соединения формулы (T), где M' включает, без ограничения, магниорганические, 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 7. 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).

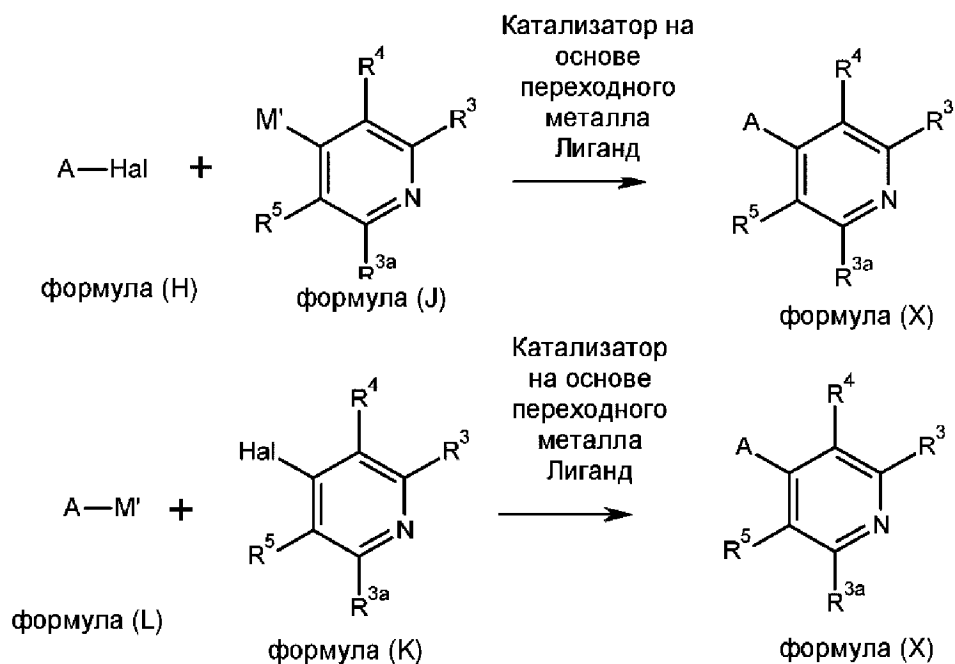
Схема реакции 7



Биарилпиридины 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 8. Hal определен как галоген или псевдогалоген, например трифлат, мезилат и тозилат. Такие реакции кросс-сочетания включают реакции Стилле (например, Sauer, J.; Heldmann, D. K. Tetrahedron, 1998, 4297), Сузуки-Мияуры (например, Luebbers, T.; Flohr, A.; Jolidon, S.; David-Pierson, P.; Jacobsen, H.; Ozmen, L.; Baumann, K. Bioorg. Med. Chem. Lett., 2011, 6554), Негиши (например, Imahori, T.; Suzawa, K.; Kondo, Y. Heterocycles, 2008, 1057) 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. Соединения формулы (H), формулы (K) и формулы (L) известны в литературе или могут быть получены посредством известных из литературы способов.

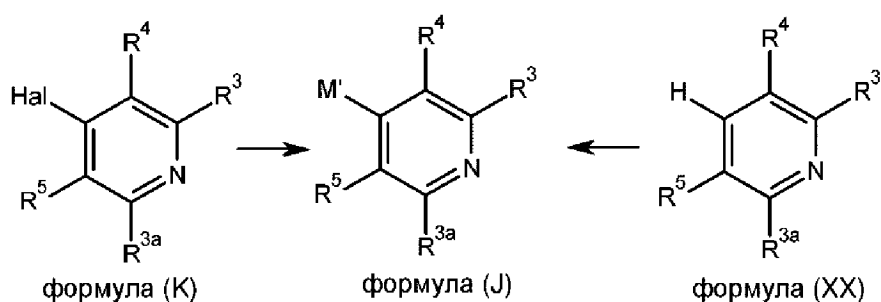
Схема реакции 8



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^{3a} , R^4 и R^5 определены для соединений формулы (I), путем замещение металлом водорода, непосредственно соединенного с атомом углерода, как указано на схеме реакции 9. 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^{3a} , R^4 и R^5 определены для соединений формулы (I), и Hal определен как галоген или псевдогалоген, например, трифлат, мезилат и тозилат, как описано на схеме 9. 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 2010/038465). 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 9



В дополнительном подходе, указанном на схеме 10, биарилпиридины формулы (X) могут быть получены с помощью классических подходов для синтеза колец, исходя из соединения формулы (ZZ), где R^3 , R^{3a} , R^4 и R^5 определены для соединений формулы (I) и T представляет собой функциональную группу, которую можно превратить посредством одной или нескольких химических стадий в 5-членный гетероарил A, где A определен для соединений формулы (I). Такие функциональные группы включают

без ограничения кислоту, сложный эфир, нитрил, амид, тиаамид и кетон. Родственные преобразования известны в литературе. Замещенные пиридины могут быть получены с применением методики, указанной в списке литературы.

5 Схема реакции 10



- 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
- 10 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
- 15 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
- 20 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.
- 25 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.

- 5 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
- 10 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
- 15 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
- 20 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
- 25 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-
- 30 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, 5 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, 10 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 15 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, 20 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 25 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, 30 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 рН-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. 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 масляные добавки включают алкиловые сложные эфиры C₈-C₂₂-жирных кислот, особенно метильные производные C₁₂-C₁₈-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 University, 2010.

5

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 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 потребитель обычно будет использовать разбавленные составы.

15

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 качестве общего руководства, соединения можно применять в норме от 1 до 2000 л/га, в частности, от 10 до 1000 л/га.

20

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

25

Эмульгируемые концентраты:

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

30

Пылевидные препараты:

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

Суспензионные концентраты:

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

5

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%.

10

Гранулы:

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

15 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.

20

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 + аметрин, I + амикарбазон, I + аминопиралид, I + аминотриазол, I + атразин, I + бефлубутамид-М, I + бенсульфурон (в том числе бенсульфурон-метил), I + бентазон, I + бициклопирон, I + биланафос, I + биспирибак-натрий, I + бикслозон, I + бромацил, I + бромоксинил, I + бутахлор, I + бутафенацил, I + карфентразон (в том числе карфентразон-этил), I + клорансулам (в том числе клорансулам-метил), I + хлоримурон (в том числе хлоримурон-этил), I + хлоротолурон, 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 + цигалофоп (в том числе цигалофоп-бутил), I + 2,4-D (в том

25

30

числе его холиновая соль и сложный 2-этилгексильный эфир), I + 2,4-DB, I + десмедифам, I + дикамба (в том числе алюминий, аминопропил, бис-аминопропилметил, холин, дихлорпроп, дигликольамин, диметиламин, диметиламмоний, калий и ее соли натрия) I + диклосулам, I + дифлуфеникан, I + 5 дифлуфензопир, I + диметаклор, I + диметенамид-Р, I + дикват дибромид, диурон, I + эталфлуралин, I + этофумезат, I + феноксапроп (в том числе феноксапроп-Р-этил), I + феноксасульфурон, I + фенквинотрион, I + фентразамид, I + флазасульфурон, I + флорасулам, I + флорпирауксифен (в том числе флорпирауксифен-бензил), I + флуазифоп (в том числе флуазифоп-Р-бутил), I + флукарбазон (в том числе 10 флукарбазон-натрий), I + флуфенацет, I + флуметсулам, I + флумиоксазин, I + флуометурон, I + флупирсульфурон (в том числе флупирсульфурон-метил-натрий), I + флуорокспир (в том числе флуорокспир-метил), I + фомесафен, I + форамсульфурон, I + глюфосинат (в том числе его соль аммония), I + глифосат (в том числе его соли диаммония, изопропиламмония и калия), I + галауксифен (в том числе галауксифен- 15 метил), I + галоксифоп (в том числе галоксифоп-метил), I + гексазион, I + гидантоцидин, I + имазамокс, I + имазапик, I + имазапир, I + имазетапир, I + индазифлам, I + йодосульфурон (в том числе йодосульфурон-метил-натрий), I + иофенсульфурон (в том числе иофенсульфурон-натрий), I + иоксинил, I + изопротурон, I + изоксафлютол, I + ланкотрион, I + МСРА, I + МСРВ, I + мекопроп-Р, I + 20 мезосульфурон (в том числе мезосульфурон-метил), I + мезотрион, I + метамитрон, I + метазахлор, I + метиозолин, I + метолахлор, I + метосулам, I + метрибузин, I + метсульфурон, I + напропамид, I + никосульфурон, I + норфлуразон, I + оксадиазон, I + оксасульфурон, I + оксифлуорфен, I + паракват дихлорид, I + пендиметалин, I + пеноксулам, I + фенмедифам, I + пиклорам, I + пиноксаден, I + претилахлор, I + 25 примисульфурон-метил, I + прометрин, I + пропанил, I + пропаквизафоп, I + пропирисульфурон, I + пропизамид, I + просульфокарб, I + просульфурон, I + пираклонил, I + пирафлуфен (в том числе пирафлуфен-этил), I + пирасульфотол, I + пиридат, I + пирифталид, I + пиримисульфам, I + пироксасульфурон, I + пироксулам, I + квинклорак, I + квинмерак, I + квизалофоп (в том числе квизалофоп-Р-этил и 30 квизалофоп-Р-тефурил), I + римсульфурон, I + сафлуфенацил, I + сетоксидим, I + симазин, I + S-металлохлор, I + сульфентразон, I + сульфосульфурон, I + тебутиурон, I + тефурилтрион, I + темботрион, I + тербутилазин, I + тербутрин, I + тетфлупиролимет, 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 + трифлорисульфурон, I + этил-2-[[3-[2-хлор-4-фтор-5-[3-метил-2,6-диоксо-4-(трифторметил)пиримидин-1-ил]фенокси]-2-пиридил]окси]ацетат, I + сложный

5 этиловый эфир 3-(2-хлор-4-фтор-5-(3-метил-2,6-диоксо-4-трифторметил-3,6-дигидропиримидин-1(2H)-ил)фенил)-5-метил-4,5-дигидроизоксазол-5-карбоновой кислоты, 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-этокси-4-гидрокси-1-метил-3-[4-(трифторметил)-2-

10 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-этокси-5-гидрокси-3-метилимидазолидин-2-он, I + 3-[2-(3,4-диметоксифенил)-6-метил-3-оксо-пиридазин-4-карбонил]бицикло[3.2.1]октан-2,4-дион, I + 2-[2-(3,4-

15 диметоксифенил)-6-метил-3-оксо-пиридазин-4-карбонил]-5-метил-циклогексан-1,3-дион, I + 2-[2-(3,4-диметоксифенил)-6-метил-3-оксо-пиридазин-4-карбонил]циклогексан-1,3-дион, I + 2-[2-(3,4-диметоксифенил)-6-метил-3-оксо-пиридазин-4-карбонил]-5,5-диметил-циклогексан-1,3-дион, I + 6-[2-(3,4-диметоксифенил)-6-метил-3-оксо-пиридазин-4-карбонил]-2,2,4,4-тетраметил-

20 циклогексан-1,3,5-трион, I + 2-[2-(3,4-диметоксифенил)-6-метил-3-оксо-пиридазин-4-карбонил]-5-этил-циклогексан-1,3-дион, I + 2-[2-(3,4-диметоксифенил)-6-метил-3-оксо-пиридазин-4-карбонил]-4,4,6,6-тетраметил-циклогексан-1,3-дион, I + 2-[6-циклопропил-2-(3,4-диметоксифенил)-3-оксо-пиридазин-4-карбонил]-5-метил-циклогексан-1,3-дион, I + 3-[6-циклопропил-2-(3,4-диметоксифенил)-3-оксо-пиридазин-4-

25 карбонил]бицикло[3.2.1]октан-2,4-дион, I + 2-[6-циклопропил-2-(3,4-диметоксифенил)-3-оксо-пиридазин-4-карбонил]-5,5-диметил-циклогексан-1,3-дион, I + 6-[6-циклопропил-2-(3,4-диметоксифенил)-3-оксо-пиридазин-4-карбонил]-2,2,4,4-тетраметил-циклогексан-1,3,5-трион, I + 2-[6-циклопропил-2-(3,4-диметоксифенил)-3-оксо-пиридазин-4-карбонил]циклогексан-1,3-дион, I + 4-[2-(3,4-диметоксифенил)-6-

30 метил-3-оксо-пиридазин-4-карбонил]-2,2,6,6-тетраметил-тетрагидропиран-3,5-дион, I + 4-[6-циклопропил-2-(3,4-диметоксифенил)-3-оксо-пиридазин-4-карбонил]-2,2,6,6-тетраметил-тетрагидропиран-3,5-дион, I + 4-амино-3-хлор-5-фтор-6-(7-фтор-1H-индол-6-ил)пиримидин-2-карбоновая кислота (в том числе их агрохимически приемлемые

сложные эфиры, например, метил-4-амино-3-хлор-5-фтор-6-(7-фтор-1H-индол-6-ил)пиридин-2-карбоксилат).

- 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.

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

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

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

20 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 + клокви́нтосет (в том числе клокви́нтосет-мексил); I + ципросульфамид; I + дихлормид; I + фенхлоразол (в том числе фенхлоразол-этил); I + фенклорим; I + флуксофеним; I+ фурилазол I + изоксацифен (в том числе изоксацифен-этил); I + мефенпир (в том числе мефенпир-диэтил); I + меткамифен и I + оксабетринил.

В частности, предпочтительными являются смеси соединения формулы (I) с ципросульфамидом, изоксацифеном (в том числе изоксацифен-этил), клокви́нтосетом
30 (в том числе клокви́нтосет-мексил) и/или меткамифеном.

Антидоты для соединения формулы (I) также могут находиться в форме сложных эфиров или солей, как упоминается, например, в The Pesticide Manual, 14th Edition (BCPC), 2006. Ссылка на клокви́нтосет-мексил также относится к его соли с литием,

натрием, калием, кальцием, магнием, алюминием, железом, аммонием, четвертичным аммонием, сульфонием или фосфонием, как раскрыто в WO 02/34048, а ссылка на фенхлоразол-этил также относится к фенхлоразолу и т. д.

- 5 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
10 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
15 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).
20 "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
25 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
30 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.

5 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.

10 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.

15 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

20 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®.

25 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

30 (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.

10

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).

15

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.

20

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*.

30

Соединения формулы (I) также пригодны для предуборочной десикации сельскохозяйственных культур, например, без ограничения картофеля, сои, сортов подсолнечника и хлопчатника. Предуборочную десикацию применяют для высушивания листьев сельскохозяйственных культур без значительного повреждения самой сельскохозяйственной культуры для способствования сбора урожая.

Соединения/композиции по настоящему изобретению особенно пригодны 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 %
Лигносульфонат 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 %	-

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 %
Додецилбензолсульфонат кальция	3 %
Полигликолевый эфир касторового масла (35 моль этиленоксида)	4 %
Циклогексанон	30 %
Смесь ксилолов	50 %

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 %

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

Экструдированные гранулы

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

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 покрытые оболочкой гранулы.

5 Суспензионный концентрат

Активные ингредиенты	40 %
Пропиленгликоль	10 %
Полиэтиленгликолевый эфир нонилфенола (15 моль этиленоксида)	6 %
Лигносульфонат 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.

10 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

5		
	Boc	= <i>трет</i> -бутилоксикарбонил
	br	= широкий
	CDCl ₃	= хлороформ-d
	CD ₃ OD	= метанол-d
10	°C	= градусы Цельсия
	D ₂ O	= вода-d
	DCM	= дихлорметан
	d	= дублет
	dd	= дублет дублетов
15	dt	= дублет триплетов
	DMSO	= диметилсульфоксид
	EtOAc	= этилацетат
	ч.	= час(часы)
	HCl	= хлористоводородная кислота
20	HPLC	= высокоэффективная жидкостная хроматография (описание устройства и способов, применяемых для HPLC, приведены ниже)
	m	= мультиплет
	M	= молярность
	мин.	= минуты
25	МГц	= мегагерц
	мл	= миллилитр
	т. пл.	= точка плавления
	ppm	= частей на миллион
	q	= квартет
30	quin	= квинтет
	к. т.	= комнатная температура
	s	= синглет
	t	= триплет
	THF	= тетрагидрофуран

LC/MS = жидкостная хроматография с масс-спектрометрией

Способ препаративной HPLC с обращенной фазой:

- 5 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 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.

10

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

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

- 15 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.

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

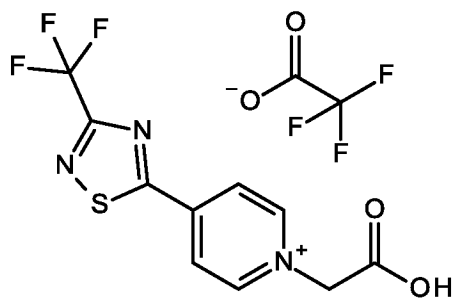
насос 515, 1 мл/мин., 90% метанола/10% воды, (подкачивающий насос)

- 20 Растворитель А: вода с 0,05% трифторуксусной кислотой

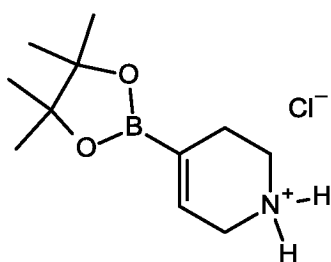
Растворитель В: ацетонитрил с 0,05% трифторуксусной кислотой

Примеры получения

- 25 Пример 1. Получение 2-[4-[3-(трифторметил)-1,2,4-тиадиазол-5-ил]пиридин-1-ий-1-ил]уксусной кислоты 2,2,2-трифторацетата A1

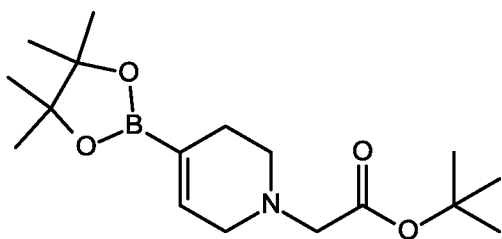


Стадия 1. Получение 4-(4,4,5,5-тетраметил-1,3,2-диоксаборолан-2-ил)-1,2,3,6-тетрагидропиридин-1-ия хлорида



- 5 Смесь *трет*-бутил-4-(4,4,5,5-тетраметил-1,3,2-диоксаборолан-2-ил)-3,6-дигидро-2Н-пиридин-1-карбоксилата (2 г) и водного раствора хлористоводородной кислоты (4 М в 1,4-диоксане, 19 мл) перемешивали при комнатной температуре в течение ночи. Реакционную смесь концентрировали и остаток растирали в порошок с помощью эфира с получением 4-(4,4,5,5-тетраметил-1,3,2-диоксаборолан-2-ил)-1,2,3,6-тетрагидропиридин-1-ия хлорида в виде белого твердого вещества.
- 10 ¹H ЯМР (400 МГц, D₂O) 6,28-6,21 (m, 1H), 3,69-3,62 (m, 2H), 3,21 (t, 2H), 2,41-2,24 (m, 2H), 1,12 (s, 12H) (протон NH отсутствует)

- Стадия 2. Получение *трет*-бутил-2-[4-(4,4,5,5-тетраметил-1,3,2-диоксаборолан-2-ил)-3,6-дигидро-2Н-пиридин-1-ил]ацетата
- 15

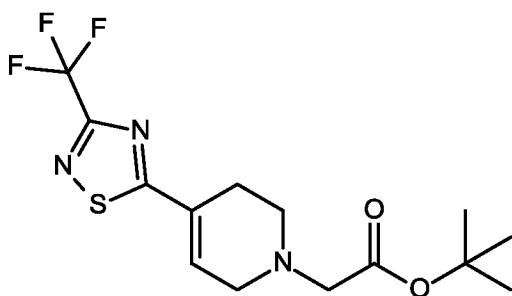


- Смесь 4-(4,4,5,5-тетраметил-1,3,2-диоксаборолан-2-ил)-1,2,3,6-тетрагидропиридин-1-ия хлорида (1,89 г), ацетонитрила (31,6 мл), калия карбоната (2,62 г) и *трет*-бутил-2-хлорацетата (1,35 мл) нагревали при 90°C в течение 20 часов. Реакционная смесь охлаждали и разделяли между водой и дихлорметаном, затем дополнительно
- 20

экстрагировали дихлорметаном (х2). Объединенную органическую фазу высушивали над сульфатом магния и концентрировали с получением *трет*-бутил-2-[4-(4,4,5,5-тетраметил-1,3,2-диоксаборолан-2-ил)-3,6-дигидро-2Н-пиридин-1-ил]ацетата в виде желтой смолы.

