

(19)



**Евразийское
патентное
ведомство**

(11) **043046**(13) **B1**(12) **ОПИСАНИЕ ИЗОБРЕТЕНИЯ К ЕВРАЗИЙСКОМУ ПАТЕНТУ**

(45) Дата публикации и выдачи патента
2023.04.20

(21) Номер заявки
202091692

(22) Дата подачи заявки
2019.01.16

(51) Int. Cl. **C07D 257/06** (2006.01)
A01N 43/713 (2006.01)
A01N 43/82 (2006.01)
C07C 257/12 (2006.01)
C07C 257/14 (2006.01)
C07C 259/14 (2006.01)
C07C 309/30 (2006.01)
C07D 271/113 (2006.01)
C07D 295/13 (2006.01)

(54) **АМИДИН-ЗАМЕЩЕННЫЕ БЕНЗОИЛЬНЫЕ ПРОИЗВОДНЫЕ, ПРИГОДНЫЕ В КАЧЕСТВЕ ГЕРБИЦИДОВ**

(31) **1800894.6**

(32) **2018.01.19**

(33) **GB**

(43) **2020.11.24**

(86) **PCT/EP2019/051071**

(87) **WO 2019/141740 2019.07.25**

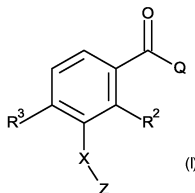
(71)(73) Заявитель и патентовладелец:
**ЗИНГЕНТА ПАРТИСИПЕЙШНС АГ
(CH)**

(72) Изобретатель:
**Бертон Пол Мэттью, Смит
Александр Мартин Ричард, Эмери
Кэти (GB)**

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

(56) **WO-A1-2013064459
WO-A2-2008110278**

(57) Изобретение относится к соединениям формулы (I)



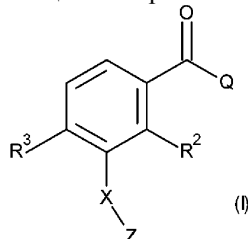
или их агрономически приемлемой соли, где Q, X, Z, R² и R³ описаны в данном документе. Настоящее изобретение дополнительно относится к гербицидным композициям, содержащим указанные соединения, к способам контроля сорняков с применением указанных композиций и к применению соединений формулы (I) в качестве гербицида.

B1**043046****043046****B1**

Настоящее изобретение относится к новым гербицидным соединениям, гербицидным композициям, которые содержат новые соединения, и к их применению для контроля сорняков, в частности, в сельскохозяйственных культурах полезных растений, или для подавления роста растений.

N-(тетразол-5-ил)- и N-(1,3,4-оксадиазол-2-ил)арилкарбоксамиды раскрыты, например, в WO 2012/028579 и WO 2012/126932 соответственно. Настоящее изобретение относится к новым амидин-замещенным бензоильным соединениям.

Таким образом, в соответствии с настоящим изобретением предусмотрено соединение формулы (I)

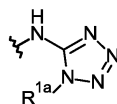


или его агрономически приемлемая соль,

где R^2 выбран из группы, состоящей из галогена, C_1 - C_6 алкила, C_3 - C_6 циклоалкила, C_1 - C_6 галогеналкила и $-S(O)_pC_1$ - C_6 алкила;

R^3 выбран из группы, состоящей из галогена, C_1 - C_6 алкила, C_1 - C_6 галогеналкила и $-S(O)_pC_1$ - C_6 алкила;

Q представляет собой Q^1 :

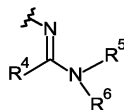


Q^1 ;

R^{1a} представляет собой C_1 - C_4 алкил- или C_1 - C_3 -алкокси- C_1 - C_3 -алкил-;

X представляет собой $-(CH_2)_n-$, и n равняется 0;

Z представляет собой Z^1 :



Z^1 ;

R^4 выбран из группы, состоящей из водорода, C_1 - C_6 алкила, C_1 - C_6 галогеналкила и C_3 - C_6 циклоалкила;

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

R^6 выбран из группы, состоящей из водорода, C_1 - C_6 алкила, C_1 - C_6 галогеналкила, циано и фенила, где фенил необязательно замещен 1, 2 или 3 заместителями, выбранными из группы, состоящей из галогена, C_1 - C_6 алкила, C_1 - C_6 галогеналкила и C_1 - C_6 алкокси; или

R^5 и R^6 вместе представляют собой $-CH_2CH_2CH_2CH_2-$, $-CH_2CH_2CH_2CH_2CH_2-$ или $-CH_2CH_2OCH_2CH_2-$; и

p=0, 1 или 2.

C_1 - C_6 алкильные и C_1 - C_4 алкильные группы включают, например, метил (Me, CH_3), этил (Et, C_2H_5), н-пропил (n-Pr), изопропил (i-Pr), н-бутил (n-Bu), изобутил (i-Bu), втор-бутил и трет-бутил (t-Bu).

C_3 - C_6 циклоалкил- включает циклопропил (с-пропил (с-Pr)), циклобутил (с-бутил (с-Bu)), циклопентил (с-пентил) и циклогексил (с-гексил).

Галоген (или галогенид) охватывает фтор, хлор, бром или йод. То же самое, соответственно, применимо к галогену в контексте других определений, таких как галогеналкил.

C_1 - C_6 галогеналкил включает, например, фторметил-, дифторметил-, трифторметил-, хлорметил-, дихлорметил-, трихлорметил-, 2,2,2-трифторэтил-, 2-фторэтил-, 2-хлорэтил-, пентафторэтил-, 1,1-дифтор-2,2,2-трихлорэтил-, 2,2,3,3-тетрафторэтил-, 2,2,2-трихлорэтил-, гептафтор-н-пропил и перфтор-н-гексил. C_1 - C_4 галогеналкил включает, например, фторметил-, дифторметил-, трифторметил-, хлорметил-, дихлорметил-, трихлорметил-, 2,2,2-трифторэтил-, 2-фторэтил-, 2-хлорэтил-, пентафторэтил-, 1,1-дифтор-2,2,2-трихлорэтил-, 2,2,3,3-тетрафторэтил-, 2,2,2-трихлорэтил- и гептафтор-н-пропил-.

C_1 - C_6 алкил-S-(алкилтио) представляет собой, например, метилтио, этилтио, пропилтио, изопропилтио, н-бутилтио, изобутилтио, втор-бутилтио или трет-бутилтио, предпочтительно метилтио или этилтио.

C_1 - C_6 алкил-S(O)-(алкилсульфинил) представляет собой, например, метилсульфинил, этилсульфинил, пропилсульфинил, изопропилсульфинил, н-бутилсульфинил, изобутилсульфинил, втор-бутилсульфинил или трет-бутилсульфинил, предпочтительно метилсульфинил или этилсульфинил.

C_1 - C_6 алкил-S(O)₂-(алкилсульфонил) представляет собой, например, метил сульфонил, этилсульфо-

нил, пропилсульфонил, изопропилсульфонил, н-бутилсульфонил, изобутилсульфонил, втор-бутилсульфонил или трет-бутилсульфонил, предпочтительно метилсульфонил или этилсульфонил.

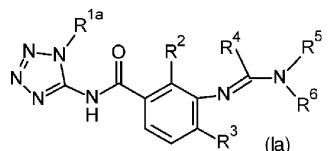
В предпочтительном варианте осуществления настоящего изобретения R выбран из группы, состоящей из метила, Cl, -CF₃ и -SO₂метила.

В другом предпочтительном варианте осуществления настоящего изобретения R³ выбран из группы, состоящей из метила, Cl, -CF₃ и -SO₂метила.

В другом предпочтительном варианте осуществления настоящего изобретения R^{1a} выбраны из группы, состоящей из метила, этила и н-пропила.

В другом варианте осуществления настоящего изобретения Q представляет собой Q¹, и Z представляет собой Z¹. В данном варианте осуществления X может представлять собой -(CH₂)_n-, и n равняется 0.

В данном варианте осуществления соединения формулы (I) представляет собой соединение формулы (Ia)



где R^{1a}, R², R³, R⁴, R⁵ и R⁶ определены для соединения формулы (I).

Соединения формулы (I) (и некоторые промежуточные соединения, применяемые для синтеза соединения формулы (I)) могут содержать асимметричные центры и могут быть представлены в виде одного энантиомера, пар энантиомеров в любой пропорции или, при наличии более одного асимметричного центра, могут включать диастереоизомеры во всех возможных соотношениях. Как правило, один из энантиомеров обладает повышенной биологической активностью по сравнению с другими вариантами.

Настоящее изобретение также включает все возможные геометрические и таутомерные формы соединения формулы (I).

Настоящее изобретение также включает агрономически приемлемые соли, которые могут образовывать соединения формулы (I) с аминами (например, аммиаком, диметиламином и триэтиламином), основаниями щелочных металлов и щелочноземельных металлов или четвертичными аммониевыми основаниями. Среди гидроксидов, оксидов, алкоксидов, и гидрокарбонатов, и карбонатов щелочных металлов и щелочно-земельных металлов, применяемых в качестве солеобразователей, особое внимание следует уделить гидроксидам, алкоксидам, оксидам и карбонатам лития, натрия, калия, магния и кальция, но особенно гидроксидам, алкоксидам, оксидам и карбонатам натрия, магния и кальция. Также можно применять соответствующую триметилсульфониевую соль.

Соединения формулы (I) согласно настоящему изобретению можно применять сами по себе в качестве гербицидов, но обычно их составляют в гербицидные композиции с применением вспомогательных средств для составления, таких как носители, растворители и поверхностно-активные средства (SFA). Таким образом, в настоящем изобретении дополнительно предусмотрена гербицидная композиция, содержащая гербицидное соединение по настоящему изобретению и приемлемое с точки зрения сельского хозяйства вспомогательное средство для составления. Композиция может быть представлена в форме концентратов, которые разбавляют перед применением, хотя также можно получать готовые к применению композиции. Конечное разбавление обычно выполняют с помощью воды, но его также можно выполнять с использованием вместо воды или помимо воды, например, жидких удобрений, питательных микроэлементов, биологических организмов, масла или растворителей.

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 можно выбирать из множества типов составов, многие из которых известны из Руководства по разработке и применению спецификаций FAO в отношении препаратов для защиты растений (Manual on Development and Use of FAO Specifications for Plant Protection Products), 5-е издание, 1999 г. Таковые включают распыляемые порошки (DP), растворимые порошки (SP), водорастворимые гранулы (SG), диспергируемые в воде гранулы (WG), смачиваемые порошки (WP), гранулы (GR) (с медленным или быстрым высвобождением), растворимые концентраты (SL), смешиваемые с маслом жидкости (OL), жидкости, применяемые в сверхнизком объеме (UL), эмульгируемые концентраты (EC), диспергируемые концентраты (DC), эмульсии (как "масло в воде" (EW), так и "вода в масле" (EO)), микроэмульсии (ME), суспензионные концентраты (SC), аэрозоли, капсульные суспензии (CS) и составы для обработки семян. Выбранный тип состава в любом случае будет зависеть от конкретного предусмотренного назначения, а также физических, химических и биологических свойств соединения формулы (I).

Распыляемые порошки (DP) можно получать посредством смешивания соединения формулы (I) с одним или несколькими твердыми разбавителями (например, природными глинами, каолином, пирофиллитом, бентонитом, глиноземом, монтмориллонитом, кизельгуром, мелом, диатомовыми землями, фосфатами кальция, карбонатами кальция и магния, серой, известью, тонкодисперсными порошками, таль-

ком и другими органическими и неорганическими твердыми носителями) и механического измельчения смеси до тонкодисперсного порошка.

Растворимые порошки (SP) можно получать посредством смешивания соединения формулы (I) с одной или несколькими водорастворимыми неорганическими солями (такими как бикарбонат натрия, карбонат натрия или сульфат магния) или с одним или несколькими водорастворимыми органическими твердыми веществами (такими как полисахарид) и необязательно с одним или несколькими смачивающими средствами, одним или несколькими диспергирующими средствами или смесью указанных средств для улучшения диспергируемости/растворимости в воде. Затем смесь измельчают до мелкодисперсного порошка. Подобные композиции можно также гранулировать с образованием водорастворимых гранул (SG).

Смачиваемые порошки (WP) можно получать посредством смешивания соединения формулы (I) с одним или несколькими твердыми разбавителями или носителями, одним или несколькими смачивающими средствами и предпочтительно одним или несколькими диспергирующими средствами, а также необязательно с одним или несколькими суспендирующими средствами для облегчения диспергирования в жидкостях. Затем смесь измельчают до мелкодисперсного порошка. Подобные композиции также можно гранулировать с образованием диспергируемых в воде гранул (WG).

Гранулы (GR) могут быть образованы либо посредством гранулирования смеси соединения формулы (I) и одного или нескольких порошкообразных твердых разбавителей или носителей, либо из предварительно образованных пустых гранул посредством абсорбции соединения формулы (I) (или его раствора в подходящем средстве) в пористом гранулированном материале (таком как пемза, аттапульгитовые глины, фуллерова земля, кизельгур, диатомовые земли или измельченные кукурузные початки) или посредством адсорбции соединения формулы (I) (или его раствора в подходящем средстве) на твердом зернистом материале (таком как пески, силикаты, минеральные карбонаты, сульфаты или фосфаты) и высушивания в случае необходимости. Средства, которые обычно применяют для облегчения абсорбции или адсорбции, включают растворители (такие как алифатические и ароматические нефтяные растворители, спирты, простые эфиры, кетоны и сложные эфиры) и средства, способствующие прилипанию (такие как поливинилацетаты, поливиниловые спирты, декстрины, сахара и растительные масла). В гранулы также можно включать одну или несколько других добавок (например, эмульгирующее средство, смачивающее средство или диспергирующее средство).

Диспергируемые концентраты (DC) можно получать посредством растворения соединения формулы (I) в воде или органическом растворителе, таком как кетон, спирт или гликолевый эфир. Данные растворы могут содержать поверхностно-активное вещество (например, для улучшения разбавления водой или предотвращения кристаллизации в резервуаре опрыскивателя).

Эмульгируемые концентраты (EC) или эмульсии типа "масло в воде" (EW) можно получать посредством растворения соединения формулы (I) в органическом растворителе (необязательно содержащем одно или несколько смачивающих средств, одно или несколько эмульгирующих средств или смесь указанных средств). Подходящие органические растворители для применения в EC включают ароматические углеводороды (такие как алкилбензолы или алкилнафталины, примерами которых являются SOLVESO 100, SOLVESSO 150 и SOLVESSO 200; причем SOLVESSO является зарегистрированной торговой маркой), кетоны (такие как циклогексанон или метилциклогексанон) и спирты (такие как бензиловый спирт, фурфуроловый спирт или бутанол), N-алкилпирролидоны (такие как N-метилпирролидон или N-октилпирролидон), диметиламины жирных кислот (такие как диметиламид C₈-C₁₀ жирной кислоты) и хлорированные углеводороды. EC-продукт может самопроизвольно образовывать эмульсию при добавлении в воду с получением эмульсии, обладающей достаточной стабильностью для обеспечения применения путем распыления с помощью подходящего оборудования.