- 5 ¹H ЯМР (400МГц, CDCl₃) 6,52-6,43 (m, 1H), 3,24-3,15 (m, 4H), 2,68 (t, 2H), 2,34-2,26 (m, 2H), 1,46 (s, 9H), 1,25 (s, 12H)

Стадия 3. Получение *трет*-бутил-2-[4-[3-(трифторметил)-1,2,4-тиадиазол-5-ил]-3,6-дигидро-2Н-пиридин-1-ил]ацетата



10

Смесь *трет*-бутил-2-[4-(4,4,5,5-тетраметил-1,3,2-диоксаборолан-2-ил)-3,6-дигидро-2Н-пиридин-1-ил]ацетата (0,838 г), [1,1'-бис(дифенилфосфино)ферроцен]дихлорпалладия(II) (0,155 г), 5-хлор-3-(трифторметил)-1,2,4-тиадиазола (0,4 г), карбоната натрия (0,899 г), 1,4-диоксана (7,43 мл) и воды (7,43 мл) дегазировали азотом, затем нагревали при 120°C в условиях микроволнового излучения в течение 1 часа. Реакционную смесь охлаждали до комнатной температуры, затем фильтровали через диатомовую земля и разделяли между водой и этилацетатом. Органическую фазу концентрировали, затем очищали посредством хроматографии на силикагеле с элюированием 0–50% этилацетата в циклогексане с получением *трет*-бутил-2-[4-[3-(трифторметил)-1,2,4-тиадиазол-5-ил]-3,6-дигидро-2Н-пиридин-1-ил]ацетата.

15

20

¹H ЯМР (400МГц, CDCl₃) 6,83-6,99 (m, 1H), 3,44-3,50 (m, 2H), 3,30-3,33 (m, 2H), 2,90-2,96 (m, 2H), 2,69-2,75 (m, 2H), 1,48-1,51 (m, 9H)

25

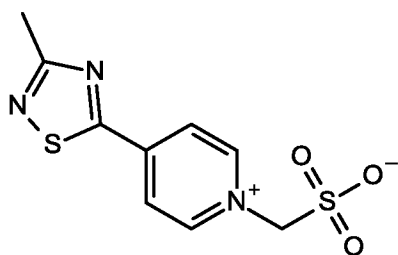
Стадия 4. Получение 2-[4-[3-(трифторметил)-1,2,4-тиадиазол-5-ил]пиридин-1-ий-1-ил]уксусной кислоты 2,2,2-трифторацетата A1

В раствор *трет*-бутил-2-[4-[3-(трифторметил)-1,2,4-тиадиазол-5-ил]-3,6-дигидро-2Н-пиридин-1-ил]ацетата (0,43 г) в 1,4-диоксане (6,6 мл) добавляли *N*-бромсукцинимид

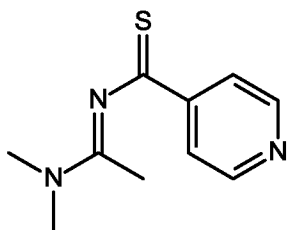
(0,294 г) одной порцией с последующим перемешиванием при комнатной температуре в течение 2 часов. В реакционную смесь затем добавляли водный раствор хлористоводородной кислоты (2,4 мл, 4 М в 1,4-диоксане) с дополнительным перемешиванием в течение 5 часов при комнатной температуре. Реакционную смесь разбавляли *трет*-бутилметилловым эфиром (20 мл) и полученное твердое вещество фильтровали, промывали дополнительным количеством *трет*-бутилметилового эфира, затем очищали посредством препаративной HPLC с обращенной фазой (трифторуксусная кислота присутствовала в элюенте) с получением 2-[4-[3-(трифторметил)-1,2,4-тиадиазол-5-ил]пиридин-1-ий-1-ил]уксусной кислоты 2.2.2-трифторацетата.

¹H ЯМР (400 МГц, D₂O) 9,06 (d, 2H), 8,69 (d, 2H), 5,41 (s, 2H) (протон CO₂H отсутствует)

Пример 2. Получение [4-(3-метил-1,2,4-тиадиазол-5-ил)пиридин-1-ий-1-ил]метансульфоната A2



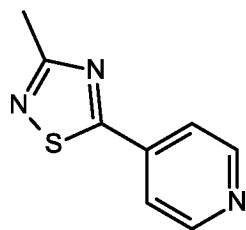
Стадия 1. Получение (*NE*)-*N*-[1-(диметиламино)этилиден]пиридин-4-карботиоамида



Смесь пиридин-4-карботиоамида (1 г) и 1,1-диметокси-*N,N*-диметил-этанамин (1,05 мл) перемешивали вместе при комнатной температуре в течение одного часа. Реакционную смесь концентрировали с получением (*NE*)-*N*-[1-(диметиламино)этилиден]пиридин-4-карботиоамида в виде красной смолы, которая кристаллизовалась при отстаивании.

¹H ЯМР (400 МГц, CD₃OD) 8,55-8,51 (m, 2H), 8,11-8,08 (m, 2H), 3,37 (s, 3H), 3,26-3,21 (m, 3H), 2,52 (s, 3H)

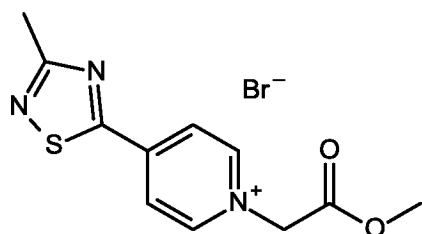
Стадия 2. Получение 3-метил-5-(4-пиридил)-1,2,4-тиадиазола



В раствор (*NE*)-*N*-[1-(диметиламино)этилиден]пиридин-4-карботиоамида (1,5 г) и пиридина (1,23 мл) в этаноле (36 мл) при комнатной температуре добавляли второй
 5 раствор гидроксиламин-О-сульфоновой кислоты (0,9 г) в метаноле (14 мл). Реакционную смесь перемешивали при комнатной температуре в течение одного часа, затем гасили насыщенным водным раствором бикарбоната натрия и экстрагировали дихлорметаном. Органическую фазу концентрировали, растирали гексаном, затем сушили с получением 3-метил-5-(4-пиридил)-1,2,4-тиадиазола в виде коричневого
 10 твердого вещества.

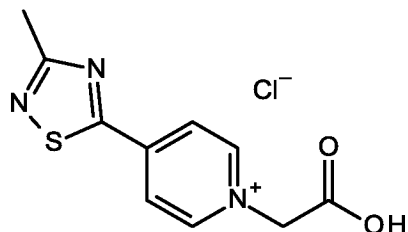
¹H ЯМР (400 МГц, CD₃OD) 8,78-8,71 (m, 2H), 8,00-7,96 (m, 2H), 2,72 (s, 3H)

Стадия 3. Получение метил-2-[4-(3-метил-1,2,4-тиадиазол-5-ил)пиридин-1-ий-1-ил]ацетата бромид



Смесь 3-метил-5-(4-пиридил)-1,2,4-тиадиазола (1,165 г), ацетонитрила (20 мл) и метил-2-бромацетата (0,93 мл) нагревали при 80°C в течение 25 часов. Реакционную смесь разделяли между водой и дихлорметаном и водную фазу концентрировали с получением
 15 метил-2-[4-(3-метил-1,2,4-тиадиазол-5-ил)пиридин-1-ий-1-ил]ацетатбромид, который применяли без дополнительной очистки.
 20

Стадия 4. Получение хлорида 2-[4-(3-метил-1,2,4-тиадиазол-5-ил)пиридин-1-ий-1-ил]уксусной кислоты A59

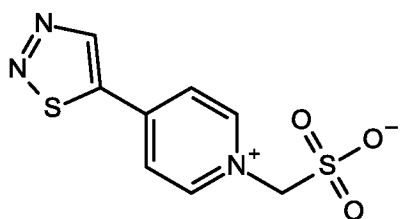


- 5 Раствор неочищенного метил-2-[4-(3-метил-1,2,4-тиадиазол-5-ил)пиридин-1-ий-1-ил]ацетата бромид (1,7 г) и 2 М водного раствора хлористоводородной кислоты (45 мл) нагревали при 50°C в течение 4 часов. Реакционную смесь затем концентрировали с получением хлорида 2-[4-(3-метил-1,2,4-тиадиазол-5-ил)пиридин-1-ий-1-ил]уксусной кислоты.
- 10 ¹H ЯМР (400 МГц, D₂O) 8,93-8,89 (m, 2H), 8,51-8,46 (m, 2H), 5,37 (s, 2H), 2,67 (s, 3H) (протон CO₂H отсутствует)

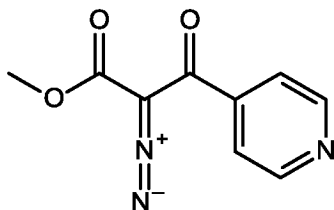
Стадия 5. Получение [4-(3-метил-1,2,4-тиадиазол-5-ил)пиридин-1-ий-1-ил]метансульфоната A2

- 15 Смесь хлорида 2-[4-(3-метил-1,2,4-тиадиазол-5-ил)пиридин-1-ий-1-ил]уксусной кислоты (0,83 г) и триметилсилилхлорсульфоната (11 мл) нагревали при 120°C в течение ночи. Реакционную смесь охлаждали до комнатной температуры и разделяли между водой и дихлорметаном. Водную фазу затем концентрировали и очищали
- 20 посредством препаративной HPLC с обращенной фазой с получением [4-(3-метил-1,2,4-тиадиазол-5-ил)пиридин-1-ий-1-ил]метансульфоната в виде белого твердого вещества.
- ¹H ЯМР (400 МГц, D₂O) 9,02-9,20 (m, 2H) 8,55-8,68 (m, 2H) 5,58-5,81 (m, 2H) 2,65-2,82 (m, 3H)

Пример 3. Получение [4-(тиадиазол-5-ил)пиридин-1-ий-1-ил]метансульфоната А3



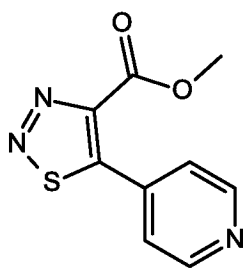
Стадия 1. Получение метил-2-диазо-3-оксо-3-(4-пиридил)пропаноата



- 5 В смесь метил-3-оксо-3-(4-пиридил)пропаноата (4 г) и 4-ацетамидобензолсульфонилазида (6,082 г) в дихлорметане (130 мл) добавляли триэтиламин (9,43 мл) по каплям при 0°C. Реакционную смесь медленно нагревали до комнатной температуры, затем перемешивали в течение ночи. После фильтрации через диоксид кремния с последующим промыванием дихлорметаном фильтрат затем
- 10 концентрировали с получением метил-2-диазо-3-оксо-3-(4-пиридил)пропаноата в виде желтой смолы.

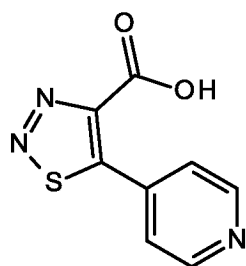
¹H ЯМР (400МГц, CDCl₃) 8,78-8,71 (m, 2H), 7,45-7,40 (m, 2H) 3,79 (s, 3H)

Стадия 2. Получение метил-5-(4-пиридил)тиадиазол-4-карбоксилата



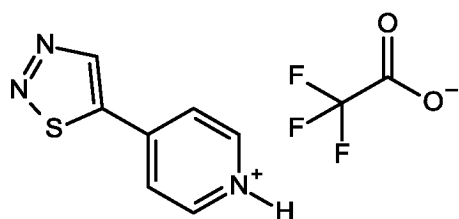
- 15 Смесь метил-2-диазо-3-оксо-3-(4-пиридил)пропаноата (4,58 г) и реагента Лавессона (11,2 г) в толуоле (112 мл) нагревали при 120°C в течение ночи. Реакционную смесь концентрировали, затем очищали посредством хроматографии на силикагеле с элюированием 0–50% метанола в дихлорметане с получением метил-5-(4-
- 20 пиридил)тиадиазол-4-карбоксилата, который применяли на следующей стадии без дополнительной очистки.

Стадия 3. Получение 5-(4-пиридил)тиадиазол-4-карбоновой кислоты



Смесь неочищенного метил-5-(4-пиридил)тиадиазол-4-карбоксилата (4 г) и 2 М водного раствора хлористоводородной кислоты (150 мл) нагревали с обратным холодильником в течение 3 часов. Реакционную смесь концентрировали и разделяли между водой и этилацетатом. Водный слой концентрировали с получением 5-(4-пиридил)тиадиазол-4-карбоновой кислоты, которую применяли на следующей стадии без дополнительной очистки.

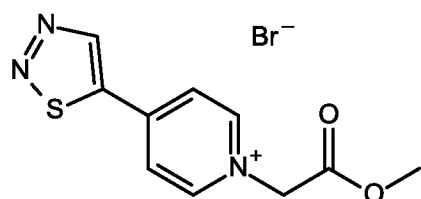
Стадия 4. Получение 5-пиридин-1-ий-4-илтиадиазол-2.2.2-трифторацетата



Смесь 5-(4-пиридил)тиадиазол-4-карбоновой кислоты (3,35 г), воды (5 мл) и 1,4-диоксана (80 мл) нагревали при 100°C в течение ночи. Реакционную смесь концентрировали и очищали посредством препаративной HPLC с обращенной фазой (трифторуксусная кислота присутствовала в элюенте) с получением 5-пиридин-1-ий-4-илтиадиазол-2.2.2-трифторацетата в виде белого твердого вещества.

¹H ЯМР (400 МГц, CD₃OD) 9,45 (s, 1H), 8,90-8,83 (m, 2H), 8,21-8,16 (m, 2H)

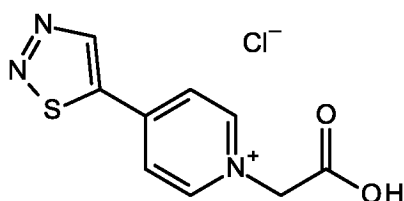
Стадия 5. Получение метил-2-[4-(тиадиазол-5-ил)пиридин-1-ий-1-ил]ацетата бромид



Смесь 5-пиридин-1-ий-4-илтиадиазол-2,2,2-трифторацетата (0,5 г), ацетонитрила (10 мл) и метил-2-бромацетата (0,44 мл) нагревали при 80°C в течение 25 часов. Реакционную смесь концентрировали и разделяли между водой и дихлорметаном. Водный слой концентрировали с получением метил-2-[4-(тиадиазол-5-ил)пиридин-1-ий-1-ил]ацетата бромид в виде коричневой смолы.

¹H ЯМР (400 МГц, D₂O) 9,39-9,45 (m, 1H) 8,85-8,93 (m, 2H) 8,35-8,44 (m, 2H) 5,55 (s, 2H) 3,73-3,84 (m, 3H)

Стадия 6. Получение хлорида 2-[4-(тиадиазол-5-ил)пиридин-1-ий-1-ил]уксусной кислоты А9



Смесь метил-2-[4-(тиадиазол-5-ил)пиридин-1-ий-1-ил]ацетата бромид (0,46 г) и 2 М водного раствора хлористоводородной кислоты (20 мл) нагревали при 50°C в течение 5 часов. Реакционную смесь концентрировали с получением хлорида 2-[4-(тиадиазол-5-ил)пиридин-1-ий-1-ил]уксусной кислоты.

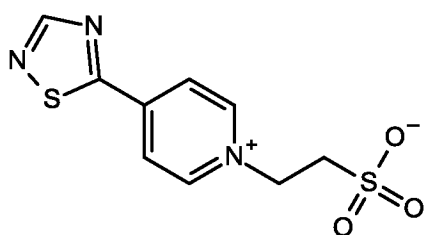
¹H ЯМР (400 МГц, D₂O) 9,38-9,43 (m, 1H) 8,83-8,90 (m, 2H) 8,33-8,40 (m, 2H) 5,40 (s, 2H) (протон CO₂H отсутствует)

Стадия 7. Получение [4-(тиадиазол-5-ил)пиридин-1-ий-1-ил]метансульфоната А3

Смесь хлорида 2-[4-(тиадиазол-5-ил)пиридин-1-ий-1-ил]уксусной кислоты (0,46 г) и триметилсилилхлорсульфоната (5,4 мл) нагревали при 120°C в течение ночи. Реакционную смесь охлаждали до комнатной температуры и разделяли между водой и дихлорметаном. Водную фазу концентрировали, затем очищали посредством препаративной HPLC с обращенной фазой с получением [4-(тиадиазол-5-ил)пиридин-1-ий-1-ил]метансульфоната в виде белого твердого вещества.