Получение EW включает получение соединения формулы (I) либо в виде жидкости (если оно не является жидкостью при комнатной температуре, его можно расплавить при допустимой температуре, как правило, ниже 70°C), либо в растворе (посредством растворения его в соответствующем растворителе), а затем эмульгирование полученной жидкости или раствора в воде, содержащей одно или несколько SFA, с большим сдвиговым усилием с получением эмульсии. Подходящие растворители для применения в EW включают растительные масла, хлорированные углеводороды (такие как хлорбензолы), ароматические растворители (такие как алкилбензолы или алкилнафталины) и другие соответствующие органические растворители, которые характеризуются низкой растворимостью в воде.

Микроэмульсии (ME) можно получать посредством смешивания воды со смесью одного или нескольких растворителей с одним или несколькими SFA с самопроизвольным образованием термодинамически стабильного изотропного жидкого состава. Соединение формулы (I) изначально присутствует либо в воде, либо в смеси растворитель/SFA. Подходящие растворители для применения в ME включают растворители, описанные в данном документе выше для применения в EC или в EW. ME может представлять собой систему либо типа "масло в воде", либо типа "вода в масле" (при этом система может быть определена посредством измерений электрической проводимости) и может быть подходящей для смешивания водорастворимых и маслорастворимых пестицидов в этом же составе. ME является подходящей для разбавления в воде, при этом она либо остается в виде микроэмульсии, либо образует обыч-

ную эмульсию типа "масло в воде".

Суспензионные концентраты (SC) могут содержать водные или неводные суспензии мелкоизмельченных нерастворимых твердых частиц соединения формулы (I). SC можно получать посредством размалывания в шаровой или бисерной мельнице твердого соединения формулы (I) в подходящей среде, необязательно с одним или несколькими диспергирующими средствами, с получением тонкодисперсной суспензии соединения. В композицию можно включать одно или несколько смачивающих средств, а также можно включать суспендирующее средство для снижения скорости оседания частиц. В качестве альтернативы, соединение формулы (I) можно подвергать сухому помолу и добавлять в воду, содержащую средства, описанные в данном документе выше, с получением необходимого конечного продукта.

Аэрозольные составы содержат соединение формулы (I) и подходящий газ-вытеснитель (например, н-бутан). Соединение формулы (I) также можно растворять или диспергировать в подходящей среде (например, в воде или в смешивающейся с водой жидкости, такой как н-пропанол) с получением композиций для применения в не находящихся под давлением насосах для опрыскивания с ручным управлением.

Капсульные суспензии (CS) можно получать аналогично получению составов EW, но с дополнительной стадией полимеризации с получением водной дисперсии капель масла, в которой каждая капля масла инкапсулируется полимерной оболочкой и содержит соединение формулы (I) и необязательно его носитель или разбавитель. Полимерную оболочку можно получать либо с помощью осуществления реакции межфазной поликонденсации, либо с помощью процедуры коацервации. Композиции могут обеспечивать контролируемое высвобождение соединения формулы (I), и их можно применять для обработки семян. Соединение формулы (I) также можно составлять в виде биоразлагаемой полимерной матрицы для обеспечения медленного контролируемого высвобождения соединения.

Композиция может включать одну или несколько добавок для улучшения биологической эффективности композиции, например, посредством улучшения смачивания, удержания на поверхностях или распределения по поверхностям; устойчивости к смыванию дождем с обработанных поверхностей или же поглощения или подвижности соединения формулы (I). Такие добавки включают поверхностно-активные вещества (SFA), добавки для опрыскивания на основе масел, например, определенных минеральных масел или природных растительных масел (таких как соевое и рапсовое масло), и их смеси с другими вспомогательными средствами, усиливающими биологическое действие (ингредиентами, которые могут способствовать действию соединения формулы (I) или модифицировать это действие).

Смачивающие средства, диспергирующие средства и эмульгирующие средства могут представлять собой SFA катионного, анионного, амфотерного или неионогенного типа.

Подходящие SFA катионного типа включают соединения четвертичного аммония (например, бромид цетилтриметиламмония), имидазолины и соли аминов.

Подходящие анионные SFA включают соли щелочных металлов жирных кислот, соли алифатических сложных моноэфиров серной кислоты (например, лаурилсульфат натрия), соли сульфонированных ароматических соединений (например, додецилбензолсульфонат натрия, додецилбензолсульфонат кальция, бутилнафталинсульфонат и смеси диизопропил- и триизопропилнафталинсульфонатов натрия), эфирсульфаты, эфирсульфаты спиртов (например, лаурет-3-сульфат натрия), эфиркарбоксилаты (например, лаурет-3-карбоксилат натрия), сложные эфиры фосфорной кислоты (продукты реакции между одним или несколькими жирными спиртами и фосфорной кислотой (преимущественно сложные моноэфиры) или пентаоксидом фосфора (преимущественно сложные диэфиры), например, при реакции между лауриловым спиртом и тетрафосфорной кислотой; дополнительно эти продукты могут быть этоксилированы), сульфосукцинаматы, парафин- или олефинсульфонаты, таураты и лигносульфонаты.

Подходящие SFA амфотерного типа включают бетаины, пропионаты и глицинаты.

Подходящие SFA неионогенного типа включают продукты конденсации алкиленоксидов, таких как этиленоксид, пропиленоксид, бутиленоксид или их смеси, с жирными спиртами (такими как олеиловый спирт или цетиловый спирт) или с алкилфенолами (такими как октилфенол, нонилфенол или октилкрезол); неполные сложные эфиры, полученные из длинноцепочечных жирных кислот или ангидридов гексита; продукты конденсации указанных неполных сложных эфиров с этиленоксидом; блок-сополимеры (содержащие этиленоксид и пропиленоксид); алканамиды; сложные эфиры с простой структурой (например, сложные эфиры жирной кислоты и полиэтиленгликоля); аминоксиды (например, лаурилдиметиламиноксид) и лецитины.

Подходящие суспендирующие средства включают гидрофильные коллоиды (такие как полисахариды, поливинилпирролидон или карбоксиметилцеллюлоза натрия) и набухающие глины (такие как бентонит или аттапульгит).

Композиция по настоящему изобретению может дополнительно содержать по меньшей мере один дополнительный пестицид. Например, соединения согласно настоящему изобретению также можно применять в комбинации с другими гербицидами или регуляторами роста растений. В предпочтительном варианте осуществления дополнительным пестицидом является гербицид и/или антидот гербицида. Примерами таких смесей (в которых "I" представляет соединение формулы I) являются: I+ацетохлор, I+ацифлуорфен, I+ацифлуорфен-натрий, I+аклонифен, I+акролеин, I+алахлор, I+аллоксидим, I+аметрин, I+амикарбазон, I+амидосульфурон, I+аминопиралид, I+амитрол, I+анилофос, I+асулам, I+атразин,

I+азафенидин, I+азимсульфурон, I+BCPC, I+бефлубутамид, I+беназолин, I+бенкарбазон, I+бенфлуралин, I+бенфуресат, I+бенсульфурон, I+бенсульфурон-метил, I+бенсулид, I+бентазон, I+бензфендизон, I+бензобициклон, I+бензофенап, I+бициклопирон, I+бифенокс, I+билапафос, I+биспирибак, I+биспирибак-натрий, I+бура, I+бромацил, I+бромобутид, I+бромоксинил, I+бутахлор, I+бутамифос, I+бутралин, I+бутроксидим, I+бутилат, I+какодиловая кислота, I+хлорат кальция, I+кафенстрол, I+карбетамид, I+карфентразон, I+карфентразон-этил, I+хлорфлуренол, I+хлорфлуренол-метил, I+хлоридазон, I+хлоримурон, I+хлоримурон-этил, I+хлоруксусная кислота, I+хлоротолурон, I+хлорпрофам, I+хлорсульфурон, I+хлортал, I+хлортал-диметил, I+цинидон-этил, I+цинметилин, I+циносульфурон, I+цисанилид, I+клетодим, I+клодинафоп, I+клодинафоп-пропаргил, I+кломазон, I+кломепроп, I+клопиралид, I+клорансулам, I+клорансулам-метил, I+цианазин, I+циклоат, I+циклосульфамурон, I+циклоксидим, I+цигалофоп, I+цигалофоп-бутил, I+2,4-D, I+даимурон, I+далапон, I+дазомет, I+2,4-DB, I+I+десмедифам, I+дикамба, I+дихлобензил, I+дихлорпроп, I+дихлорпроп-Р, I+диклофоп, I+диклофоп-метил, I+диклосулам, I+дифензокват, I+дифензокват метилсульфат, I+дифлуфеникан, I+дифлуфензопир, I+димефурон, I+димепиперат, I+диметакхлор, I+диметаметрин, I+диметенамид, I+диметенамид-Р, I+диметипин, I+диметиларсиновая кислота, I+динитрамин, I+динотерб, I+дифенамид, I+дипропетрин, I+дикват, I+дикват дибромид, I+дитиопир, I+диурон, I+эндотал, I+ЕРТС, I+эспрокарб, I+эталфлуралин, I+этаметсульфурон, I+этаметсульфурон-метил, I+этефон, I+этофумезат, I+этоксифен, I+этоксисульфурон, I+этобензанид, I+феноксапроп-Р, I+феноксапроп-Р-этил, I+фенквинотрион, I+фентразамид, I+сульфат железа, I+флампроп-М, I+флазасульфурон, I+флорасулам, I+флуазифоп, I+флуазифоп-бутил, I+флуазифоп-Р, I+флуазифоп-Р-бутил, I+флуазолат, I+флукарбазон, I+флукарбазон-натрий, I+флуцетосульфурон, I+флухлоралин, I+флуфенацет, I+флуфенпир, I+флуфенпир-этил, I+флуметралин, I+флуметсулам, I+флумиклорак, I+флумиклорак-пентил, I+флумиоксазин, I+флумипропин, I+флуометурон, I+флуорогликофен, I+флуорогликофен-этил, I+флуоксапроп, I+флуоксам, I+флупропацил, I+флупропанат, I+флупирсульфурон, I+флупирсульфурон-метил-натрий, I+флуренол, I+флуридон, I+флуорохлоридон, I+флуорокиспир, I+флуртамон, I+флутиацет, I+флутиацет-метил, I+фомесафен, I+форамсульфурон, I+фосамин, I+глюфосинат, I+глюфосинат-аммоний, I+глифосат, I+галауксифен, I+галосульфурон, I+галосульфурон-метил, I+галооксифоп, I+галооксифоп-Р, I+гексазинон, I+имазаметабенз, I+имазаметабенз-метил, I+имазамокс, I+имазапик, I+имазапир, I+имазаквин, I+имазетапир, I+имазосульфурон, I+инданофан, I+индазифлам, I+йодметан, I+иодосульфурон, I+иодосульфурон-метил-натрий, I+иоксинил, I+изопротурон, I+изоурон, I+изоксабен, I+изоксахлортол, I+изоксафлутол, I+изоксапирифоп, I+карбутилат, I+лактофен, I+ленацил, I+линурон, I+мекопроп, I+мекопроп-Р, I+мефенацет, I+мефлуидид, I+мезосульфурон, I+мезосульфурон-метил, I+мезотрион, I+метам, I+метамифоп, I+метамитрон, I+метазахлор, I+метабензтиазурон, I+метазол, I+метиларсоновая кислота, I+метилдимрон, I+метилизотиоцианат, I+метолахлор, I+S-метолахлор, I+метосулам, I+метоксурон, I+метрибузин, I+метосульфурон, I+метосульфурон-метил, I+молинат, I+монолинурон, I+напроанилид, I+напропамид, I+напталам, I+небурон, I+никосульфурон, I+n-метилглифосат, I+нонановая кислота, I+норфлуразон, I+олеиновая кислота (жирные кислоты), I+орбенкарб, I+ортосульфамурон, I+оризалин, I+оксадиаргил, I+оксадиазон, I+оксасульфурон, I+оксаклиомефон, I+оксифлуорфен, I+паракват, I+паракват дихлорид, I+пебулат, I+пендиметалин, I+пеносулам, I+пентахлорфенол, I+пентахлор, I+пентоксазон, I+петоксамид, I+фенмедифам, I+пиклорам, I+пиколинафен, I+пиноксаден, I+пиперофос, I+претилахлор, I+примисульфурон, I+примисульфурон-метил, I+продиамин, I+профоксидим, I+прогексадион-кальций, I+прометон, I+прометрин, I+пропахлор, I+пропанил, I+пропаквизафоп, I+пропазин, I+профам, I+пропизохлор, I+пропоксикарбазон, I+пропоксикарбазон-натрий, I+пропизамид, I+просульфокарб, I+просульфурон, I+пираклонил, I+пирафлуфен, I+пирафлуфен-этил, I+пирасульфотол, I+пиразолинат, I+пиразосульфурон, I+пиразосульфурон-этил, I+пиразоксифен, I+пирибензоксим, I+пирибутикарб, I+пиридафол, I+пиридат, I+пирифталид, I+пириминобак, I+пириминобак-метил, I+пиримисульфам, I+пиритиобак, I+пиритиобак-натрий, I+пироксасульфоп, I+пироксулам, I+квинклорак, I+квинмерак, I+квинокламин, I+квизалофоп, I+квизалофоп-Р, I+римсульфурон, I+сафлуфенацил, I+сетоксидим, I+сидурон, I+симазин, I+симетрин, I+хлорат натрия, I+сулькотрион, I+сульфентразон, I+сульфометурон, I+сульфометурон-метил, I+сульфосат, I+сульфосульфурон, I+серная кислота, I+тебутиурон, I+тефурилтрион, I+темботрион, I+тепралоксидим, I+тербацил, I+тербуметон, I+тербутилазин, I+тербутрин, I+тенилхлор, I+тиазопир, I+тифенсульфурон, I+тиенкарбазон, I+тифенсульфурон-метил, I+тиобенкарб, I+топрамезон, I+тралкоксидим, I+триаллат, I+триасульфурон, I+триазифлам, I+трибенурон, I+трибенурон-метил, I+триклопир, I+триэтазин, I+трифлорисульфурон, I+трифлорисульфурон-натрий, I+трифлуралин, I+трифлусульфурон, I+трифлусульфурон-метил, I+тригидрокситриазин, I+тринексапак-этил, I+тритосульфурон, I+сложный этиловый эфир [3-[2-хлор-4-фтор-5-(1-метил-6-трифторметил-2,4-диоксо-1,2,3,4-тетрагидропиримидин-3-ил)фенокси]-2-пиридилокси]уксусной кислоты (CAS RN 353292-31-6), 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-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-оксопиридазин-4-карбонил]бицикло[3.2.1]октан-2,4-дион, I+2-[2-(3,4-диметоксифенил)-6-метил-3-оксопиридазин-4-карбонил]-5-метилциклогексан-1,3-дион, I+2-[2-(3,4-диметоксифенил)-6-метил-3-оксопиридазин-4-карбонил]циклогексан-1,3-дион, 2-[2-(3,4-диметоксифенил)-6-метил-3-оксопиридазин-4-карбонил]-5,5-диметилциклогексан-1,3-дион, I+6-[2-(3,4-диметоксифенил)-6-метил-3-оксопиридазин-4-карбонил]-2,2,4,4-тетраметилциклогексан-1,3,5-трион, I+2-[2-(3,4-диметоксифенил)-6-метил-3-оксопиридазин-4-карбонил]-5-этилциклогексан-1,3-дион, I+2-[2-(3,4-диметоксифенил)-6-метил-3-оксопиридазин-4-карбонил]-4,4,6,6-тетраметилциклогексан-1,3-дион, I+2-[6-циклопропил-2-(3,4-диметоксифенил)-3-оксопиридазин-4-карбонил]-5-метил-циклогексан-1,3-дион, I+3-[6-циклопропил-2-(3,4-диметоксифенил)-3-оксопиридазин-4-карбонил]бицикло[3.2.1]октан-2,4-дион, I+2-[6-циклопропил-2-(3,4-диметоксифенил)-3-оксопиридазин-4-карбонил]-5,5-диметилциклогексан-1,3-дион, I+6-[6-циклопропил-2-(3,4-диметоксифенил)-3-оксопиридазин-4-карбонил]-2,2,4,4-тетраметилциклогексан-1,3,5-трион, I+2-[6-циклопропил-2-(3,4-диметоксифенил)-3-оксопиридазин-4-карбонил]циклогексан-1,3-дион, I+4-[2-(3,4-диметоксифенил)-6-метил-3-оксопиридазин-4-карбонил]-2,2,6,6-тетраметилтетрагидропиран-3,5-дион и 4-[6-циклопропил-2-(3,4-диметоксифенил)-3-оксопиридазин-4-карбонил]-2,2,6,6-тетраметилтетрагидропиран-3,5-дион. Соединения по настоящему изобретению можно также комбинировать с гербицидными соединениями, раскрытыми в WO 06/024820 и/или WO 07/096576.