¹H ЯМР (400 МГц, D₂O) 9,41-9,49 (m, 1H) 8,95-9,04 (m, 2H) 8,37-8,49 (m, 2H) 5,68 (br s, 2H)

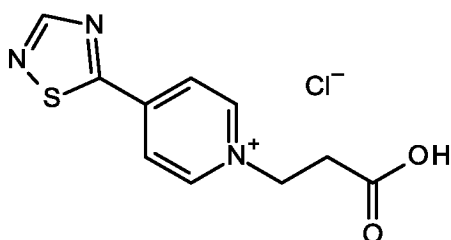
Пример 4. Получение 2-[4-(1,2,4-тиадиазол-5-ил)пиридин-1-ий-1-ил]этансульфоната A5



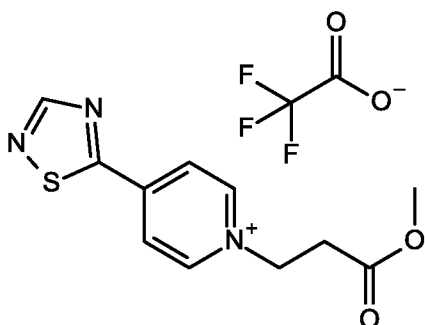
Смесь 5-(4-пиридил)-1,2,4-тиадиазола (300 мг), натрий-2-бромэтансульфоновой кислоты (465 мг) и воды (6 мл) нагревали при 100°C в течение ночи. Реакционную смесь концентрировали и очищали посредством препаративной HPLC с обращенной фазой с получением 2-[4-(1,2,4-тиадиазол-5-ил)пиридин-1-ий-1-ил]этансульфоната

1H ЯМР (400 МГц, D₂O) 9,02-9,11 (m, 2H) 8,87-8,99 (m, 1H) 8,47-8,60 (m, 2H) 4,94-5,05 (m, 2H) 3,48-3,61 (m, 2H)

10 Пример 5. Получение хлорида 3-[4-(1,2,4-тиадиазол-5-ил)пиридин-1-ий-1-ил]пропановой кислоты A7



Стадия 1. Получение метил-3-[4-(1,2,4-тиадиазол-5-ил)пиридин-1-ий-1-ил]пропаноата 2,2,2-трифторацетата



15 Смесь 5-(4-пиридил)-1,2,4-тиадиазола (0,3 г), ацетонитрила (6 мл) и метил-3-бромпропionato (0,31 мл) нагревали при 80°C в течение 25 часов. Реакционную смесь охлаждали и распределяли между водой и дихлорметаном. Водный слой концентрировали, затем очищали посредством препаративной HPLC с обращенной

фазой с получением метил-3-[4-(1,2,4-тиадиазол-5-ил)пиридин-1-ий-1-ил]пропаноата 2.2.2-трифторацетата в виде белого твердого вещества

¹H ЯМР (400 МГц, D₂O) 9,07 (d, 2H), 8,94 (s, 1H), 8,54 (d, 2H), 4,90 (t, 2H), 3,60 (s, 3H), 3,18 (t, 2H)

5

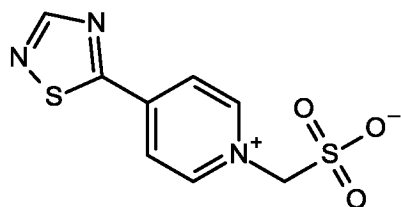
Стадия 2. Получение хлорида 3-[4-(1,2,4-тиадиазол-5-ил)пиридин-1-ий-1-ил]пропановой кислоты А7

Смесь метил-3-[4-(1,2,4-тиадиазол-5-ил)пиридин-1-ий-1-ил]пропаноата (50 мг) и 2 М водного раствора хлористоводородной кислоты (1 мл) нагревали при 50°C в течение 5 часов. Реакционную смесь концентрировали с получением хлорида 3-[4-(1,2,4-тиадиазол-5-ил)пиридин-1-ий-1-ил]пропановой кислоты в виде белого твердого вещества.

¹H ЯМР (400 МГц, D₂O) 9,05 (d, 2H), 8,92 (s, 1H), 8,51 (d, 2H), 4,87 (t, 2H), 3,15 (t, 2H) (протон CO₂H отсутствует)

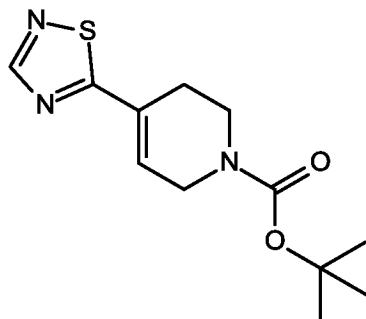
15

Пример 6. Получение [4-(1,2,4-тиадиазол-5-ил)пиридин-1-ий-1-ил]метансульфоната А4



Стадия 1. Получение трет-бутил-4-(1,2,4-тиадиазол-5-ил)-3,6-дигидро-2Н-пиридин-1-карбоксилата

20

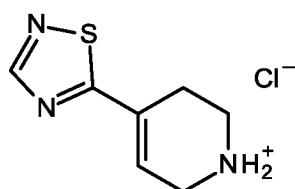


В смесь 5-бром-1,2,4-тиадиазола (5 г), 1,4-диоксана (50 мл) и воды (17 мл) добавляли трет-бутил-4-(4,4,5,5-тетраметил-1,3,2-диоксаборолан-2-ил)-3,6-дигидро-2Н-пиридин-1-карбоксилат (10 г), карбонат цезия (15 г) и комплекс 1,1'-

бис(дифенилфосфино)ферроцен-палладия(II) дихлорида и дихлорметана (2,5 г). Смесь продували азотом, затем нагревали при 95°C в течение 19 часов. Смесь фильтровали через целит и фильтрат концентрировали и очищали посредством хроматографии на силикагеле с элюированием 0–30% этилацетата в циклогексане с получением трет-бутил-4-(1,2,4-тиадиазол-5-ил)-3,6-дигидро-2Н-пиридин-1-карбоксилата в виде желтой жидкости.

¹Н ЯМР (400МГц, CDCl₃) 8,61 (s, 1H), 6,81 (br s, 1H), 4,18 (br d, 2H), 3,68 (br t, 2H), 2,68 (br dd, 2H), 1,49 (s, 9H)

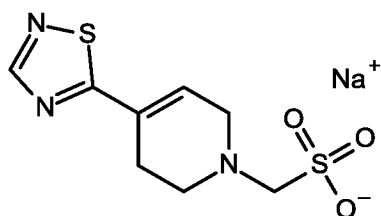
10 Стадия 2. Получение 5-(1,2,3,6-тетрагидропиридин-4-ил)-1,2,4-тиадиазола гидрохлорида



Смесь трет-бутил-4-(1,2,4-тиадиазол-5-ил)-3,6-дигидро-2Н-пиридин-1-карбоксилата (5 г) и хлористоводородной кислоты (4 М в диоксане, 26 мл) перемешивали при комнатной температуре в течение 1,5 часа. Смесь концентрировали, подвергали азеотропной перегонке с толуолом и полученный осадок промывали этилацетатом (2x40 мл) и высушивали с получением 5-(1,2,3,6-тетрагидропиридин-4-ил)-1,2,4-тиадиазола гидрохлорида в виде бледно-розового твердого вещества.

¹Н ЯМР (400 МГц, D₂O) 8,63 (s, 1H), 6,80 (tt, 1H), 3,90 (q, 2H), 3,46 (t, 2H), 2,85 (qt, 2H)

20 Стадия 3. Получение натрий-[4-(1,2,4-тиадиазол-5-ил)-3,6-дигидро-2Н-пиридин-1-ил]метансульфоната



В раствор 5-(1,2,3,6-тетрагидропиридин-4-ил)-1,2,4-тиадиазола гидрохлорида (2,5 г) в воде (12 мл) добавляли гидроксид натрия (0,54 г). Гидроксиметансульфонат натрия (аддукт формальдегида-бисульфита натрия, 1,6 г) добавляли и смесь перемешивали при комнатной температуре в течение 1 часа, периодически проверяя pH раствора с

поддерживанием от pH 10 до 11 путем добавления дополнительного количества водного раствора 2 М гидроксида натрия. Смесь лиофилизировали с получением натрий-[4-(1,2,4-тиадиазол-5-ил)-3,6-дигидро-2Н-пиридин-1-ил]метансульфоната в виде грязно-белого твердого вещества, которое применяли без дополнительной

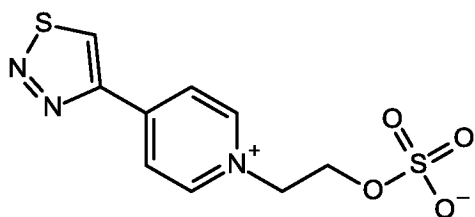
¹Н ЯМР (400 МГц, D₂O) 8,61 (s, 1H), 6,86 (td, 1H), 3,90 (s, 2H), 3,66 (q, 2H), 3,15 (t, 2H), 2,67 - 2,62 (m, 2H)

Стадия 4. Получение [4-(1,2,4-тиадиазол-5-ил)пиридин-1-ий-1-ил]метансульфоната А4

В смесь натрий-[4-(1,2,4-тиадиазол-5-ил)-3,6-дигидро-2Н-пиридин-1-ил]метансульфоната (2,452 г) в сухом ацетонитриле (15,8 мл) в атмосфере азота добавляли 2,3-дихлор-5,6-дициано-1,4-бензохинон (3,67 г) частями в течение 3 минут. Смесь перемешивали при 25°C в течение 18 часов. В смесь добавляли триметилсилилбромид (0,718 мл). После 15 минут перемешивания тетрагидрофуран (47,4 мл) добавляли и смесь перемешивали в течение дополнительных 20 минут. Твердое вещество отфильтровывали, промывали тетрагидрофураном и высушивали. Твердое вещество очищали посредством препаративной HPLC с обращенной фазой с получением [4-(1,2,4-тиадиазол-5-ил)пиридин-1-ий-1-ил]метансульфоната в виде грязно-белого твердого вещества.

¹Н ЯМР (400 МГц, D₂O) 9,25-9,02 (m, 3H), 8,81-8,66 (m, 2H), 5,85-5,74 (m, 2H)

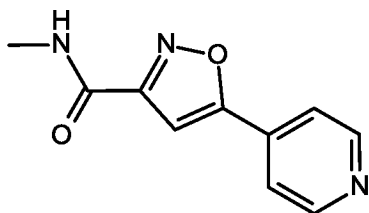
Пример 7. Получение 2-[4-(тиадиазол-4-ил)пиридин-1-ий-1-ил]этилсульфата А65



Смесь 4-(4-пиридил)тиадиазола (0,1 г), 1,3,2-диоксатиолан-2,2-диоксида (0,087 г) и 1,2-дихлорэтана (6 мл) нагревали при 85°C в течение 18 часов. Полученный осадок отфильтровывали и высушивали на воздухе с получением 2-[4-(тиадиазол-4-ил)пиридин-1-ий-1-ил]этилсульфата в виде белого твердого вещества.

¹Н ЯМР (400 МГц, DMSO-*d*₆) 10,23 - 10,36 (m, 1H), 9,09 - 9,24 (m, 2H), 8,73 - 8,96 (m, 2H), 4,73 - 4,94 (m, 2H), 4,18 - 4,34 (m, 2H)

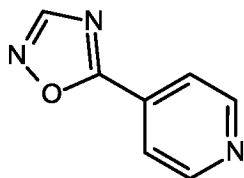
Пример 8. Получение N-метил-5-(4-пиридил)изоксазол-3-карбоксамида



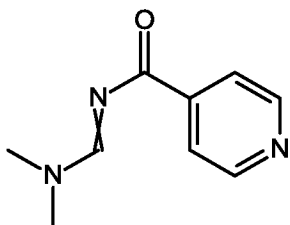
В раствор 5-(4-пиридил)изоксазол-3-карбоновой кислоты (0,5 г) в дихлорметане (14 мл) добавляли 1-хлор-N,N,2-триметил-проп-1-ен-1-амин (0,35 мл) по каплям. После перемешивания в течение 30 минут раствор метанамина (2 М в тетрагидрофуране, 2,63 мл) и N,N'-диизопропилэтиламина (0,504 мл) в дихлорметане добавляли по каплям. Полученную смесь перемешивали в течение ночи при комнатной температуре. Смесь распределяли между дихлорметаном и водой. Органический слой концентрировали с получением N-метил-5-(4-пиридил)изоксазол-3-карбоксамида в виде желтого твердого вещества.

^1H ЯМР (400 МГц, DMSO- d_6) 8,90 - 8,81 (m, 1H), 8,81 - 8,75 (m, 2H), 7,95 - 7,87 (m, 2H), 7,67 (s, 1H), 2,81 (d, 3H)

Пример 9. Получение 5-(4-пиридил)-1,2,4-оксадиазола



Стадия 1. Получение N-(диметиламинометил)пиридин-4-карбоксамида



Смесь пиридин-4-карбоксамида (5 г) и 1,1-диметокси-N,N-диметил-метанамина (5,46 мл) перемешивали вместе при комнатной температуре в течение 4 часов. Смесь концентрировали и очищали посредством хроматографии на силикагеле с элюированием 0–50% метанола в ацетонитриле с получением N-(диметиламинометил)пиридин-4-карбоксамида в виде белого твердого вещества.

^1H ЯМР (400МГц, CDCl_3) 8,77 - 8,70 (m, 2H), 8,69 - 8,65 (m, 1H), 8,08 - 8,02 (m, 2H), 3,24 (d, 6H)

Стадия 2. Получение 5-(4-пиридил)-1,2,4-оксадиазола

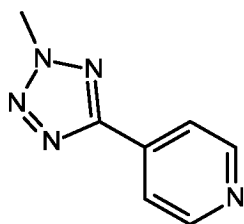
5

В N-(диметиламинометил)пиридин-4-карбоксамид (3,99 г) добавляли раствор диоксана (27 мл), гидроксиламина (50% водный раствор, 2,07 мл) и уксусной кислоты (32 мл). Смесь нагревали при 90°C в течение 1 часа. Реакционную смесь концентрировали и разделяли между насыщенным водным раствором бикарбоната натрия и дихлорметана. Органический слой концентрировали и очищали посредством препаративной HPLC с обращенной фазой с получением 5-(4-пиридил)-1,2,4-оксадиазола в виде белого твердого вещества.

10

^1H ЯМР (400 МГц, CD_3OD) 8,95 - 8,88 (m, 3H), 8,30 - 8,25 (m, 2H)

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

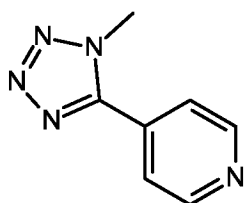


В смесь 4-(1H-тетразол-5-ил)пиридина (0,4 г) и N,N-диметилформамида (3,5 мл) добавляли диметилкарбонат (2,2 мл) и 1,4-диазабицикло[2.2.2]октана (0,032 г) и смесь нагревали при 130°C в течение ночи. Реакционную смесь охлаждали до комнатной температуры и 0,25 М водный раствор гидроксида натрия (11 мл) добавляли и смесь экстрагировали этилацетатом (x3). Объединенные органические слои промывали водой и концентрировали с получением 4-(2-метилтетразол-5-ил)пиридина.

20

^1H ЯМР (400МГц, CDCl_3) 8,80 - 8,75 (m, 2H), 8,04 - 7,99 (m, 2H), 4,45 (s, 3H)

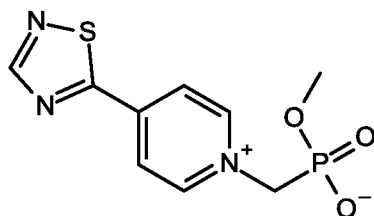
25 Материал выделяли в виде смеси с 4-(1-метилтетразол-5-ил)пиридином.



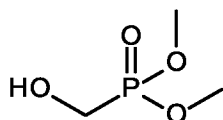
^1H ЯМР (400 МГц, CDCl_3) 8,91 - 8,85 (m, 2H), 7,72 - 7,68 (m, 2H), 4,26 (s, 3H)

Разделение изомеров происходило после алкилирования пиридина.

Пример 11. Получение метокси-[[4-(1,2,4-тиадиазол-5-ил)пиридин-1-ий-1-ил]метил]фосфината А30



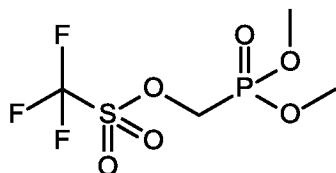
Стадия 1. Получение диметоксифосфорилметанола



В раствор метоксифосфоноилоксиметана (8 г) в метаноле (40 мл) добавляли параформальдегид (2,18 г) и карбонат калия (0,502 г) при комнатной температуре. Реакционную смесь перемешивали при комнатной температуре в течение 1 часа. Реакционную смесь фильтровали через целит и промывали дихлорметаном (50 мл). Фильтрат концентрировали, затем очищали посредством хроматографии на силикагеле с элюированием смесью этилацетата в н-гексанах с получением диметоксифосфорилметанола в виде бесцветной жидкости.

^1H ЯМР (400 МГц, CDCl_3) 3,96 – 3,94 (d, 2H), 3,83 – 3,80 (d, 6H) (протон OH отсутствует)

Стадия 2. Получение диметоксифосфорилметилтрифторметансульфоната



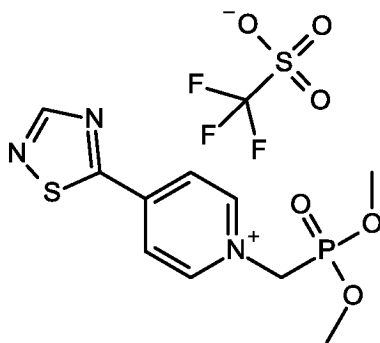
В раствор диметоксифосфорилметанола (5 г) в дихлорметане (50 мл) при -78°C в атмосфере азота добавляли 2,6-лутидин (6,94 мл) и трифлатный ангидрид (6,0 мл). Обеспечивали нагревание полученной реакционной смеси до комнатной температуры и перемешивали при комнатной температуре в течение 1 часа. Реакционную смесь выливали в воду и экстрагировали дихлорметаном (2×50 мл). Объединенные

органические слои промывали 1 М водным раствором хлористоводородной кислоты (50 мл), высушивали над сульфатом натрия и концентрировали с получением диметоксифосфорилметилтрифторметансульфоната в виде бледно-желтой жидкости.

^1H ЯМР (400 МГц, CDCl_3) 4,67 – 4,64 (d, 2H), 3,90 – 3,87 (d, 6H)

5

Стадия 3. Получение 5-[1-(диметоксифосфорилметил)пиридин-1-ий-4-ил]-1,2,4-тиадиазола трифторметансульфоната A77



В раствор 5-(4-пиридил)-1,2,4-тиадиазола (1,5 г) в тетрагидрофуране (20 мл) добавляли диметоксифосфорилметилтрифторметансульфонат (3,56 г) при комнатной температуре. Полученную смесь нагревали при 60°C в течение 16 часов. Реакционную смесь концентрировали и остаток растворяли в воде (25 мл) и промывали дихлорметаном (2×25 мл). Водный слой концентрировали и очищали посредством HPLC с обращенной фазой (100% вода) с получением 5-[1-(диметоксифосфорилметил)пиридин-1-ий-4-ил]-1,2,4-тиадиазола трифторметансульфоната в виде светло-коричневого твердого вещества.

^1H ЯМР (400 МГц, $\text{DMSO}-d_6$) 9,33 (s, 1H), 9,22 - 9,17 (m, 2H), 8,88 - 8,83 (m, 2H), 5,54 (d, 2H), 3,83 - 3,76 (m, 6H)

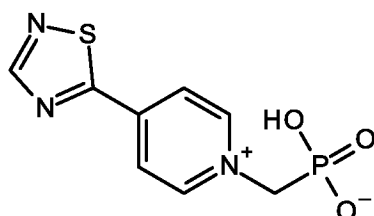
Стадия 4. Получение метокси-[[4-(1,2,4-тиадиазол-5-ил)пиридин-1-ий-1-ил]метил]фосфината A30

В смесь 5-[1-(диметоксифосфорилметил)пиридин-1-ий-4-ил]-1,2,4-тиадиазолтрифторметансульфоната (0,3 г) в дихлорметане (10 мл) добавляли бромтриметилсилан (0,1 мл) при комнатной температуре. Реакционную смесь перемешивали при комнатной температуре в течение 2 часов. Реакционную смесь концентрировали и остаток растворяли в воде (25 мл) и промывали дихлорметаном (2×25 мл). Водный слой концентрировали и очищали посредством HPLC с обращенной

фазой (100% вода) с получением метокси-[[4-(1,2,4-тиадиазол-5-ил)пиридин-1-ий-1-ил]метил]фосфината в виде грязно-белого твердого вещества.

^1H ЯМР (400 МГц, D_2O) 8,96 - 8,88 (m, 3H), 8,54 (d, 2H), 4,90 - 4,83 (m, 2H), 3,54 (d, 3H)

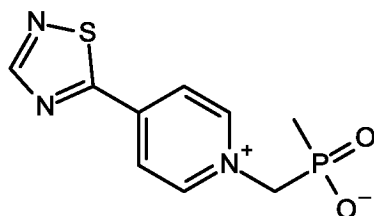
5 Пример 12. Получение гидрокси-[[4-(1,2,4-тиадиазол-5-ил)пиридин-1-ий-1-ил]метил]фосфината A32



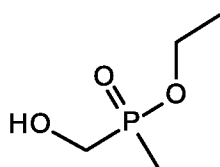
В раствор 5-[1-(диметоксифосфорилметил)пиридин-1-ий-4-ил]-1,2,4-тиадиазолтрифторметансульфоната (0,3 г) в дихлорметане (10 мл) добавляли бромтриметилсилан (0,5 мл) при комнатной температуре. Реакционную смесь перемешивали при комнатной температуре в течение 4 часов. Реакционную смесь концентрировали и остаток растворяли в воде (25 мл) и промывали дихлорметаном (2×25 мл). Водный слой концентрировали и очищали посредством HPLC с обращенной фазой (100% вода) с получением гидрокси-[[4-(1,2,4-тиадиазол-5-ил)пиридин-1-ий-1-ил]метил]фосфината в виде бесцветной смолы.

^1H ЯМР (400 МГц, D_2O) 9,01 - 8,86 (m, 3H), 8,54 (d, 2H), 4,84 - 4,78 (m, 2H) (протон РОН отсутствует)

20 Пример 13. Получение метил-[[4-(1,2,4-тиадиазол-5-ил)пиридин-1-ий-1-ил]метил]фосфината A10



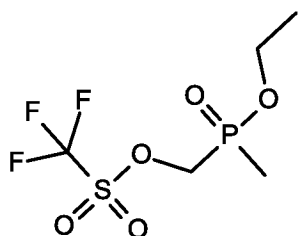
Стадия 1. Получение [этокси(метил)фосфорил]метанола



В раствор 1-[этокси(метил)фосфорил]оксиэтана (3 г) в ацетонитриле (30 мл) добавляли триэтиламин (0,668 г), параформальдегид (0,727 г) и воду (0,436 мл) при комнатной температуре. Реакционную смесь перемешивали при комнатной температуре в течение 16 часов. Реакционную смесь концентрировали и очищали посредством хроматографии на силикагеле с элюированием смесью метанола в дихлорметане с получением [этокси(метил)фосфорил]метанола в виде бесцветной жидкости.

^1H ЯМР (400 МГц, CDCl_3) 5,31 – 5,17 (m, 1H), 4,12 – 4,08 (m, 2H), 3,87 – 3,82 (m, 2H), 1,55 – 1,51 (d, 3H), 1,35 – 1,31 (t, 3H)

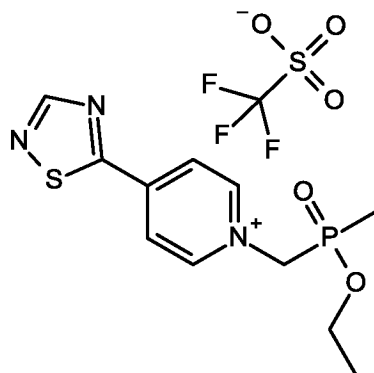
10 Стадия 2. Получение [этокси(метил)фосфорил]метилтрифторметансульфоната



В раствор [этокси(метил)фосфорил]метанола (2 г) в дихлорметане (30 мл) при -78°C в атмосфере азота добавляли 2,6-лутидин (2,68 г) и трифлатный ангидрид (2,8 мл). Обеспечивали нагревание полученной реакционной смеси до комнатной температуры и перемешивали при комнатной температуре в течение 3 часов. Реакционную смесь выливали в воду (50 мл) и экстрагировали дихлорметаном (3×50 мл). Объединенные органические слои промывали 1 М водным раствором хлористоводородной кислоты (50 мл), высушивали над сульфатом натрия и концентрировали с получением [этокси(метил)фосфорил]метилтрифторметансульфоната в виде светло-оранжевого масла.

^1H ЯМР (400 МГц, CDCl_3) 4,71 – 4,55 (m, 2H), 4,24 – 4,10 (m, 2H), 1,68 – 1,64 (d, 3H), 1,40 – 1,37 (t, 3H)

Стадия 3. Получение 5-[1-[[этокси(метил)фосфорил]метил]пиридин-1-ий-4-ил]-1,2,4-тиадиазолтрифторметансульфоната A47



В раствор 5-(4-пиридил)-1,2,4-тиадиазола (1 г) в тетрагидрофуране (20 мл) добавляли
 5 [этокси(метил)фосфорил]метилтрифторметансульфонат (1,67 г) при комнатной
 температуре. Полученную смесь нагревали при 65°C в течение 16 часов. Реакционную
 смесь концентрировали и остаток растворяли в воде (25 мл) и промывали
 дихлорметаном (2×50 мл). Водный слой концентрировали и очищали посредством
 HPLC с обращенной фазой (100% вода) с получением 5-[1-
 10 [[этокси(метил)фосфорил]метил]пиридин-1-ий-4-ил]-1,2,4-
 тиадиазолтрифторметансульфоната в виде коричневого твердого вещества.

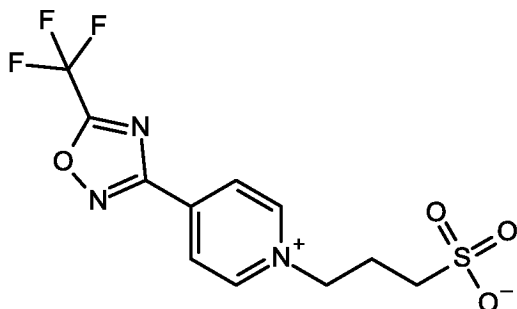
¹H ЯМР (400 МГц, DMSO-d₆) 9,33 (s, 1H), 9,16 (d, 2H), 8,85 (d, 2H), 5,37 (d, 2H), 4,14 -
 4,03 (m, 2H), 1,69 (d, 3H), 1,27 - 1,19 (m, 3H)

15 Стадия 4. Получение метил-[[4-(1,2,4-тиадиазол-5-ил)пиридин-1-ий-1-ил]метил]фосфината A10

К перемешиваемому раствору 5-[1-[[этокси(метил)фосфорил]метил]пиридин-1-ий-4-
 ил]-1,2,4-тиадиазолтрифторметансульфоната (0,3 г) в дихлорметане (15 мл) добавляли
 20 бромтриметилсилан (0,361 г) при комнатной температуре. Реакционную смесь
 перемешивали при комнатной температуре в течение 16 часов. Реакционную смесь
 концентрировали и очищали посредством HPLC с обращенной фазой (100% вода) с
 получением метил-[[4-(1,2,4-тиадиазол-5-ил)пиридин-1-ий-1-ил]метил]фосфината в
 виде светло-зеленой смолы.

25 ¹H ЯМР (400 МГц, CD₃OD) 9,08 (s, 3H), 8,77 (br d, 2H), 5,12 (br s, 2H), 1,71 - 1,46 (m,
 3H)

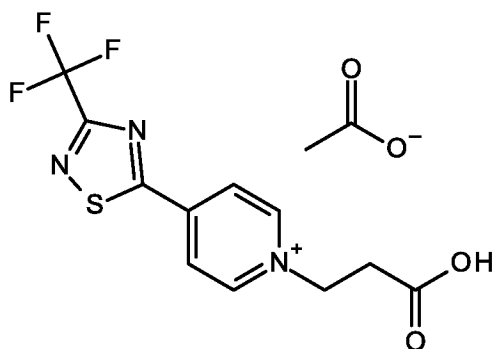
Пример 14. Получение 3-[4-[5-(трифторметил)-1,2,4-оксадиазол-3-ил]пиридин-1-ий-1-ил]пропан-1-сульфоната A15



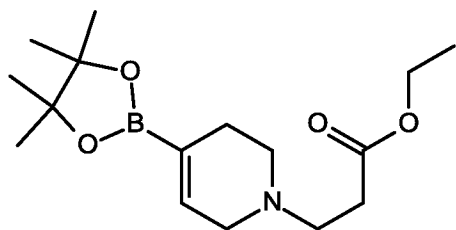
Смесь 1,3-пропансультона (0,082 г) и 3-(4-пиридил)-5-(трифторметил)-1,2,4-оксадиазола (0,095 г) в 1,4-диоксане (2,2 мл) нагревали при 100°C в течение 20 часов. Полученный осадок отфильтровывали и промывали ацетоном с получением 3-[4-[5-(трифторметил)-1,2,4-оксадиазол-3-ил]пиридин-1-ий-1-ил]пропан-1-сульфоната в виде бесцветного твердого вещества.

¹H ЯМР (400 МГц, D₂O) 9,09 (d, 2H), 8,65 (br d, 2H), 4,78 - 4,84 (m, 2H), 2,95 (t, 2H), 2,44 (br t, 2H)

Пример 15. Получение ацетата 3-[4-[3-(трифторметил)-1,2,4-тиадиазол-5-ил]пиридин-1-ий-1-ил]пропановой кислоты A48

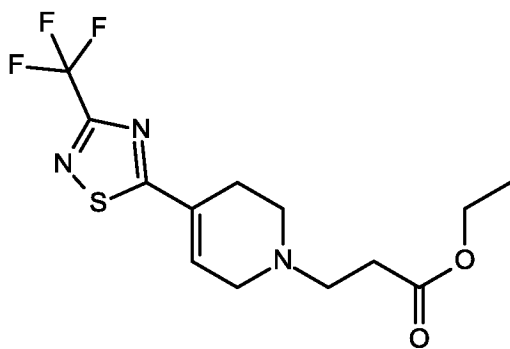


Стадия 1. Получение этил-3-[4-(4,4,5,5-тетраметил-1,3,2-диоксаборолан-2-ил)-3,6-дигидро-2H-пиридин-1-ил]пропаноата



В раствор 4-(4,4,5,5-тетраметил-1,3,2-диоксаборолан-2-ил)-1,2,3,6-тетрагидропиридина гидрохлорида (3 г) в ацетонитриле (60 мл) добавляли карбонат калия (5,065 г) с последующим добавлением этил-3-бромпропаноата (1,644 мл). После нагревания с обратным холодильником в течение 16 часов смесь концентрировали. Полученный осадок перемешивали в *трет*-бутилметилом эфире, затем фильтровали. Фильтрат концентрировали с получением этил-3-[4-(4,4,5,5-тетраметил-1,3,2-диоксаборолан-2-ил)-3,6-дигидро-2Н-пиридин-1-ил]пропаноата, который применяли без дополнительной очистки.

Стадия 2. Получение этил-3-[4-[3-(трифторметил)-1,2,4-тиадиазол-5-ил]-3,6-дигидро-2Н-пиридин-1-ил]пропаноата



Смесь этил-3-[4-(4,4,5,5-тетраметил-1,3,2-диоксаборолан-2-ил)-3,6-дигидро-2Н-пиридин-1-ил]пропаноата (0,81 г), [1,1'-бис(дифенилфосфино)ферроцен]дихлорпалладия(II) (0,175 г), 5-хлор-3-(трифторметил)-1,2,4-тиадиазола (0,45 г), карбоната натрия (1,012 г), 1,4-диоксана (8,35 мл) и воды (8,35 мл) дегазировали азотом, затем нагревали при 120°C в условиях микроволнового излучения в течение 1 часа. Реакционную смесь охлаждали до комнатной температуры, затем фильтровали через диатомовую землю. Фильтрат концентрировали, затем очищали посредством хроматографии на силикагеле с элюированием смесью этилацетата в циклогексане с получением этил-3-[4-[3-(трифторметил)-1,2,4-тиадиазол-5-ил]-3,6-дигидро-2Н-пиридин-1-ил]пропаноата.

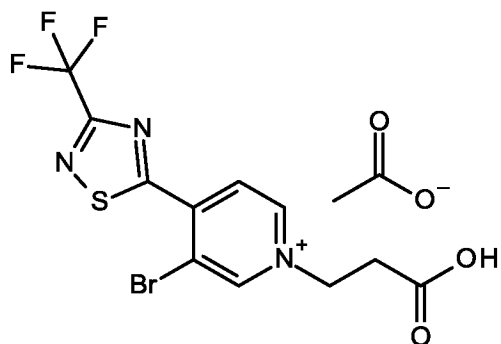
Стадия 3. Получение ацетата 3-[4-[3-(трифторметил)-1,2,4-тиадиазол-5-ил]пиридин-1-ий-1-ил]пропановой кислоты A48

В раствор этил-3-[4-[3-(трифторметил)-1,2,4-тиадиазол-5-ил]-3,6-дигидро-2Н-пиридин-1-ил]пропаноата (0,2 г) в 1,4-диоксане (4,78 мл) добавляли 1-бромпирролидин-2,5-дион

(0,19 г). Реакционную смесь перемешивали при комнатной температуре в течение 1 часа. В нее добавляли циклогексан (20 мл) и смесь перемешивали в течение 10 минут. Растворитель декантировали из остатка, который промывали этилацетатом. Остаток очищали посредством препаративной HPLC с обращенной фазой с получением сложного эфира. Сложный эфир растворяли в 1:1 уксусной кислоте и воде и нагревали при 80°C в течение 18 часов. Реакционную смесь концентрировали и остаток растирали ацетоном с получением ацетата 3-[4-[3-(трифторметил)-1,2,4-тиадиазол-5-ил]пиридин-1-ий-1-ил]пропановой кислоты.

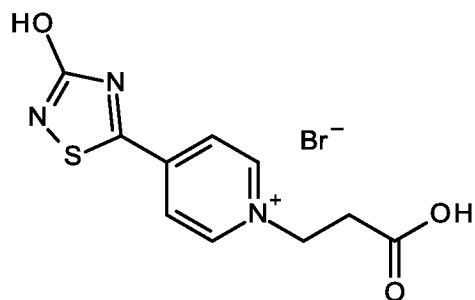
¹H ЯМР (400 МГц, D₂O) 9,20 (d, 2H), 8,67 (d, 2H), 4,98 (t, 2H), 3,19 (t, 2H), 2,02 (s, 3H) (протон CO₂H отсутствует)

Также выделяли из этой реакционной смеси и гидролизовали подобным способом ацетат 3-[3-бром-4-[3-(трифторметил)-1,2,4-тиадиазол-5-ил]пиридин-1-ий-1-ил]пропановой кислоты A79

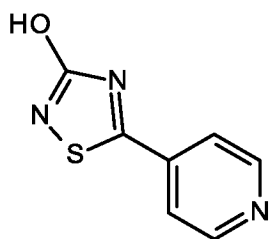


¹H ЯМР (400 МГц, D₂O) 9,68 (s, 1H), 9,21 (dd, 1H), 8,96 (d, 1H), 4,99 (t, 2H), 3,25 (t, 2H), 2,04 (s, 3H) (протон CO₂H отсутствует)

Пример 16. Получение бромиды 3-[4-(3-гидрокси-1,2,4-тиадиазол-5-ил)пиридин-1-ий-1-ил]пропановой кислоты A97



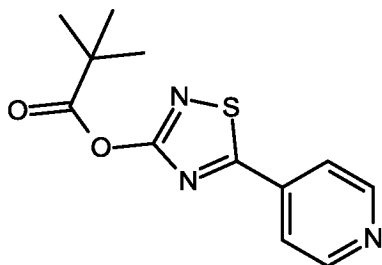
Стадия 1. Получение 5-(4-пиридил)-1,2,4-тиадиазол-3-ола



В раствор 3-бром-5-(4-пиридил)-1,2,4-тиадиазол (0,25 г) в *N,N*-диметилформамиде (1,9 мл) добавляли карбонат цезия (0,673 г) с последующим добавлением (Е)-бензальдегида оксима (0,126 г). Реакционную смесь нагревали при 40°C в течение ночи. Затем ее нагревали при 80°C в течение 30 часов. Реакционную смесь концентрировали и остаток промывали *трет*-бутилметиловым эфиром (x3) и высушивали с получением неочищенного 5-(4-пиридил)-1,2,4-тиадиазол-3-ола, который применяли без дополнительной очистки.

¹H ЯМР (400 МГц, DMSO-*d*₆) 8,63 - 8,67 (m, 2H), 7,64 - 7,67 (m, 2H) (протон OH отсутствует)

Стадия 2. Получение [5-(4-пиридил)-1,2,4-тиадиазол-3-ил]2,2-диметилпропаноата



15 Раствор 5-(4-пиридил)-1,2,4-тиадиазол-3-ола (0,05 г) в дихлорметане (2,5 мл) охлаждали до ~0°C, затем добавляли триэтиламин (0,024 мл) и 2,2-диметилпропаноилхлорид (0,021 мл). Реакционную смесь перемешивали при ~0°C в течение 2 часов. Реакционную смесь разделяли между водой и дихлорметаном. Водный слой экстрагировали дополнительным количеством дихлорметаном (x2).

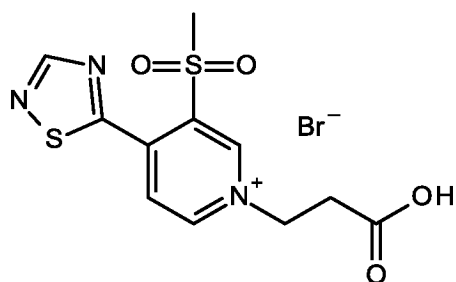
20 Объединенные органические фазы высушивали над сульфатом натрия и концентрировали с получением [5-(4-пиридил)-1,2,4-тиадиазол-3-ил] 2,2-диметилпропаноата, который применяли без дополнительной очистки.

Стадия 3. Получение бромида 3-[4-(3-гидрокси-1,2,4-тиадиазол-5-ил)пиридин-1-ий-1-ил]пропановой кислоты A97

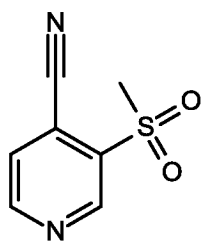
Смесь [5-(4-пиридил)-1,2,4-тиадиазол-3-ил]-2,2-диметилпропаноата (0,5 г), ацетонитрила (10 мл) и 3-бромпропановой кислоты (0,36 г) нагревали при 60°C в течение 12 часов. Реакционную смесь концентрировали и остаток промывали *трет*-бутилметиловым эфиром и высушивали с получением бромида 3-[4-(3-гидрокси-1,2,4-тиадиазол-5-ил)пиридин-1-ий-1-ил]пропановой кислоты.