Смешиваемые компоненты для соединения формулы I, также могут находиться в форме сложных эфиров или солей, как упоминается, например, в The Pesticide Manual, Sixteenth Edition, British Crop Protection Council, 2012.

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.

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

Соединения формулы I согласно настоящему изобретению можно также применять в комбинации с одним или несколькими антидотами. Аналогично, смеси соединения формулы I согласно настоящему изобретению с одним или несколькими дополнительными гербицидами также можно применять в комбинации с одним или несколькими антидотами. Антидотами могут быть AD 67 (MON 4660), беноксакор, клоквиносет-мексил, ципросульфамид (CAS RN 221667-31-8), дихлормид, фенхлоразол-этил, фенклорим, флуксофенил, фуриазол и соответствующий R-изомер, изоксадифен-этил, мефенпир-диэтил, оксабетринил, N-изопропил-4-(2-метоксibenзоилсульфамид)бензамид (CAS RN 221668-34-4). Другие возможные варианты включают соединения-антидоты, раскрытые, например, в EP0365484, например, N-(2-метоксibenзоил)-4-[(метиламинокарбонил)амино]бензолсульфонамид. Особенно предпочтительными являются смеси соединения формулы I с ципросульфамидом, изоксадифен-этилом, клоквиносет-мексиком и/или N-(2-метоксibenзоил)-4-[(метиламинокарбонил)амино]бензолсульфонамидом.

Антидоты соединения формулы I также могут находиться в форме сложных эфиров или солей, как упоминается, например, в The Pesticide Manual, 16th Edition (BCPC), 2012. Ссылка на клоквиносет-мексил также относится к его соли лития, натрия, калия, кальция, магния, алюминия, железа, аммония, четвертичного аммония, сульфония или фосфония, как раскрыто в WO 02/34048, а ссылка на фенхлоразол-этил также относится к фенхлоразолу и т.д.

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

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

В настоящем изобретении, кроме того, дополнительно предусмотрен способ контроля сорняков в месте произрастания, при этом указанный способ включает применение по отношению к месту произрастания достаточного для контроля сорняков количества композиции, содержащей соединение формулы (I). Более того, в настоящем изобретении дополнительно предусмотрен способ избирательного контроля сорняков в месте произрастания культурных растений и сорняков, где способ включает применение по отношению к месту произрастания достаточного для контроля сорняков количества композиции согласно настоящему изобретению. "Контроль" означает уничтожение, уменьшение или замедление роста или предупреждение или уменьшение прорастания. Обычно растениями, подлежащими контролю, являются нежелательные растения (сорняки). "Место произрастания" означает территорию, на которой растения произрастают или будут произрастать. Некоторые культурные растения могут быть от природы выносливыми к гербицидным эффектам соединений формулы (I). Однако в некоторых случаях может быть необходимым придать выносливость культурному растению искусственно, например, посредством генной инженерии. Таким образом, возможно, что культурному растению придать выносливость к ингиби-

торам HPPD с помощью генной инженерии. Способы придания культурным растениям выносливости к ингибиторам HPPD известны, например, из WO 0246387. Таким образом, в еще более предпочтительном варианте осуществления культурное растение является трансгенным в отношении полинуклеотида, содержащего последовательность ДНК, которая кодирует устойчивый к ингибитору HPPD HPPD-фермент, полученный из бактерии, более конкретно, из *Pseudomonas fluorescens* или *Shewanella colwelliana*, или из растения, более конкретно, полученный из однодольного растения или, еще более конкретно, из ячменя, маиса, пшеницы, риса, видов *Brachiaria*, *Cenchrus*, *Lolium*, *Festuca*, *Setaria*, *Eleusine*, *Sorghum* или *Avena*. Известно несколько выносливых по HPPD трансгенных "объектов" сои, и они включают, например, SYHT04R (WO2012/082542), SYHT0H2 (WO2012/082548) и FG72. Другие полинуклеотидные последовательности, которые можно применять для получения растений, которые являются выносливыми к соединениям по настоящему изобретению, раскрыты, например, в WO 2010/085705 и WO 2011/068567. Культурные растения, по отношению к которым можно применять композицию согласно настоящему изобретению, таким образом, включают сельскохозяйственные культуры, такие как зерновые, например ячмень и пшеница, хлопчатник, масличный рапс, подсолнечник, маис, рис, соя, сахарная свекла, сахарный тростник и газонная трава.

Культурные растения могут также включать деревья, такие как плодовые деревья, пальмовые деревья, кокосовые пальмы или другие орехоплодные культуры. Также включены выходящие растения, такие как виноград, плодовые кустарники, плодовые растения и овощи.

Нормы применения соединений формулы I могут изменяться в широких пределах и зависят от свойств почвы, способа применения (до или после появления всходов; протравливание семян; 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, согласно которым регулируют способ применения, время применения и целевую сельскохозяйственную культуру. Соединения формулы I согласно настоящему изобретению обычно 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 территорий, но также можно применять другие способы, такие как опыление (для порошков), капельный полив или орошение.

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

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

Также следует понимать, что культурные растения включают те, которые получены с помощью традиционных способов селекции или генной инженерии и обладают так называемыми привнесенными признаками (например, улучшенной стабильностью при хранении, более высокой питательной ценностью и улучшенным вкусом).

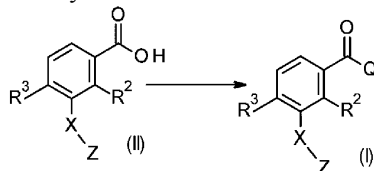
Другие полезные растения включают газонную траву, например на гольф-площадках, лужайках, в парках и на обочинах дороги или коммерчески выращиваемую для газона, и декоративные растения, такие как цветы или кустарники.

Композиции можно применять для контроля нежелательных растений (обобщенно "сорняков"). Сорняки, подлежащие контролю, могут представлять собой как виды однодольных растений, например *Agrostis*, *Alopecurus*, *Avena*, *Brachiaria*, *Bromus*, *Cenchrus*, *Cyperus*, *Digitaria*, *Echinochloa*, *Eleusine*, *Lolium*, *Monochoria*, *Rottboellia*, *Sagittaria*, *Scirpus*, *Setaria* и *Sorghum*, так и виды двудольных растений, например

Abutilon, Amaranthus, Ambrosia, Chenopodium, Chrysanthemum, Conyza, Galium, Ipomoea, Nasturtium, Sida, Sinapis, Solarium, Stellaria, Veronica, Viola и Xanthium. Сорняки также могут включать растения, которые можно считать культурными растениями, но которые произрастают за пределами посевной площади ("беглецы"), или которые произрастают из семян, оставшихся от предыдущего посева другой сельскохозяйственной культуры ("растения-самосевы"). Такие растения-самосевы или беглецы могут быть выносимыми в отношении некоторых других гербицидов.