¹H ЯМР (400 МГц, D₂O) 9,07 (d, 2H), 8,45 (d, 2H), 4,90 (t, 2H), 3,18 (t, 2H) (протоны CO₂H и OH отсутствуют)

Пример 17. Получение бромида 3-[3-метилсульфонил-4-(1,2,4-тиадиазол-5-ил)пиридин-1-ий-1-ил]пропановой кислоты A93



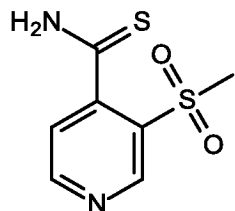
Стадия 1. Получение 3-метилсульфонилпиридин-4-карбонитрила



В раствор 3-хлорпиридин-4-карбонитрила (0,1 г) в *N,N*-диметилформамиде (1 мл) добавляли метансульфинат натрия (0,174 г) и смесь нагревали при 140°C в течение 4 часов. Реакционную смесь охлаждали до комнатной температуры и разделяли между этилацетатом (20 мл) и водой (10 мл). Водный слой экстрагировали дополнительным количеством этилацетата (2x20 мл). Объединенные органические слои высушивали над сульфатом натрия, концентрировали и очищали посредством хроматографии на силикагеле с элюированием 0–50% этилацетата в циклогексане с получением 3-метилсульфонилпиридин-4-карбонитрила в виде желтого твердого вещества.

^1H ЯМР (400 МГц, CDCl_3) 9,30 (br s, 1H), 9,02 (br s, 1H), 7,75 (br s, 1H), 3,25 ppm (br s, 3H)

Стадия 2. Получение 3-метилсульфонилпиридин-4-карботиоамида



5

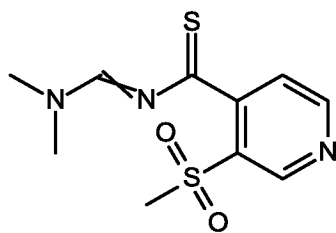
В раствор 3-метилсульфонилпиридин-4-карбонитрила (1,7 г) в пиридине (1,7 мл) добавляли триэтиламин (1,2 мл) и полисульфид аммония (48%, 3,4 мл) и смесь нагревали при 60°C в течение 2 часов. Реакционную смесь охлаждали до комнатной температуры и разделяли между этилацетатом (120 мл) и водой (30 мл). Водный слой экстрагировали дополнительным количеством этилацетата (2x100 мл). Объединенные органические слои сушили над сульфатом натрия и концентрировали. Остаток растирали в порошок *трет*-бутилметилловым эфиром (30 мл) с получением 3-метилсульфонилпиридин-4-карботиоамида в виде светло-желтого твердого вещества.

10

^1H ЯМР (400 МГц, $\text{DMSO}-d_6$) 10,47 (br s, 1H), 10,09 (br s, 1H), 8,99 (s, 1H), 8,85 (d, 1H), 7,39 (d, 1H), 3,47 ppm (s, 3H)

15

Стадия 3. Получение N-(диметиламинометил)-3-метилсульфонил-пиридин-4-карботиоамида

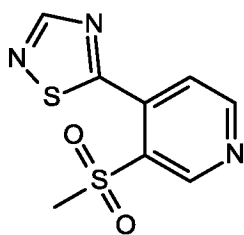


20

Смесь 3-метилсульфонилпиридин-4-карботиоамида (1,45 г) и 1,1-диметокси-N,N-диметил-метанамина (7,25 мл) перемешивали при комнатной температуре в течение 3 часов. Реакционную смесь концентрировали и остаток растирали в порошок *трет*-бутилметилловым эфиром (40 мл) и высушивали с получением N-(диметиламинометил)-3-метилсульфонил-пиридин-4-карботиоамида, который применяли без дополнительной очистки.

25

Стадия 4. Получение 5-(3-метилсульфонил-4-пиридил)-1,2,4-тиадиазола



В смесь N-(диметиламинометил)-3-метилсульфонил-пиридин-4-карботиоамида (1,52 г), пиридина (0,906 мл) и метанола (15,2 мл) при комнатной температуре добавляли
 5 раствор аминогидросульфата (0,697 г) в метаноле (7,6 мл). Реакционную смесь перемешивали при комнатной температуре в течение 1 часа. Реакционную смесь гасили насыщ. водным раствором бикарбоната натрия и экстрагировали этилацетатом (20 мл). Органический слой высушивали над сульфатом натрия, концентрировали и очищали посредством хроматографии на силикагеле с элюированием смесью этилацетата в
 10 циклогексане с получением 5-(3-метилсульфонил-4-пиридил)-1,2,4-тиадиазола.

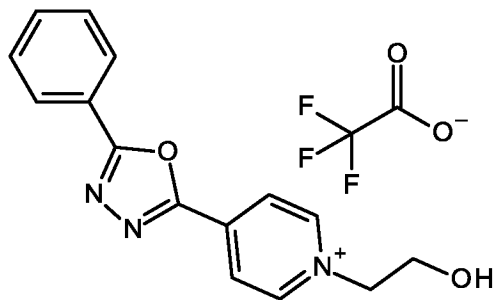
^1H ЯМР (400 МГц, CDCl_3) 9,45 (s, 1H), 9,04 (d, 1H), 8,84 (s, 1H), 7,62 (d, 1H), 3,46 (s, 3H)

Стадия 5. Получение бромида 3-[3-метилсульфонил-4-(1,2,4-тиадиазол-5-ил)пиридин-1-ий-1-ил]пропановой кислоты A93

15 Смесь 5-(3-метилсульфонил-4-пиридил)-1,2,4-тиадиазола (0,2 г) и 3-бромпропановой кислоты (0,14 г) в ацетонитриле (2 мл) нагревали при 80°C в течение 40 часов. Реакционную смесь концентрировали и остаток растирали в порошок *трет*-бутилметилловым эфиром (40 мл) и высушивали с получением бромида 3-[3-метилсульфонил-4-(1,2,4-тиадиазол-5-ил)пиридин-1-ий-1-ил]пропановой кислоты.
 20

^1H ЯМР (400 МГц, D_2O) 9,85 (s, 1H), 9,50 (d, 1H), 9,07 (s, 1H), 8,60 (d, 1H), 5,13 (t, 2H), 3,67 (s, 3H), 3,30 (t, 2H) (протон CO_2H отсутствует)

Пример 18. Получение 2-[4-(5-фенил-1,3,4-оксадиазол-2-ил)пиридин-1-ий-1-ил]этанола
2.2.2-трифторацетата A69



Смесь 2-фенил-5-(4-пиридил)-1,3,4-оксадиазола (0,1 г), 1,2-дихлорэтана (6 мл) и 1,3,2-
 диоксатиолан-2,2-диоксида (0,064 г) нагревали при 85°C в течение ночи. Полученный
 осадок отфильтровывали и фильтрат концентрировали и очищали посредством
 препаративной HPLC с обращенной фазой (трифторуксусная кислота присутствовала в
 элюенте) с получением 2-[4-(5-фенил-1,3,4-оксадиазол-2-ил)пиридин-1-ий-1-ил]этанола
 2.2.2-трифторацетата.

¹H ЯМР (400 МГц, DMSO-d₆) 9,16 - 9,33 (m, 2H), 8,75 - 8,88 (m, 2H), 8,17 - 8,32 (m, 2H),
 7,55 - 7,80 (m, 3H), 4,68 - 4,83 (m, 2H), 3,82 - 4,00 (m, 2H) (протон OH отсутствует)

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
 противоион не считается ограничивающим, и соединение формулы (I) может быть
 образовано с любым подходящим противоионом.

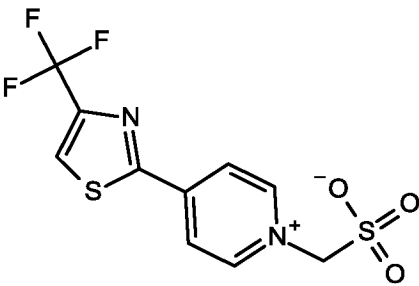
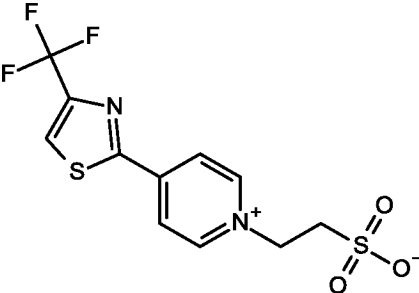
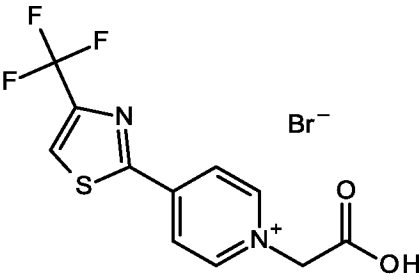
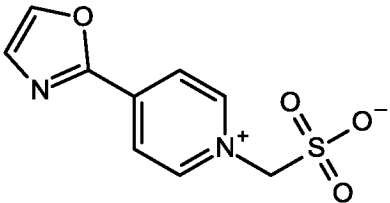
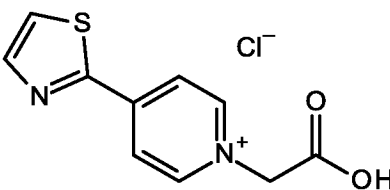
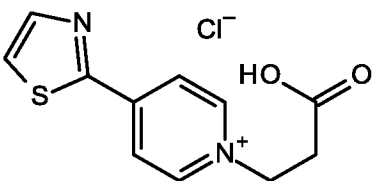
ЯМР-спектры, приведенные в данном документе, регистрировали либо на Bruker
 AVANCE III HD, работающем при 400 МГц, оснащенном зондом Bruker SMART, если
 не указано иное. Химические сдвиги выражали в ppm для слабопольного сдвига от
 TMS, либо с TMS, либо с сигналами остаточного растворителя в качестве 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 br. применяют для описания широкого
 сигнала и app. применяют для описания кажущейся мультиплетности.

Таблица А. Физические данные для соединений по настоящему изобретению

Номер соединения	Структура	¹ H ЯМР
A1		(400 МГц, D ₂ O) 9,06 (d, 2H), 8,69 (d, 2H), 5,41 (s, 2H) (протон CO ₂ H отсутствует)
A2		(400 МГц, D ₂ O) 9,02-9,20 (m, 2H) 8,55-8,68 (m, 2H) 5,58-5,81 (m, 2H) 2,65-2,82 (m, 3H)
A3		(400 МГц, D ₂ O) 9,41-9,49 (m, 1H) 8,95-9,04 (m, 2H) 8,37-8,49 (m, 2H) 5,68 (br s, 2H)
A4		(400 МГц, D ₂ O) 9,25-9,02 (m, 3H), 8,81-8,66 (m, 2H), 5,85-5,74 (m, 2H)
A5		(400 МГц, D ₂ O) 9,02-9,11 (m, 2H) 8,87-8,99 (m, 1H) 8,47-8,60 (m, 2H) 4,94-5,05 (m, 2H) 3,48-3,61 (m, 2H)
A6		(400 МГц, D ₂ O) 8,96-8,88 (m, 3H), 8,58-8,54 (m, 2H), 5,40 (s, 2H)

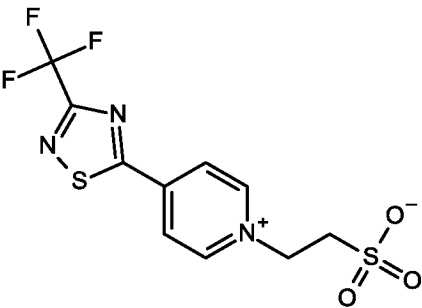
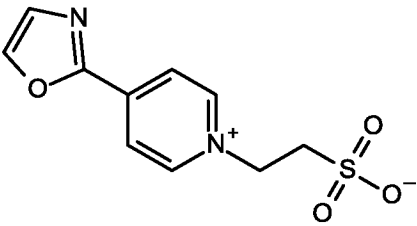
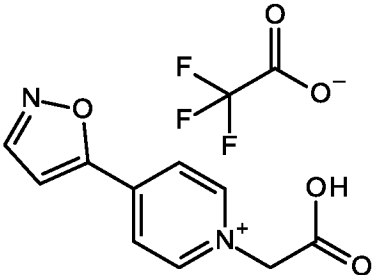
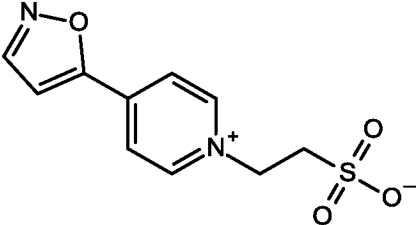
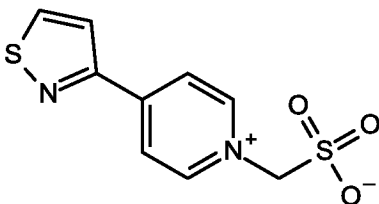
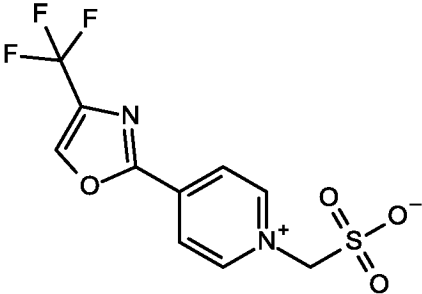
Номер соединения	Структура	^1H ЯМР
A7		(400 МГц, D ₂ O) 9,05 (d, 2H), 8,92 (s, 1H), 8,51 (d, 2H), 4,87 (t, 2H), 3,15 (t, 2H) (протон CO ₂ H отсутствует)
A8		(400 МГц, D ₂ O) 9,39-9,45 (m, 1H) 8,85-8,93 (m, 2H) 8,35-8,44 (m, 2H) 5,55 (s, 2H) 3,73-3,84 (m, 3H)
A9		(400 МГц, D ₂ O) 9,38-9,43 (m, 1H) 8,83-8,90 (m, 2H) 8,33-8,40 (m, 2H) 5,40 (s, 2H) (протон CO ₂ H отсутствует)
A10		(400 МГц, CD ₃ OD) 9,08 (s, 3H), 8,77 (br d, 2H), 5,12 (br s, 2H), 1,71 - 1,46 (m, 3H)
A11		(400 МГц, D ₂ O) 9,13 (d, 2H), 8,98 (s, 1H), 8,62 (d, 2H), 5,86 (d, 1H), 2,02 (d, 3H)
A12		(400 МГц, D ₂ O) 9,41 (s, 1H), 9,01 (d, 2H), 8,66 (d, 2H), 4,72 - 4,79 (m, 2H), 2,99-3,02 (m, 2H), 2,47-2,53 (m, 2H)
A13		(400 МГц, D ₂ O) 9,06 - 9,00 (m, 2H), 8,91 (s, 1H), 8,68 (d, 2H), 5,48 (s, 2H) (протон CO ₂ H отсутствует)

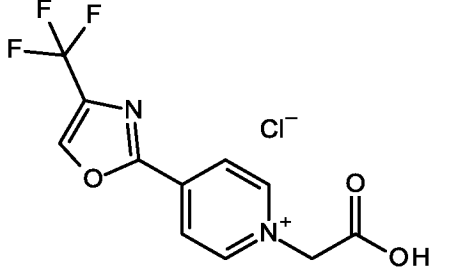
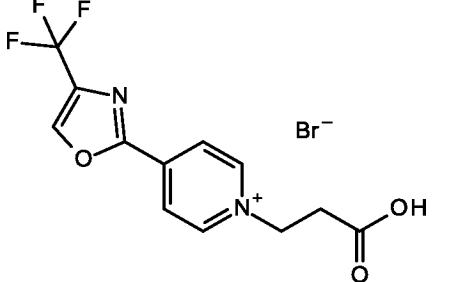
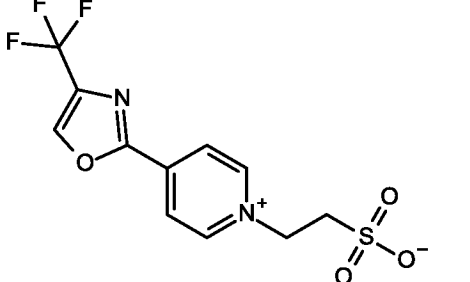
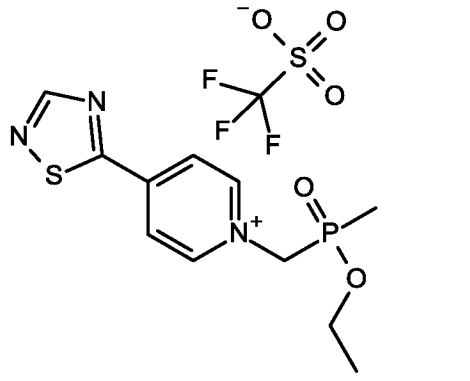
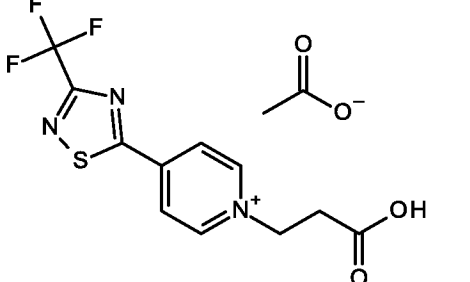
Номер соединения	Структура	¹ H ЯМР
A14		(400 МГц, D ₂ O) 9,08 - 9,19 (m, 2H), 8,86 - 8,96 (m, 1H), 8,64 (d, 2H), 4,85 - 4,96 (m, 2H), 3,15 (t, 2H) (протон CO ₂ H отсутствует)
A15		(400 МГц, D ₂ O) 9,09 (d, 2H), 8,65 (br d, 2H), 4,78 - 4,84 (m, 2H), 2,95 (t, 2H), 2,44 (br t, 2H)
A16		(400 МГц, D ₂ O) 9,17 (s, 1H), 9,03 (d, 2H), 8,66 (d, 2H), 5,62 (s, 2H), 3,79 (s, 3H)
A17		(400 МГц, D ₂ O) 9,15 (d, 1H), 9,09 (d, 2H), 8,61 (br d, 2H), 4,80 (t, 2H), 2,90 - 2,98 (m, 2H), 2,39 - 2,49 (m, 2H)
A18		(400 МГц, D ₂ O) 8,89 (br d, 2H), 8,30 (br d, 2H), 2,91 (t, 2H), 2,45 - 2,34 (m, 2H) (один CH ₂ в условиях водного пика, протон оксадиазол изменен)
A19		(400 МГц, D ₂ O) 9,35 - 9,41 (m, 1H), 8,89 - 8,97 (m, 2H), 8,32 (d, 2H), 4,89 - 5,01 (m, 2H), 3,52 (s, 1H), 3,55 (d, 1H)

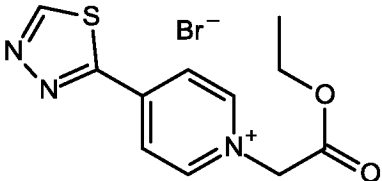
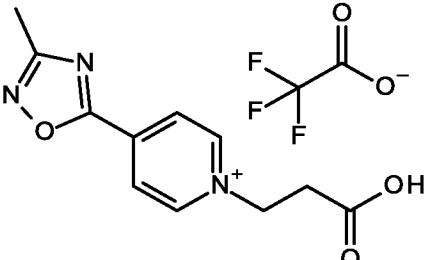
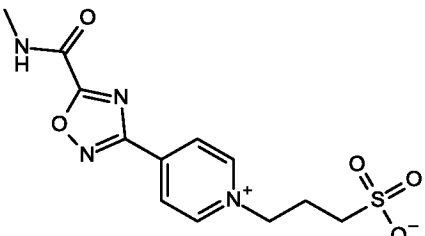
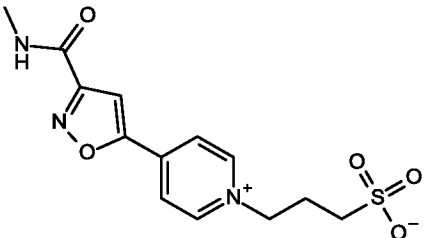
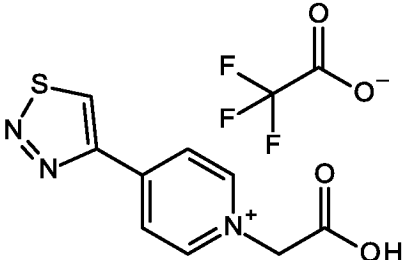
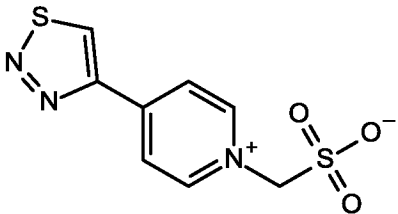
Номер соединения	Структура	^1H ЯМР
A20		(400 МГц, D ₂ O) 9,08 (d, 2H), 8,66 (d, 2H), 8,63 (s, 1H), 5,75 (s, 2H)
A21		(400 МГц, D ₂ O) 9,06 (d, 2H), 8,54 - 8,62 (m, 3H), 5,07 (t, 2H), 3,65 (t, 2H)
A22		(400 МГц, D ₂ O) 8,95 (d, 2H), 8,62 (t, 3H), 5,40 (s, 2H) (протон CO ₂ H отсутствует)
A23		(400 МГц, D ₂ O) 8,98 (d, 2H), 8,54 (d, 2H), 8,18 (d, 1H), 7,54 (d, 1H), 5,65 (s, 2H)
A24		(400 МГц, D ₂ O) 8,83 (d, 2H), 8,51 (d, 2H), 8,17 (d, 1H), 8,04 (d, 1H), 5,33 (s, 2H) (протон CO ₂ H отсутствует)
A25		(400 МГц, D ₂ O) 8,95 (d, 2H), 8,46 (d, 2H), 8,14 (d, 1H), 8,01 (d, 1H), 4,86 (t, 2H), 3,18 (t, 2H) (протон CO ₂ H отсутствует)

Номер соединения	Структура	^1H ЯМР
A26		(400 МГц, D ₂ O) 9,04 - 9,21 (m, 2H), 8,43 - 8,55 (m, 2H), 5,00 - 5,13 (m, 2H), 4,23 - 4,35 (m, 3H), 3,49 - 3,68 (m, 2H)
A27		(400 МГц, D ₂ O) 8,97 - 9,10 (m, 2H), 8,54 - 8,66 (m, 2H), 4,95 - 5,06 (m, 2H), 4,41 - 4,53 (m, 3H), 3,50 - 3,63 (m, 2H)
A28		(400 МГц, D ₂ O) 9,03 - 8,90 (m, 3H), 8,52 (d, 2H), 5,39 - 5,32 (m, 1H), 1,84 (d, 3H) (протон CO ₂ H отсутствует)
A29		(400 МГц, D ₂ O) 8,96 (s, 1H), 8,92 (d, 2H), 8,59 (d, 2H), 5,52 (s, 2H), 3,17 (s, 3H)
A30		(400 МГц, D ₂ O) 8,96 - 8,88 (m, 3H), 8,54 (d, 2H), 4,90 - 4,83 (m, 2H), 3,54 (d, 3H)
A31		(400 МГц, D ₂ O) 8,95 - 8,87 (m, 3H), 8,56 - 8,51 (m, 2H), 4,86 - 4,79 (m, 2H), 3,90 - 3,82 (m, 2H), 1,12 (t, 3H)

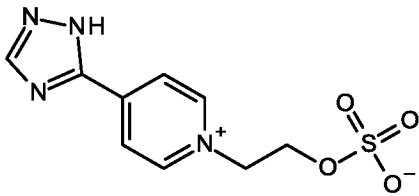
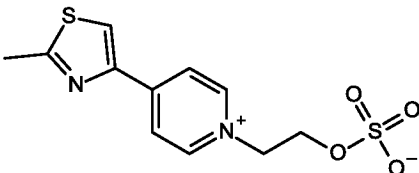
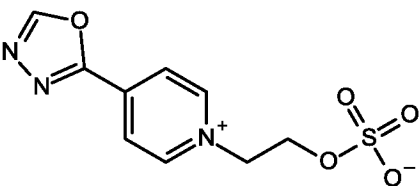
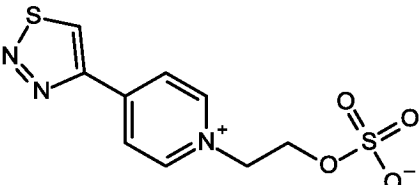
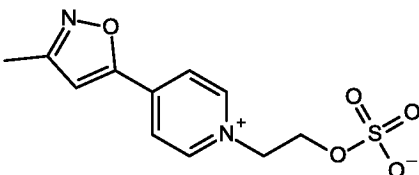
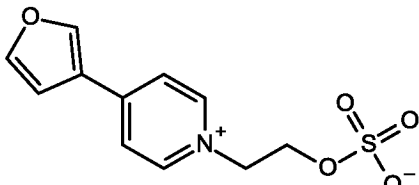
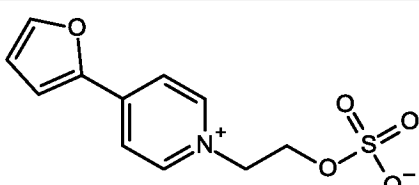
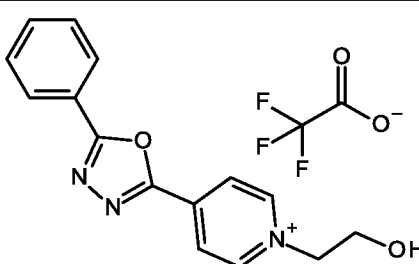
Номер соединения	Структура	^1H ЯМР
A32		(400 МГц, D ₂ O) 9,01 - 8,86 (m, 3H), 8,54 (d, 2H), 4,84 - 4,78 (m, 2H) (протон POH отсутствует)
A33		(400 МГц, D ₂ O) 9,03 (d, 2H), 8,50 (d, 2H), 5,44 (s, 2H), 4,28 (s, 3H) (протон CO ₂ H отсутствует)
A34		(400 МГц, D ₂ O) 8,91 - 8,85 (m, 2H), 8,63 - 8,59 (m, 2H), 5,35 (s, 2H), 4,44 (s, 3H) (протон CO ₂ H отсутствует)
A35		(400 МГц, D ₂ O) 9,13 - 9,05 (m, 2H), 8,78 - 8,67 (m, 2H), 5,77 - 5,70 (m, 2H), 4,56 - 4,48 (m, 3H)
A36		(400 МГц, D ₂ O) 9,05 (d, 2H), 8,52 (d, 2H), 4,78 (t, 2H), 2,94 (t, 2H), 2,63 (s, 3H), 2,43 (t, 2H)
A37		(400 МГц, D ₂ O) 9,02 (d, 2H), 8,67 (s, 1H), 8,43 (d, 2H), 7,39 (d, 1H), 4,90 (t, 2H), 3,20 (t, 2H) (протон CO ₂ H отсутствует)

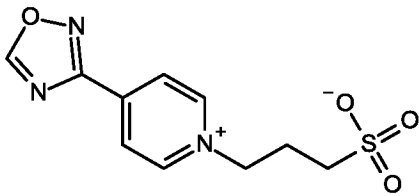
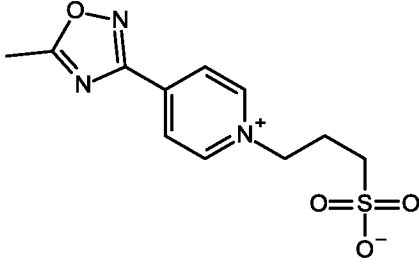
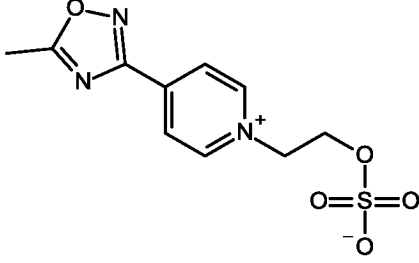
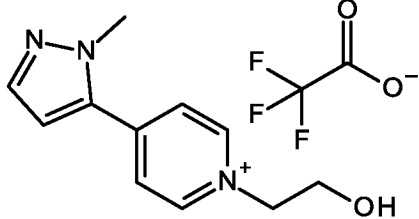
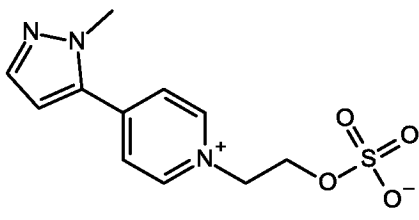
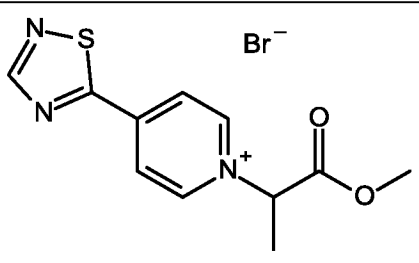
Номер соединения	Структура	¹ H ЯМР
A38		(400 МГц, D ₂ O) 9,14 (d, 2H), 8,63 (d, 2H), 5,06 (t, 2H), 3,60 (t, 2H)
A39		(400 МГц, D ₂ O) 8,97 (d, 2H), 8,47 (d, 2H), 8,14 (d, 1H), 7,50 (d, 1H), 3,55 (t, 2H) 4,97 (t, 2H)
A40		(400 МГц, D ₂ O) 8,89 (d, 2H), 8,67 (d, 1H), 8,46 (d, 2H), 7,42 (d, 1H), 5,37 (s, 2H) (протон CO ₂ H отсутствует)
A41		(400 МГц, D ₂ O) 9,03 (d, 2H), 8,67 (d, 1H), 8,45 (d, 2H), 7,41 (d, 1H), 5,01 - 5,07 (m, 2H), 3,60 - 3,64 (m, 2H)
A42		(400 МГц, DMSO-d ₆) 9,39 (d, 1H), 9,08 (d, 2H), 8,72 (d, 2H), 8,37 (d, 1H), 5,45 (s, 2H)
A43		(400 МГц, D ₂ O) 9,13 (d, 2H), 8,75 (d, 1H), 8,66 (d, 2H), 5,75 (s, 2H)

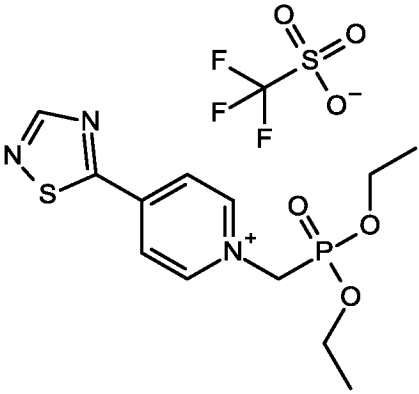
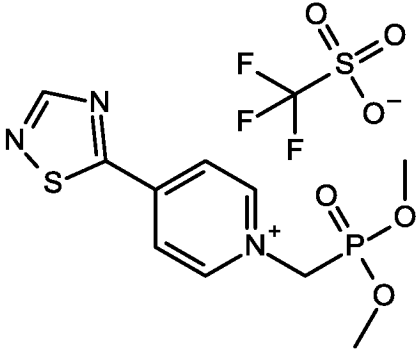
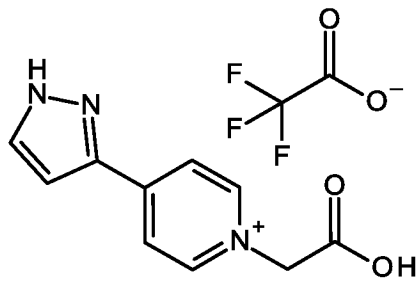
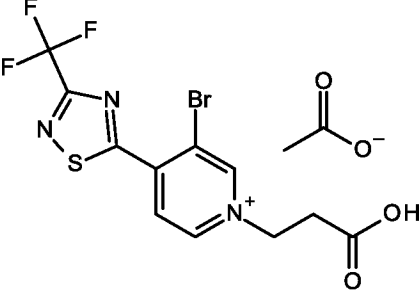
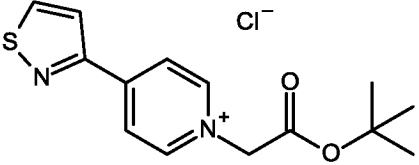
Номер соединения	Структура	¹ H ЯМР
A44		(400 МГц, D ₂ O) 8,97 (d, 2H), 8,70 - 8,76 (m, 1H), 8,60 (d, 2H), 5,38 (s, 2H) (протон CO ₂ H отсутствует)
A45		(400 МГц, D ₂ O) 9,11 (d, 2H), 8,65 - 8,79 (m, 1H), 8,56 (d, 2H), 4,93 (t, 2H), 3,20 (t, 2H) (протон CO ₂ H отсутствует)
A46		(400 МГц, D ₂ O) 9,09 (d, 2H), 8,71 (d, 1H), 8,57 (d, 2H), 5,11 - 5,02 (m, 2H), 3,56 - 3,66 (m, 2H)
A47		(400 МГц, DMSO-d ₆) 9,33 (s, 1H), 9,16 (d, 2H), 8,85 (d, 2H), 5,37 (d, 2H), 4,14 - 4,03 (m, 2H), 1,69 (d, 3H), 1,27 - 1,19 (m, 3H)
A48		(400 МГц, D ₂ O) 9,20 (d, 2H), 8,67 (d, 2H), 4,98 (t, 2H), 3,19 (t, 2H), 2,02 (s, 3H) (протон CO ₂ H отсутствует)

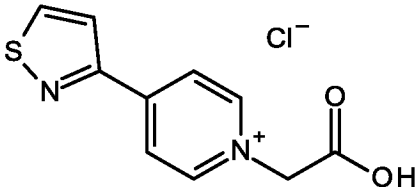
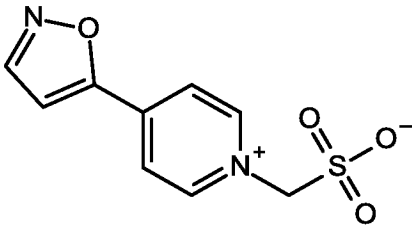
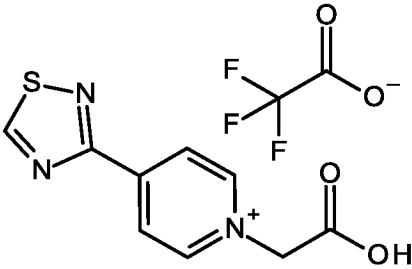
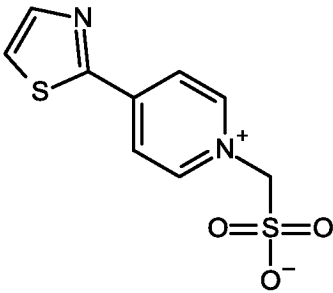
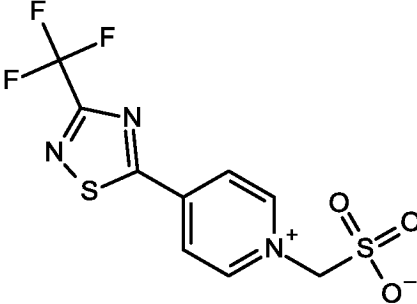
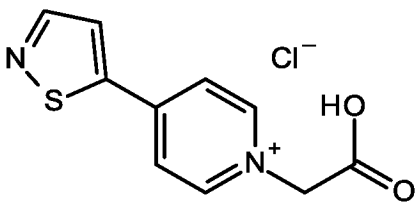
Номер соединения	Структура	^1H ЯМР
A49		(400 МГц, DMSO- d_6) 9,71 (s, 1H), 9,25 (d, 2H), 8,81 (d, 2H), 5,75 (s, 2H), 4,27 (q, 2H), 1,27 (t, 3H)
A50		(400 МГц, D $_2$ O) 9,14 (d, 2H), 8,58 (d, 2H), 4,91 (t, 2H), 3,16 (t, 2H), 2,45 (s, 3H) (протон CO $_2$ H отсутствует)
A51		(400 МГц, D $_2$ O) 9,06 (d, 2H), 8,64 (d, 2H), 4,80 (t, 2H), 2,97 - 2,90 (m, 5H), 2,49 - 2,39 (m, 2H) (протон NH отсутствует)
A52		(400 МГц, D $_2$ O) 8,88 - 9,03 (m, 2H), 8,36 - 8,48 (m, 2H), 7,53 - 7,66 (m, 1H), 4,64 - 4,82 (m, 2H), 2,93 (t, 2H), 2,87 (s, 3H), 2,42 (quin, 2H) (протон NH отсутствует)
A53		(400 МГц, D $_2$ O) 9,80 (s, 1H), 8,84 (d, 2H), 8,62 (d, 2H), 5,39 (s, 2H) (протон CO $_2$ H отсутствует)
A54		(400 МГц, DMSO- d_6) 10,32 (s, 1H), 9,09 - 9,20 (m, 2H), 8,88 (d, 2H), 5,43 - 5,52 (m, 2H)