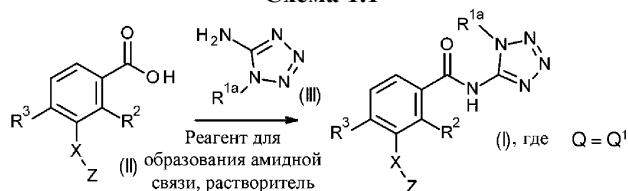
Соединения по настоящему изобретению можно получать в соответствии со следующими схемами.

Соединения формулы (I) можно получить из бензойных кислот формулы (II):



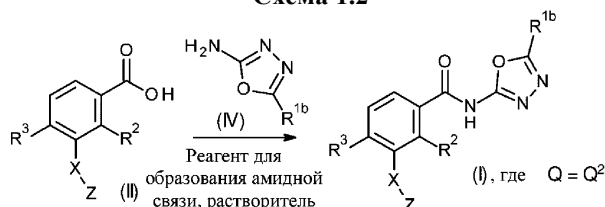
Как показано на схеме 1.1, если $Q=Q^1$, бензойную кислоту формулы (II) обрабатывают амином формулы (III) в присутствии подходящего реагента для образования амидной связи в подходящем растворителе. Примерами подходящих реагентов для образования амидной связи являются пропилфосфоновый ангидрид (ТЗР) и 1,1'-карбонилдиимидазол (CDI). Примерами подходящих растворителей являются дихлорметан и 1,4-диоксан.

Схема 1.1



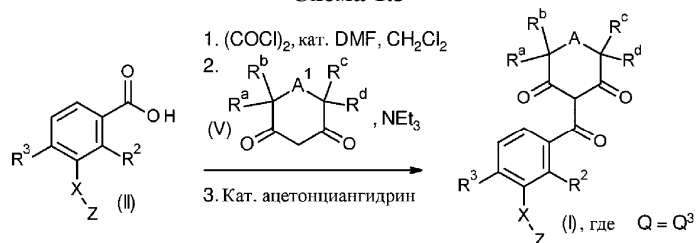
Как показано на схеме 1.2, если $Q=Q^2$, бензойную кислоту формулы (II) обрабатывают амином формулы (IV) в присутствии подходящего реагента для образования амидной связи в подходящем растворителе с получением соединения формулы (I), где $Q=Q^2$. Примерами подходящих реагентов для образования амидной связи являются пропилфосфоновый ангидрид (ТЗР) и 1,1'-карбонилдиимидазол (CDI). Примерами подходящих растворителей являются дихлорметан и 1,4-диоксан.

Схема 1.2



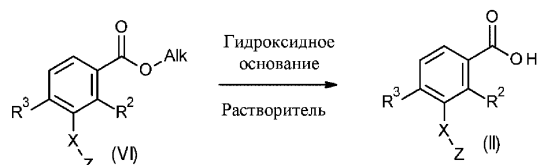
Как показано на схеме 1.3, если $Q=Q^3$, бензойную кислоту формулы (II) обрабатывают оксалилхлоридом и DMF в каталитическом количестве в дихлорметане. Сразу после завершения хлорирования затем к реакционной смеси добавляют триэтиламин и 1,3-дион формулы (V). Через примерно 1 час добавляют ацетонциангидрин в каталитическом количестве с получением соединения формулы (I), где $Q=Q^3$.

Схема 1.3



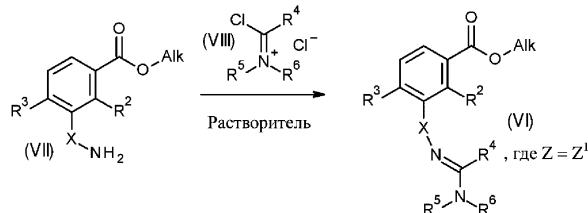
Бензойные кислоты формулы (II) можно получить из сложных эфиров формулы (VI), как показано на схеме 2, где "Alk" определен как C₁-C₆алкил, например метил или этил.

Схема 2



Сложный эфир формулы VI обрабатывают алкоксидным основанием, например гидроксидом натрия или гидроксидом лития, и подходящим растворителем. Двумя примерами подходящего растворителя являются: смесь этанол:вода 2:1 или смесь тетрагидрофуран:вода 2:1. Сложные эфиры формулы (VI) можно получать из разнообразных средств в зависимости от природы Z. Если $Z=Z^1$, сложные эфиры формулы (VI) можно получить из анилинов формулы (VII) и солей Вильсмайера формулы (VIII), как показано на схеме 3.

Схема 3



Некоторые соли Вильсмайера доступны коммерчески, такие как (хлорметилен)диметилиминия хлорид. Согласно схеме 3 амин формулы (VII) обрабатывают солью Вильсмайера формулы (VIII) в подходящем растворителе, например тетрагидрофуране.

Если $Z=Z^2$, соединения формулы (VI) можно получить из тиаминов формулы (IX), как показано на схеме 4.

Схема 4



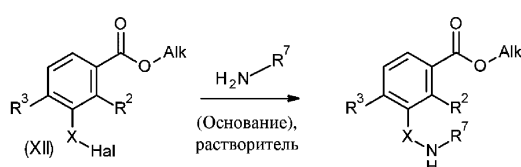
Тиамины формулы (IX) обрабатывают подходящим амином $\text{H}_2\text{N-R}^9$ в присутствии подходящей кислоты Льюиса и подходящего растворителя. Примером подходящей кислоты Льюиса является тетрафторборат серебра. Примером подходящего растворителя является тетрагидрофуран. Тиамины формулы (IX) можно получить из аминов формулы (X), как показано на схеме 5, где "Alk" представляет собой $\text{C}_1\text{-C}_6$ алкил, такой как метил или этил.

Схема 5



Как показано на схеме 5, амин формулы (X) обрабатывают подходящим сложным дитиоэфиром формулы (XI) и основанием в подходящем растворителе. Примером подходящего основания является триэтиламин. Примером подходящего растворителя является тетрагидрофуран. Амины формулы (X) можно получить путем алкилирования аминов формулы (VII). Такие способы алкилирования, например восстановительное аминирование, будут известны специалисту в данной области техники. В качестве альтернативы, амины формулы (X) можно получить путем аминирования галогенидов формулы (XII), как показано на схеме 6, где "Hal" представляет собой атом галогена, такой как хлор или бром.

Схема 6



Галогенид формулы (XII) обрабатывают подходящим амином $\text{H}_2\text{N-R}^7$ в подходящем растворителе, например тетрагидрофуране. В данной реакции можно применять основание. Алкилгалогениды формулы

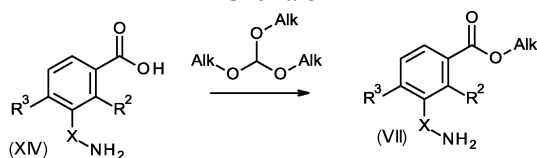
(XII) можно получить с помощью различных способов. Одним примером их получения, если $X=-CH_2-$, является бромирование метилзамещенных производных бензола формулы (XIII).

Схема 7



В данном примере подходящими условиями бромирования являются: N-бромсукцинимид в присутствии каталитического количества бензоилпероксида или азобисизобутиронитрила с применением CCl_4 или 1,2-дихлорэтана в качестве растворителя. Приведен синтез многих примеров соединения формулы (XIII). Примеры включают этил-2-хлор-3-метил-4-трифторметилбензоат и этил-2-хлор-3-метил-4-метилсульфонилбензоат. Синтез соединения формулы (VII) можно проводить из карбоновых кислот формулы (XIV) с помощью реакции эстерификации, как показано на схеме 8.