Номер соединения	Структура	^1H ЯМР
A55		(400 МГц, D ₂ O) 9,34 - 9,45 (m, 1H), 8,94 - 9,10 (m, 2H), 8,74 - 8,83 (m, 1H), 4,88 - 5,03 (m, 2H), 3,11 - 3,25 (m, 2H) (протон CO ₂ H отсутствует)
A56		(400 МГц, D ₂ O) 9,40 - 9,52 (m, 1H), 8,98 - 9,11 (m, 2H), 8,82 - 8,92 (m, 1H), 4,87 - 4,96 (m, 2H), 3,08 - 3,26 (m, 2H) (протон CO ₂ H отсутствует)
A57		(400 МГц, DMSO-d ₆) 9,34 - 9,15 (m, 2H), 8,78 - 8,60 (m, 2H), 5,59 (br s, 2H), 4,37 (br s, 3H)
A58		(400 МГц, D ₂ O) 9,07 (d, 2H), 8,94 (s, 1H), 8,54 (d, 2H), 4,90 (t, 2H), 3,60 (s, 3H), 3,18 (t, 2H)
A59		(400 МГц, D ₂ O) 8,93-8,89 (m, 2H), 8,51-8,46 (m, 2H), 5,37 (s, 2H), 2,67 (s, 3H) (протон CO ₂ H отсутствует)
A60		(400 МГц, DMSO-d ₆) 9,18 - 9,10 (m, 2H), 8,69 (d, 2H), 8,21 (s, 1H), 8,01 (d, 2H), 7,61 - 7,47 (m, 3H), 4,91 - 4,82 (m, 2H), 4,34 - 4,21 (m, 2H)
A61		(400 МГц, DMSO-d ₆) 10,02 (s, 1H), 9,28 - 9,19 (m, 2H), 8,72 (br d, 2H), 4,99 - 4,88 (m, 2H), 4,28 (br s, 2H)

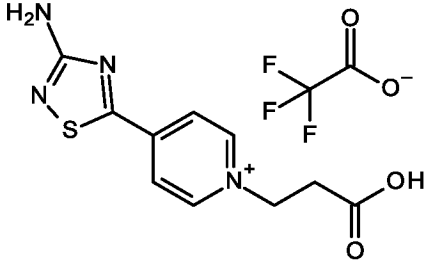
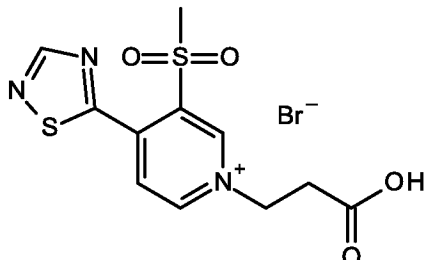
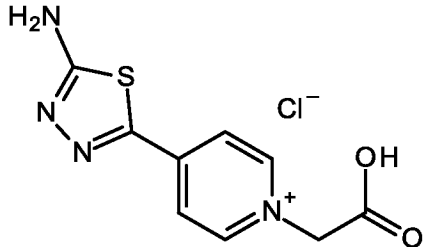
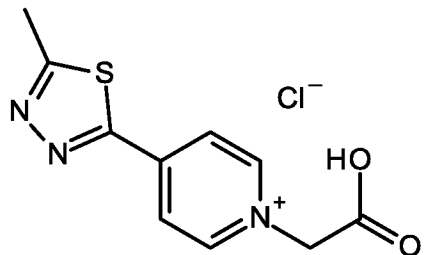
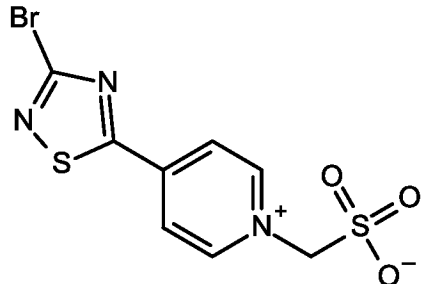
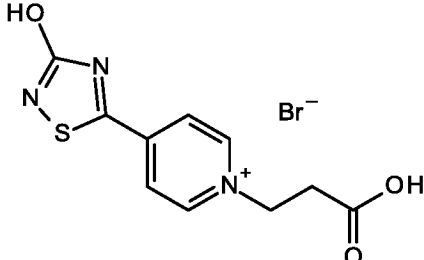
Номер соединения	Структура	^1H ЯМР
A62		(400 МГц, DMSO- d_6) 14,94 (br s, 1H), 9,07 (d, 2H), 8,93 (s, 1H), 8,60 (d, 2H), 4,90 - 4,77 (m, 2H), 4,30 - 4,19 (m, 2H)
A63		(400 МГц, DMSO- d_6) 8,94 - 9,08 (m, 2H), 8,79 - 8,90 (m, 1H), 8,47 - 8,61 (m, 2H), 4,69 - 4,85 (m, 2H), 4,14 - 4,31 (m, 2H), 2,69 - 2,84 (m, 3H)
A64		(400 МГц, DMSO- d_6) 9,60 - 9,79 (m, 1H), 9,17 - 9,31 (m, 2H), 8,64 - 8,81 (m, 2H), 4,83 - 5,02 (m, 2H), 4,19 - 4,36 (m, 2H)
A65		(400 МГц, DMSO- d_6) 10,23 - 10,36 (m, 1H), 9,09 - 9,24 (m, 2H), 8,73 - 8,96 (m, 2H), 4,73 - 4,94 (m, 2H), 4,18 - 4,34 (m, 2H)
A66		(400 МГц, DMSO- d_6) 9,16 (d, 2H), 8,56 (d, 2H), 7,61 - 7,57 (m, 1H), 4,89 - 4,78 (m, 2H), 4,32 - 4,19 (m, 2H), 2,39 (s, 3H)
A67		(400 МГц, DMSO- d_6) 8,95 (d, 2H), 8,76 - 8,91 (m, 1H), 8,36 (d, 2H), 7,98 (s, 1H), 7,22 - 7,41 (m, 1H), 4,61 - 4,84 (m, 2H), 4,12 - 4,34 (m, 2H)
A68		(400 МГц, DMSO- d_6) 8,83 - 9,01 (m, 2H), 8,24 - 8,36 (m, 2H), 8,13 - 8,23 (m, 1H), 7,75 - 7,90 (m, 1H), 6,89 (dd, 1H), 4,62 - 4,87 (m, 2H), 4,08 - 4,30 (m, 2H)
A69		(400 МГц, DMSO- d_6) 9,16 - 9,33 (m, 2H), 8,75 - 8,88 (m, 2H), 8,17 - 8,32 (m, 2H), 7,55 - 7,80 (m, 3H), 4,68 - 4,83 (m, 2H), 3,82 - 4,00 (m, 2H) (протон OH отсутствует)

Номер соединения	Структура	^1H ЯМР
A70		(400 МГц, D ₂ O) 9,45 (s, 1H), 9,08 (d, 2H) 8,65 (d, 2H), 4,80 - 4,83 (m, 2H), 2,98 (t, 2H), 2,48 - 2,53 (m, 2H)
A71		(400 МГц, D ₂ O) 9,09 (d, 2H) 8,60 (d, 2H), 4,83 - 4,87 (m, 2H), 3,01 (t, 2H), 2,74 (s, 3H), 2,49 - 2,53 (m, 2H)
A72		(400 МГц, D ₂ O) 9,07 (d, 2H) 8,61 (d, 2H), 4,98 - 5,02 (m, 2H), 4,53-4,56 (m, 2H), 2,74 (s, 3H)
A73		(400 МГц, DMSO-d ₆) 9,02 - 9,13 (m, 2H), 8,32 - 8,45 (m, 2H), 7,60 - 7,73 (m, 1H), 6,89 - 7,14 (m, 1H), 4,63 - 4,75 (m, 2H), 4,04 - 4,17 (m, 2H), 3,82 - 3,97 (m, 3H) (протон OH отсутствует)
A74		(400 МГц, DMSO-d ₆) 8,99 - 9,16 (m, 2H), 8,30 - 8,45 (m, 2H), 7,61 - 7,70 (m, 1H), 7,02 - 7,13 (m, 1H), 4,78 - 4,91 (m, 2H), 4,22 - 4,33 (m, 2H), 4,05 - 4,16 (m, 3H)
A75		(400 МГц, D ₂ O) 9,12 (d, 2H), 9,02 (s, 1H), 8,65 (d, 2H), 5,83 (q, 1H), 3,80 (s, 3H), 1,99 (d, 3H)

Номер соединения	Структура	^1H ЯМР
A76		(400 МГц, DMSO- d_6) 9,33 (s, 1H), 9,18 (br d, 2H), 8,87 (d, 2H), 5,54 - 5,46 (m, 2H), 4,21 - 4,10 (m, 4H), 1,28 - 1,19 (m, 6H)
A77		(400 МГц, DMSO- d_6) 9,33 (s, 1H), 9,22 - 9,17 (m, 2H), 8,88 - 8,83 (m, 2H), 5,54 (d, 2H), 3,83 - 3,76 (m, 6H)
A78		(400 МГц, D $_2$ O) 8,64 (d, 2H), 8,19 (d, 2H), 7,79 (d, 1H), 6,98 (d, 1H), 5,34 (s, 2H) (протоны CO $_2$ H и NH отсутствуют)
A79		(400 МГц, D $_2$ O) 9,68 (s, 1H), 9,21 (dd, 1H), 8,96 (d, 1H), 4,99 (t, 2H), 3,25 (t, 2H), 2,04 (s, 3H) (протон CO $_2$ H отсутствует)
A80		(400 МГц, D $_2$ O) 9,15 (d, 1H), 8,87 (d, 2H), 8,60 (d, 2H), 8,12 (d, 1H), 5,46 (s, 2H), 1,48 (s, 9H)

Номер соединения	Структура	^1H ЯМР
A81		(400 МГц, D ₂ O) 9,10 (d, 1H), 8,82 (d, 2H), 8,53 (d, 2H), 8,07 (d, 1H), 5,37 (s, 2H) (протон CO ₂ H отсутствует)
A82		(400 МГц, D ₂ O) 9,02 (d, 2H), 8,66 (d, 1H), 8,50 (d, 2H), 7,43 (d, 1H), 5,69 (s, 2H)
A83		(400 МГц, D ₂ O) 10,33 (s, 1H), 8,93 (d, 2H), 8,81 (d, 2H), 5,36 (s, 2H) (протон CO ₂ H отсутствует)
A84		(400 МГц, D ₂ O) 9,02 (d, 2H), 8,62 (d, 2H), 8,25 (d, 1H), 8,13 (d, 1H), 5,73 (s, 2H)
A85		(400 МГц, D ₂ O) 9,25 (d, 2H), 8,81 (d, 2H), 5,84 (s, 2H)
A86		(400 МГц, D ₂ O) 8,87 (d, 2H), 8,68 (d, 1H), 8,36 (d, 2H), 8,05 (d, 1H), 5,44 (s, 2H) (протон CO ₂ H отсутствует)

Номер соединения	Структура	^1H ЯМР
A87		(400 МГц, D ₂ O) 8,99 (d, 2H), 8,71 (d, 1H), 8,42 (d, 2H), 8,10 (d, 1H), 5,71 (s, 2H)
A88		(400 МГц, D ₂ O) 9,08 (d, 2H), 8,86 (s, 1H), 8,59 (d, 2H), 4,93 (t, 2H), 3,22 (t, 2H) (протон CO ₂ H отсутствует)
A89		(400 МГц, D ₂ O) 9,17 (d, 2H), 8,63 (d, 2H), 4,95 (t, 2H), 3,21 (t, 2H) (протон CO ₂ H отсутствует)
A90		(400 МГц, D ₂ O) 9,05 (d, 2H), 8,52 (d, 2H), 5,70 (s, 2H) (протоны NH отсутствуют)
A91		(400 МГц, D ₂ O) 9,20 (d, 2H), 8,69 (d, 2H), 5,12 (t, 2H), 3,66 (t, 2H)

Номер соединения	Структура	¹ H ЯМР
A92		(400 МГц, D ₂ O) 9,04 (d, 2H), 8,44 (d, 2H), 4,89 (t, 2H), 3,16 (t, 2H) (протоны CO ₂ H и NH отсутствуют)
A93		(400 МГц, D ₂ O) 9,85 (s, 1H), 9,50 (d, 1H), 9,07 (s, 1H), 8,60 (d, 1H), 5,13 (t, 2H), 3,67 (s, 3H), 3,30 (t, 2H) (протон CO ₂ H отсутствует)
A94		(400 МГц, D ₂ O) 8,88 (d, 2H), 8,36 (d, 2H), 5,49 (s, 2H) (протоны CO ₂ H и NH отсутствуют)
A95		(400 МГц, D ₂ O) 8,92 (d, 2H), 8,53 (d, 2H), 5,38 (s, 2H), 2,87 (s, 3H) (протон CO ₂ H отсутствует)
A96		(400 МГц, D ₂ O) 9,16 (d, 2H), 8,66 (d, 2H), 5,77 (s, 2H)
A97		(400 МГц, D ₂ O) 9,07 (d, 2H), 8,45 (d, 2H), 4,90 (t, 2H), 3,18 (t, 2H) (протоны CO ₂ H и OH отсутствуют)

Номер соединения	Структура	^1H ЯМР
A98		(400 МГц, D ₂ O) 8,90 (d, 2H), 8,46 (d, 2H), 5,33 (s, 2H) (протоны CO ₂ H и OH отсутствуют)
A99		(400 МГц, D ₂ O) 9,08 (d, 2H) 8,56 (d, 2H) 5,72 (s, 2H) (протон OH отсутствует)
A100		(400 МГц, D ₂ O) 9,02 (d, 2H), 8,62 (d, 2H), 8,25 (d, 1H), 8,13 (d, 1H), 5,73 (s, 2H)
A101		(400 МГц, D ₂ O) 9,84 (s, 1H), 8,87 (d, 2H), 8,67 (d, 2H), 5,55 (s, 2H), 3,79 (s, 3H)

БИОЛОГИЧЕСКИЕ ПРИМЕРЫ

Послевсходовая эффективность

5 Способ А

10 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.

5 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).

Способ В

10

Семена сортов следующих тестируемых видов высевали в стандартную глиняную почву в горшках. Растения выращивали в период от 21 до 28 дней (послевсходовый период) в контролируемых условиях в теплице (при 24/16°C, день/ночь; 14 часов света, влажность 65%) для видов, предпочитающих теплый климат, и (при 20/16°C, день/ночь; 15 часов света; влажность 65%) для видов, предпочитающих холодный климат.

15

Растения опрыскивали водным раствором для опрыскивания, полученным путем 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 простого эфира Dowanol DPM), с получением 50 г/л раствора, который затем разбавляли до необходимой концентрации с применением 0,5% или 1% Empicol ESC70 (лаурилэфирсульфат натрия) + 1% сульфата аммония в качестве разбавителя.

20

25 Доставка водного раствора для опрыскивания осуществлялась с помощью лабораторной машины для опрыскивания, которая доставляла водную композицию для опрыскивания при норме 200 литров на гектар с применением плоскоструйной форсунки (Teejet 11002VS) и применяемом объеме 200 литров/га (при 2 бар).

25

30 Затем испытуемые растения выращивали в теплице в контролируемых условиях (при 24/16°C, день/ночь; 14 часов света; влажность 65%) для видов, предпочитающих теплый климат, и (при 20/16°C день/ночь; 15 часов света; влажность 65%) для видов, предпочитающих холодный климат, и поливают дважды в день. Через 7 и 14 дней

30

проводили оценку результатов тестирования (100 = повреждение всего растения; 0 = отсутствие повреждения у растения).

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

Испытуемые растения для способа А:

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).

Испытуемые растения для способа В:

Brassica napus (BRSNN), *Solanum tuberosum* (SOLTU), *Glycine Max* (GLXMA) и *Helianthus annuus* (HELAN)

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

Номер соединения	Норма применения, г/га	AMAPA	CHEAL	EPHHL	IPOHE	ELEIN	LOLPE	DIGSA	SETFA	ECHCG
A1	500	100	90	Н. д.	40	90	70	70	90	60
A2	500	100	90	Н. д.	70	80	60	90	70	60
A3	500	100	90	80	80	50	20	70	80	40
A4	500	100	100	100	100	80	80	70	80	70
A5	500	100	90	100	70	80	70	70	60	40
A6	500	100	100	100	80	90	30	70	80	90
A7	500	100	90	80	30	70	30	90	70	50
A8	500	Н. д.	70	60	10	30	0	50	30	20
A9	500	30	0	10	20	Н. д.	0	Н. д.	0	Н. д.
A10	500	90	90	Н. д.	50	90	40	90	100	90
A11	500	100	90	Н. д.	80	90	60	80	60	100
A12	1000	0	0	20	0	20	10	20	0	0
A13	500	100	50	70	30	50	10	60	70	50
A14	500	100	70	30	20	40	10	50	60	50
A15	500	0	0	Н. д.	20	10	0	30	30	30
A16	500	0	0	20	20	10	0	40	30	20
A17	500	70	70	50	20	10	0	40	40	30
A18	500	100	50	50	20	30	10	30	40	50
A19	500	100	50	50	50	30	30	30	40	40

A21	500	70	0	Н. д.	10	80	20	70	70	90
A22	500	10	10	40	0	Н. д.	0	Н. д.	0	Н. д.
A23	500	0	20	Н. д.	10	0	0	20	0	0
A24	500	0	40	40	20	0	0	10	0	0
A25	500	0	10	0	10	10	0	10	0	0
A26	500	0	10	20	10	10	10	20	10	10
A27	500	10	10	20	10	0	0	0	0	0
A28	500	100	80	20	70	Н. д.	30	Н. д.	80	Н. д.
A29	500	90	30	Н. д.	90	50	40	90	50	90
A30	500	90	70	Н. д.	50	90	30	90	90	90
A31	500	70	70	Н. д.	30	80	20	80	40	70
A32	500	60	20	Н. д.	0	40	10	50	20	70
A33	500	90	40	40	0	20	0	20	0	0
A34	500	70	0	0	0	0	0	0	0	0
A35	500	70	60	50	40	20	Н. д.	20	30	40
A36	500	70	60	60	30	10	0	30	10	10
A38	500	90	60	Н. д.	60	80	70	50	40	60
A39	500	40	30	Н. д.	20	0	0	0	0	0
A40	500	10	0	Н. д.	20	0	0	0	0	0
A41	500	10	0	Н. д.	0	0	0	10	10	10
A42	500	90	20	Н. д.	10	0	0	10	10	10
A43	500	40	40	Н. д.	30	60	10	30	20	60
A44	500	30	10	Н. д.	0	10	10	20	0	10
A45	500	0	0	Н. д.	0	50	0	20	0	10
A46	500	30	0	0	0	0	0	0	0	0
A47	500	60	60	10	10	10	0	10	10	10
A48	125	90	10	30	0	0	10	0	20	0
A49	500	10	50	Н. д.	10	20	20	50	20	10
A50	500	40	70	Н. д.	30	40	50	90	80	20
A51	500	10	60	Н. д.	10	10	20	50	30	30
A52	500	20	30	Н. д.	10	10	10	20	10	10
A53	500	10	10	20	20	0	0	0	10	10
A54	500	20	20	Н. д.	20	20	0	10	0	0
A55	500	50	40	10	30	Н. д.	30	Н. д.	20	Н. д.
A56	500	60	30	100	30	Н. д.	10	Н. д.	30	Н. д.
A57	500	100	80	20	0	20	0	30	0	60
A64	500	50	30	30	20	20	10	30	20	50
A65	500	30	20	20	20	20	10	30	10	20
A69	500	20	30	20	20	30	10	10	10	20
A71	500	20	50	40	30	20	0	30	10	20
A74	500	10	40	20	10	20	10	30	20	20
A79	500	90	40	60	40	90	30	80	70	80
A81	500	70	40	20	0	40	0	10	10	10
A83	500	20	30	50	10	10	10	20	10	0
A84	500	70	60	50	10	50	10	10	10	30
A85	500	100	90	100	100	100	90	100	100	100
A86	500	40	10	40	10	20	0	10	10	20
A87	500	0	10	20	0	0	0	0	20	20
A88	500	10	20	90	0	0	0	0	0	0
A89	500	30	30	20	10	80	10	90	80	60
A90	500	100	80	90	50	90	60	90	60	50
A92	500	100	60	80	20	20	10	80	60	60
A93	500	60	30	30	30	30	10	Н. д.	30	40
A94	500	30	40	30	10	40	10	30	10	20
A95	500	40	30	10	10	60	0	10	10	20
A96	500	100	100	100	30	90	100	100	80	100
A97	500	0	50	10	10	10	10	0	10	0

A98	500	50	40	30	10	10	0	70	20	40
A100	500	70	60	50	10	50	10	10	10	30

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

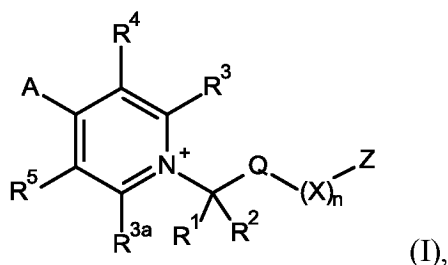
- 5 Таблица С. Контроль некоторых видов сорняков с помощью соединений формулы (I) после послевсходового применения

Номер соединения	Норма применения, г/га	BRNN	SOLTU	GLXMA	HELAN
A4	50	23	15	45	
A4	150	32	30	83	
A4	600	43	82	93	
A4	50	43	50	52	97
A4	150	57	60	62	100
A4	600	80	67	85	100

ФОРМУЛА ИЗОБРЕТЕНИЯ

1. Применение соединения формулы (I) или его агрономически приемлемой соли или цвиттер-ионных форм в качестве гербицида:

5



где

- 10 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 $-S(O)_tR^{15}$;

- 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
- 20

- 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
- 25

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 гетероцикл, который содержит 1 или 2 гетероатома, по отдельности выбранные из N и O; и

10

R^3 , R^{3a} , 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 $-C(O)NR^{16}R^{17}$;

20

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 $-C(O)NR^6R^{15a}$;

25

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 при этом указанный фенил необязательно замещен 1, 2 или 3 заместителями R^9 , которые могут быть одинаковыми или различными; или

R^{7b} и R^{7c} вместе с атомом азота, к которому они присоединены, образуют 4-6-членное гетероциклильное 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 где гетероарил, если это возможно, может быть 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-, 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, 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, по отдельности 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-, 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

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 выбран из группы, состоящей из C_3 - C_6 циклоалкила, фенила, 5- или 6-членного гетероарила, который содержит 1, 2, 3 или 4 гетероатома, по отдельности выбранные из N, O и S, и 4-6-членного гетероциклила, который содержит 1, 2 или 3 гетероатома, по отдельности 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 , Q и Z могут быть присоединены в любом положении

указанных циклоалкильных, фенильных, гетероарильных или гетероциклических 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 при этом 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 при этом 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 при этом 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 при этом 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, отдельно выбранный из N, O и S; и

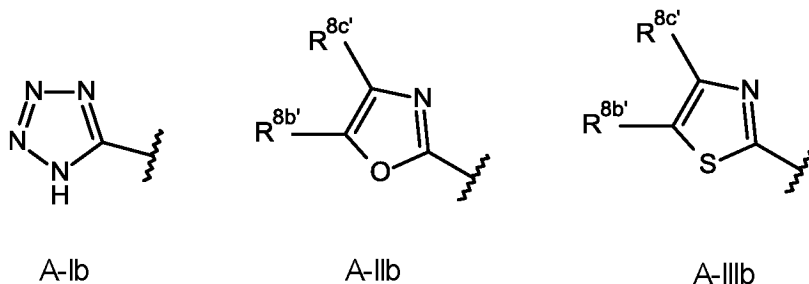
10 R^{18} выбран из группы, состоящей из водорода, C_1 - C_6 алкила, C_1 - C_6 галогеналкила, C_1 - C_6 алкокси, $-N(R^6)_2$ и фенила, и при этом указанный фенил необязательно замещен 1, 2 или 3 заместителями R^9 , которые могут быть одинаковыми или различными;

15 и

r равняется 0, 1 или 2.

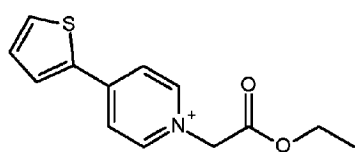
20 2. Соединение формулы (I) или его агрономически приемлемая соль или цвиттер-ионные формы по п. 1, при условии, что:

i) в соединении формулы (I) A не выбран из группы, состоящей из формул A-Ib – A-IIIb ниже,

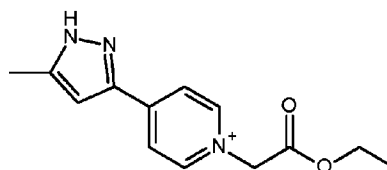


25 где каждый $R^{8b'}$ независимо выбран из группы, состоящей из фенила, 4-метоксифенила, 4-бутоксифенила, 4-фторфенила и метокси, и каждый $R^{8c'}$ независимо представляет собой водород или метил; или

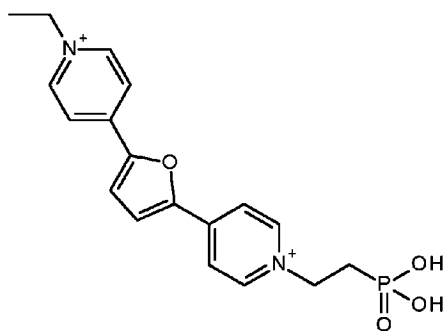
ii) соединение формулы (I) не выбрано из группы, состоящей из:



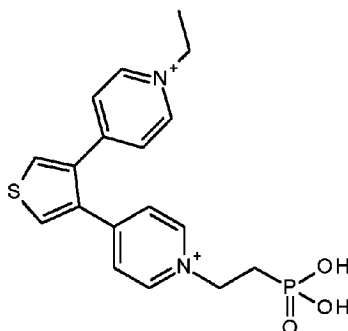
этил-2-[4-(2-тиенил)пиридин-1-ий-1-ил]ацетат,



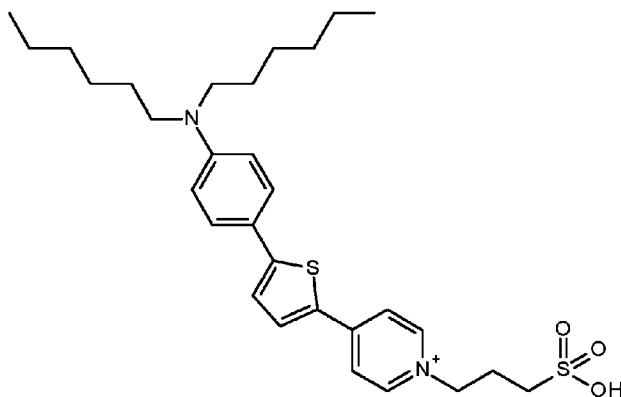
этил-2-[4-(5-метил-1H-пиразол-3-ил)пиридин-1-ий-1-ил]ацетат,



2-[4-[5-(1-этилпиридин-1-ий-4-ил)-2-фурил]пиридин-1-ий-1-ил]этилфосфовая кислота,



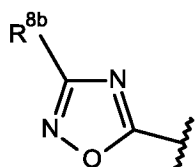
2-[4-[4-(1-этилпиридин-1-ий-4-ил)-3-тиенил]пиридин-1-ий-1-ил]этилфосфовая кислота и



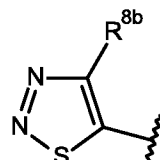
3-[4-[5-[4-(дигексиламино)фенил]-2-тиенил]пиридин-1-ий-1-ил]пропан-1-сульфовая кислота.

- 5 3. Соединение формулы (I) по п. 2, где R¹ и R² независимо выбраны из группы, состоящей из водорода и C₁-C₆алкила.

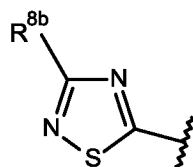
4. Соединение формулы (I) по п. 2 или п. 3, где R^1 и R^2 представляют собой водород.
5. Соединение формулы (I) по любому из пп. 2–4, где каждые R^{1a} и R^{2b} независимо выбраны из группы, состоящей из водорода, C_1 - C_6 алкила, $-OH$ и $-NH_2$.
6. Соединение формулы (I) по любому из пп. 2–5, где каждые R^{1a} и R^{2b} представляют собой водород.
- 10 7. Соединение формулы (I) по любому из пп. 2–6, где m равняется 0, 1 или 2.
8. Соединение формулы (I) по любому из пп. 2–7, где R^3 , R^{3a} , R^4 и R^5 независимо выбраны из группы, состоящей из водорода, галогена, циано, C_1 - C_6 алкила и C_1 - C_6 фторалкила.
- 15 9. Соединение формулы (I) по любому из пп. 2–8, где R^3 , R^{3a} , R^4 и R^5 представляют собой водород.
- 20 10. Соединение формулы (I) по любому из пп. 2–9, где A выбран из группы, состоящей из формул A-I – A-XXXII ниже,



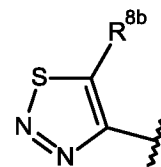
A-I



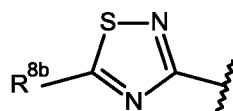
A-II



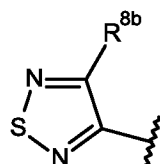
A-III



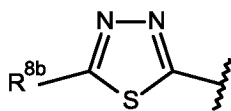
A-IV



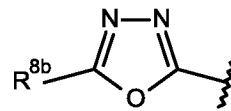
A-V



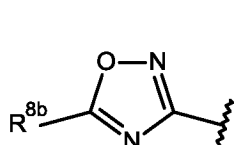
A-VI



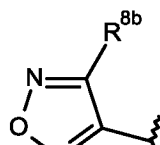
A-VII



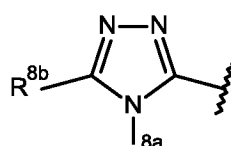
A-VIII



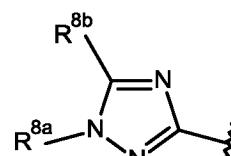
A-IX



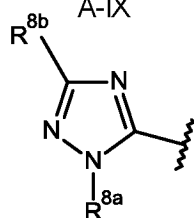
A-X



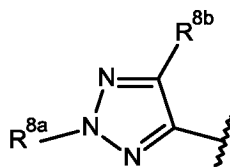
A-XI



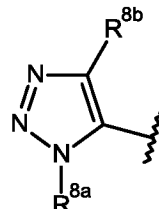
A-XII



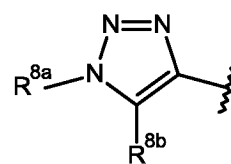
A-XIII



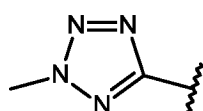
A-XIV



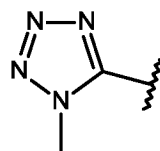
A-XV



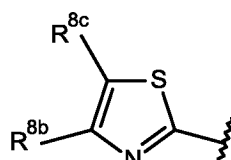
A-XVI



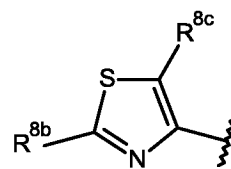
A-XVII



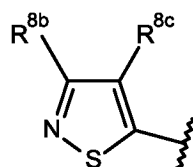
A-XVIII



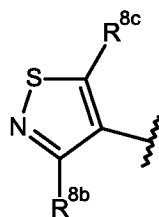
A-XIX



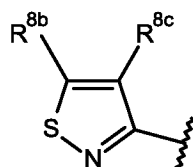
A-XX



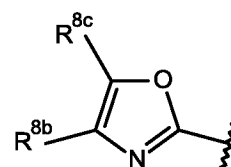
A-XXI



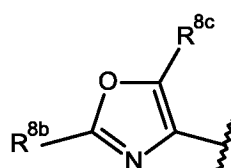
A-XXII



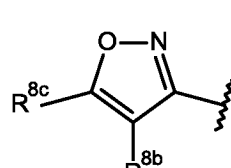
A-XXIII



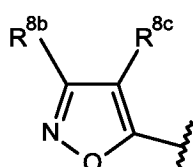
A-XXIV



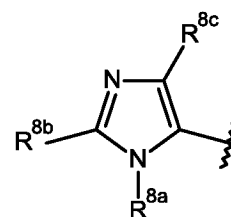
A-XXV



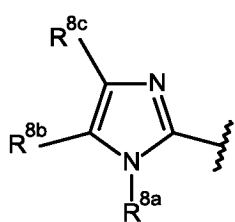
A-XXVI



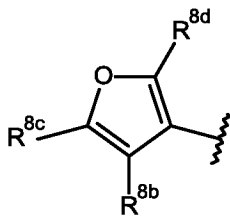
A-XXVII



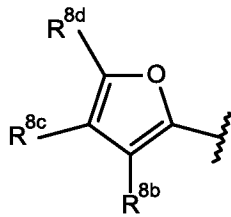
A-XXVIII



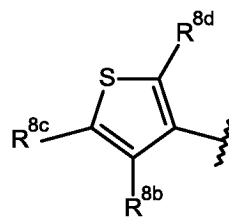
A-XXIX



A-XXX



A-XXXI



A-XXXII

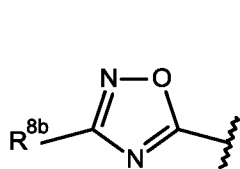
где изломанная линия обозначает точку присоединения к соединению формулы (I);

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

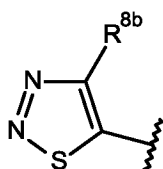
каждые R^{8b} , R^{8c} и R^{8d} независимо выбраны из группы, состоящей из водорода, галогена, нитро, циано, $-NH_2$, $-S(O)_r R^{15}$, $-C(O)OR^{10}$, $-C(O)R^{15}$, $-C(O)NR^{16}R^{17}$, $-S(O)_2NR^{16}R^{17}$, C_1 - C_6 алкила и C_1 - C_6 галогеналкила;

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

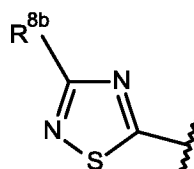
11. Соединение формулы (I) по любому из пп. 2–10, где A выбран из группы, состоящей из формул A-I – A-III ниже,



A-I



A-II



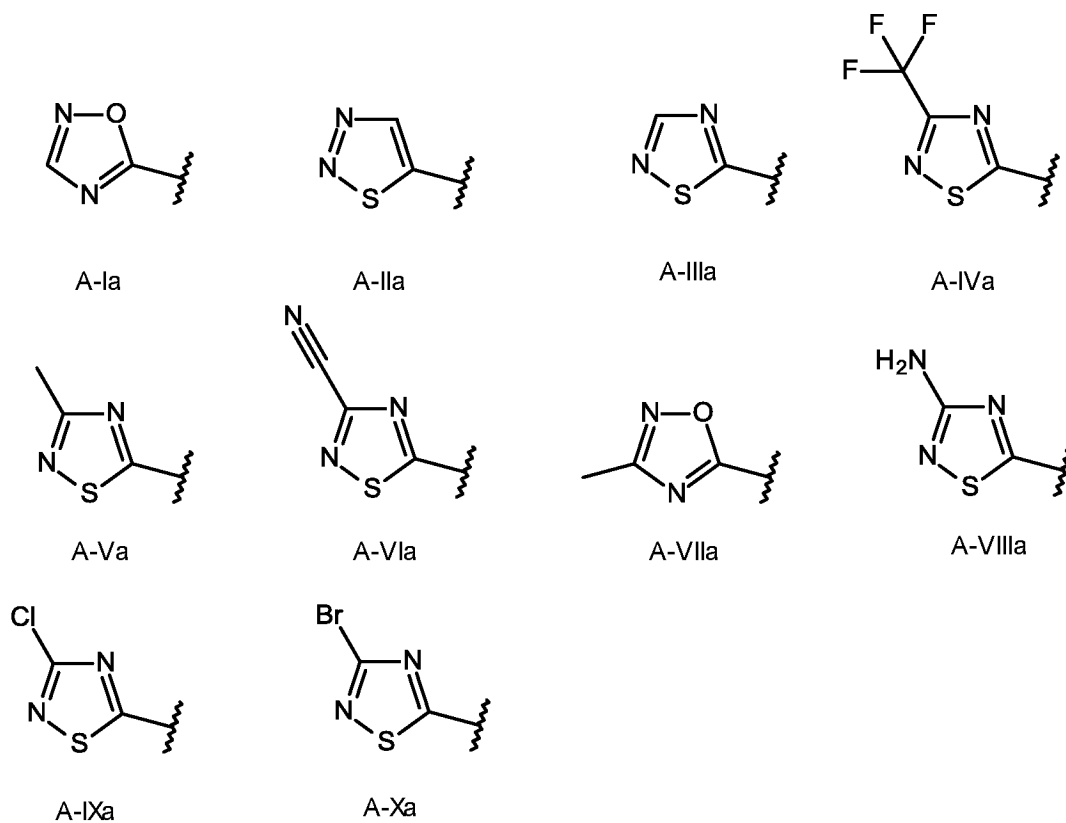
A-III

где изломанная линия обозначает точку присоединения к соединению формулы (I);

каждый R^{8b} независимо выбран из группы, состоящей из водорода, галогена, циано, $-NH_2$, $-C(O)NR^{16}R^{17}$, C_1 - C_6 алкила и C_1 - C_6 галогеналкила;

и R^{16} и R^{17} определены в п. 1.

12. Соединение формулы (I) по любому из пп. 2–11, где А выбран из группы, состоящей из формул А-Ia – А-Xa ниже,



- 5 13. Соединение формулы (I) по любому из пп. 2–12, где Z выбран из группы, состоящей из $-\text{C}(\text{O})\text{OR}^{10}$, $-\text{C}(\text{O})\text{NHS}(\text{O})_2\text{R}^{12}$, $-\text{OS}(\text{O})_2\text{OR}^{10}$, $-\text{S}(\text{O})_2\text{OR}^{10}$ и $-\text{P}(\text{O})(\text{R}^{13})(\text{OR}^{10})$.
- 10 14. Соединение по любому из пп. 1–13, где Z представляет собой $-\text{C}(\text{O})\text{OH}$ или $-\text{S}(\text{O})_2\text{OH}$.
15. Соединение по любому из пп. 1–14, где n равняется 0.
- 15 16. Применение соединения формулы (I) по любому из пп. 2–15 или его агрономически приемлемой соли или цвиттер-ионных форм в качестве гербицида.
17. Применение соединения формулы (I) по любому из пп. 1–15 для предуборочной десикации сельскохозяйственных культур.

18. Агрохимическая композиция, содержащая гербицидно эффективное количество соединения формулы (I) по любому из пп. 1-15 и агрохимически приемлемый разбавитель или носитель.

5

19. Способ контроля роста нежелательных растений, включающий применение соединения формулы (I) по любому из пп. 1-15 или композиции по п. 18 в отношении нежелательных растений или места их произрастания.