Схема 8



Соединения формулы (XIV) нагревают в подходящем сложном ортоэфире с получением соединений формулы (VII). Например, если $Alk=$ этил, применяют триэтилортоформат. Сложный ортоэфир можно применять как в качестве реагента, так и в качестве растворителя, если он представляет собой жидкость. Соединения формулы (XIV) могут быть известными из литературных источников или их можно легко получить из доступных исходных материалов. Примером соединения формулы (XIV) является 3-амино-2-метил-4-(метилсульфонил)бензойная кислота.

В следующих неограничивающих примерах представлены конкретные способы синтеза иллюстративных соединений по настоящему изобретению, указанных в таблицах, представленных в данном документе.

Пример получения 1. Соединение 1.025.

Оксалилдихлорид (1,20 г, 9,4 ммоль) добавляли по каплям к раствору DMF (0,34 г, 4,7 ммоль) в DCM (25 мл) при $0^\circ C$ (активное выделение пузырьков газа, затем образовывалась белая суспензия). Обеспечивали перемешивание реакционной смеси в течение 30 мин при комнатной температуре и затем ее концентрировали до сухого состояния с получением грязно-белого твердого вещества. Полученное суспендировали в дихлорметане (25 мл) и затем добавляли этил-3-амино-2-метил-4-метилсульфонилбензоат (600 мг, 2,33 ммоль) в виде раствора в DCM (2 мл). В течение нескольких секунд образовывался желтый раствор, который перемешивали в течение 10 мин. Реакционную смесь добавляли по каплям к перемешиваемому насыщ. раствору $NaHCO_3$ на ледяной бане и перемешивали в течение 10 мин (осторожно: выделение пузырьков газа). Органический слой отделяли, экстрагировали с помощью $CHCl_3:IPA$ (соотношение 7:3, 2×10 мл), затем высушивали и концентрировали *in vacuo*. Материал загружали на целит и очищали с помощью флэш-хроматографии. Колонка: 40 г диоксида кремния. Растворитель А: дихлорметан. Растворитель В: метанол. Градиент: 0-5% В в А на протяжении 15 мин. Начало элюирования при 2% В в А. Фракции, содержащие продукт, объединяли, и концентрировали *in vacuo*, и высушивали с получением этил-3-[(Е)-диметиламинометиленамино]-2-метил-4-метилсульфонилбензоата (665 мг, 2,13 ммоль) в виде желтого масла.

1H ЯМР (400 МГц, хлороформ) $\delta=7,88$ (d, $J=8,3$ Гц, 1H), 7,47 (d, $J=8,3$ Гц, 1H), 7,21 (s, 1H), 4,38 (q, $J=7,1$ Гц, 2H), 3,20 (s, 3H), 3,06 (br d, $J=14,8$ Гц, 6H), 2,33 (s, 3H), 1,40 (t, $J=7,2$ Гц, 3H).

К этил-3-[(Е)-диметиламинометиленамино]-2-метил-4-метилсульфонилбензоату (660 мг, 2,11 ммоль) в этаноле (12 мл) и воде (3,4 мл) добавляли моногидрат гидроксида лития (222 мг, 5,28 ммоль). Через 2 ч смесь концентрировали *in vacuo* с удалением этанола. Остаток поглощали в воде и регулировали pH водного раствора до 10 путем добавления избытка раствора аммиака (38% в воде). Данный раствор непосредственно очищали путем впрыска жидкости в колонку для флэш-хроматографии с обращенной фазой с применением колонки с C-18-AQ, 50 г. Растворитель А: вода+0,1% аммиака. Растворитель В: ацетонитрил+0,1% аммиака. Градиент: 0% на протяжении 3 объемов колонки, затем 0-50% В в А на протяжении 10 объемов колонки. Элюировали при 0% В в А. Фракции, содержащие продукт, объединяли и концентрировали *in vacuo*, затем материал растворяли в воде и высушивали сублимацией в течение ночи с получением 3-[(Е)-диметиламинометиленамино]-2-метил-4-метилсульфонилбензойной кислоты (496 мг, 1,75 ммоль в виде белого твердого вещества).

1H ЯМР (400 МГц, DMSO- d_6) $\delta=7,49$ (d, $J=8,1$ Гц, 1H), 7,30 (s, 1H), 6,94 (d, $J=8,1$ Гц, 1H), 3,16 (s,

3H), 2,97 (s, 6H), 2,15-2,04 (m, 3H).

В колбу, содержащую 3-[(Е)-диметиламинометиленамино]-2-метил-4-метилсульфонилбензойную кислоту (245 мг, 0,862 ммоль), добавляли безводный 1,4-диоксан (5 мл) и N,N'-карбонилдимидазол (210 мг, 1,29 ммоль). Смесь перемешивали при 100°C в течение 16 ч затем охлаждали до к. т. Добавляли 1-метилтетразол-5-амин (128 мг, 1,29 ммоль) и DBU (0,132 мл, 0,862 ммоль) и реакционную смесь перемешивали при 100°C в течение 3 дней. Затем добавляли дополнительную порцию 1-метилтетразол-5-амин (128 мг, 1,29 ммоль) и DBU (0,132 мл, 0,862 ммоль) и реакционную смесь перемешивали при 100°C в течение 2 ч. Обеспечивали охлаждение реакционной смеси и затем ее концентрировали *in vacuo*. К остатку добавляли воду (10 мл) и DCM (10 мл). Смесь разделяли и водную фазу экстрагировали с помощью CHCl₃:IPA (7:3, 2×10 мл). Органические фазы объединяли, высушивали над MgSO₄, фильтровали и концентрировали *in vacuo*. Материал загружали на целит и очищали с помощью флэш-хроматографии (от 0 до 10% MeOH/DCM) с получением 3-[(Е)-диметиламинометиленамино]-2-метил-4-метилсульфонил-N-(1-метилтетразол-5-ил)бензамида (136 мг, 0,372 ммоль) в виде белого твердого вещества.

¹H ЯМР (400 МГц, DMSO-d₆) δ=7,71 (d, J=8,2 Гц, 1H), 7,39 (s, 1H), 7,30 (d, J=8,2 Гц, 1H), 3,88 (s, 3H), 3,24 (s, 3H), 3,00 (s, 6H), 2,18 (s, 3H).

Пример получения 2. Соединение 1.130.

Добавляли 2-[3-фтор-4-(трифторметил)фенил]-4,4-диметил-5Н-оксазол (14 г, 51 ммоль) в 120 мл сухого THF в 4-горлую RBF объемом 500 мл, оснащенную термометром. Реакционную массу охлаждали до -74°C и затем по каплям добавляли n-бутиллитий в виде 2,0М раствора в гексане (36 мл, 71 ммоль). Перемешивали реакционную массу при приблизительно -74°C в течение еще 1,5 ч. К данному раствору затем добавляли раствор гексахлорэтана (8,8 мл, 77 ммоль) в 40,3 мл сухого THF при -70°C. Смесь перемешивали при приблизительно -70°C в течение 30 мин и затем обеспечивали ее отстаивание в течение 16 ч, после чего TLC продемонстрировала отсутствие исходного материала. Смесь выливали в охлажденный льдом 6 н. водн. раствор HCl (40,30 мл) и экстрагировали с помощью EtOAc (750 мл×3). Затем объединенные органические фазы промывали солевым раствором, высушивали над Na₂SO₄, фильтровали и концентрировали. Неочищенный продукт затем очищали с помощью колоночной хроматографии на основе силикагеля и необходимый продукт элюировали с помощью 4,0% EtOAc в гексане с получением 2-[2-хлор-3-фтор-4-(трифторметил)фенил]-4,4-диметил-5Н-оксазола (25 г, 28 ммоль).

К раствору tBuOK (15,4 г) в N,N-диметилацетамиде (96 мл) в RBF по каплям добавляли формамид (14,5 мл) и перемешивали. Через 15 мин добавляли раствор 2-[2-хлор-3-фтор-4-(трифторметил)фенил]-4,4-диметил-5Н-оксазола (16 г) в N,N-диметилацетамиде (38 мл). Затем смесь нагревали до 120°C в течение 2 ч. Реакционную массу затем охлаждали до комнатной температуры и затем выливали в ледяную воду (160 мл) и экстрагировали с помощью 30% раствора EtOAc в MTBE (160 мл×4). Объединенные органические слои промывали солевым раствором, высушивали над Na₂SO₄, фильтровали и концентрировали при высоком вакууме. Наконец, неочищенный продукт растирали в порошок с 5% раствором Et₂O в гексане с получением необходимого продукта, N-[2-хлор-3-(4,4-диметил-5Н-оксазол-2-ил)-6-(трифторметил)фенил]формамида (16,8 г), в виде грязно-белого твердого вещества.

N-[2-хлор-3-(4,4-диметил-5Н-оксазол-2-ил)-6-(трифторметил)фенил]формамид (12 г, 37 ммоль) поглощали в 52,2 мл концентрированной хлористоводородной кислоты в rbf и смесь нагревали с обратным холодильником. Через 4 ч смесь охлаждали на ледяной бане, и полученное твердое вещество отфильтровывали, и остаток промывали холодной водой, и затем высушивали при высоком вакууме с получением 3-амино-2-хлор-4-(трифторметил)бензойной кислоты (9,0 г) в виде твердого вещества.

¹H ЯМР (d₆-DMSO): 7,44 (1H, d), 6,92 (1H, d), 5,90 (2H, brs).

К раствору 3-амино-2-хлор-4-(трифторметил)бензойной кислоты (16 г, 58 ммоль) в 78 мл DMF в RBF добавляли 8,36 карбоната калия и перемешивали при к. т. в течение 15 мин. К полученному затем добавляли 23,4 мл йодэтана и перемешивали при к. т. в течение 2 ч. Контролировали с помощью TLC и HPLC и реакцию завершали. Реакционную смесь разбавляли с помощью 750 мл холодной воды и экстрагировали с помощью TBME (250 мл×2). Объединенные слои на основе TBME промывали водн. раствором Na₂S₂O₃, затем солевым раствором, высушивали над Na₂SO₄, фильтровали и концентрировали с получением этил-3-амино-2-хлор-4-(трифторметил)бензоата (8 г, 27 ммоль) в виде черной жидкости.

Оксалилдихлорид (0,49 г, 0,34 мл, 3,8 ммоль) добавляли по каплям к бесцветному раствору N-метил-N-(2,2,2-трифторэтил)формамида (268 мг, 1,9 ммоль) в дихлорметане (12 мл). Обеспечивали перемешивание реакционной смеси в течение 30 мин (образовывался желтый раствор) и затем ее концентрировали до сухого состояния с получением оранжевого масла. Полученное растворяли в дихлорметане (5 мл) и затем добавляли этил-3-амино-2-хлор-4-(трифторметил)бензоат (250 мг, 0,934 ммоль) в виде раствора в DCM (1 мл). Образовывалась желтая суспензия. Реакционную смесь перемешивали в течение 5 мин и анализ с помощью LCMS продемонстрировал, что реакция завершилась. Реакционную смесь добавляли по каплям к перемешиваемому насыщ. раствору NaHCO₃ (10 мл) на ледяной бане и перемешивали в течение 5 мин (осторожно: выделение пузырьков газа). Органический слой отделяли и водный слой второй раз экстрагировали дихлорметаном (10 мл). LCMS продемонстрировала наличие продукта в водном слое. Экстракция с помощью CHCl₃:IPA (7:3, 10 мл) успешно обеспечила экстракцию продукта

из водного слоя. Материал очищали с помощью флэш-хроматографии (от 0 до 100% EtOAc/изогексан) с получением этил-2-хлор-3-[(Е)-[метил(2,2,2-трифторэтил)амино]метиленамино]-4-(трифторметил)бензоата (330 мг, 0,845 ммоль) в виде бесцветного масла. ЯМР продемонстрировал наличие двух ротамеров.

^1H ЯМР (400 МГц, хлороформ) δ =7,53 (br d, J =8,1 Гц, 2H), 7,45-7,30 (m, 4H), 4,41 (q, J =7,2 Гц, 4H), 4,20 (q, J =8,9 Гц, 2H), 3,77 (q, J =8,4 Гц, 2H), 3,24-3,18 (m, 1H), 3,18-3,11 (m, 1H), 3,18 (br d, J =16,1 Гц, 4H), 1,40 (t, J =7,2 Гц, 6H).

К перемешиваемому раствору этил-2-хлор-3-[(Е)-[метил(2,2,2-трифторэтил)амино]метиленамино]-4-(трифторметил)бензоата (320 мг, 0,819 ммоль) в этаноле (5 мл) и воде (1,5 мл) добавляли моногидрат гидроксида лития (86 мг, 2,05 ммоль) и реакционную смесь перемешивали при комнатной температуре в течение 30 мин. Реакционную смесь концентрировали *in vacuo* с удалением EtOH. Смесь разбавляли с помощью DCM (10 мл) и затем промывали с помощью 10% вес/об, лимонной кислоты в воде (10 мл). Водную фазу дополнительно экстрагировали с помощью CHCl_3 :IPA (соотношение 7:3, 10 мл). LCMS продемонстрировала только следовое количество продукта, присутствующего в водной фазе. Органический слой высушивали над MgSO_4 , фильтровали и концентрировали *in vacuo* с получением 2-хлор-3-[(Е)-[метил(2,2,2-трифторэтил)амино]метиленамино]-4-(трифторметил)бензойной кислоты (250 мг, 0,689 ммоль) в виде желтого масла.

^1H ЯМР (400 МГц, хлороформ) δ =7,56 (d, J =4,2 Гц, 4H), 7,38 (br d, J =5,5 Гц, 2H), 4,21 (q, J =8,9 Гц, 2H), 3,85-3,75 (m, 2H), 3,19 (m, 6H).

В колбу, содержащую 2-хлор-3-[(Е)-[метил(2,2,2-трифторэтил)амино]метиленамино]-4-(трифторметил)бензойную кислоту (125 мг, 0,345 ммоль), добавляли безводный 1,4-диоксан (3 мл) и CDI (84 мг, 0,52 ммоль). Смесь перемешивали при 100°C в течение 45 мин, затем охлаждали до к. т. К реакционной смеси добавляли 1-метилтетразол-5-амин (51 мг, 0,52 ммоль) и DBU (52 мкл, 0,34 ммоль). Реакционную смесь нагревали при 100°C в течение 16 ч. Реакционную смесь концентрировали *in vacuo*. Неочищенный материал разбавляли с помощью CH_2Cl_2 (10 мл) и промывали водным раствором бикарбоната натрия (10 мл). Водную фазу дополнительно экстрагировали с помощью CHCl_3 :IPA (10 мл, 7:3). Органические фазы объединяли и высушивали над MgSO_4 , фильтровали и концентрировали *in vacuo*. Материал загружали на целит и очищали с помощью флэш-хроматографии (от 0 до 10% MeOH в CH_2Cl_2). Фракции, содержащие продукт, объединяли и концентрировали *in vacuo* с получением 2-хлор-N-(1-метилтетразол-5-ил)-3-[(Е)-[метил(2,2,2-трифторэтил)амино]метиленамино]-4-(трифторметил)бензамида (66 мг, 0,15 ммоль) в виде стеклообразного твердого вещества.

^1H ЯМР (400 МГц, хлороформ) δ =11,21 (br s, 1H), 7,65-7,56 (m, 2H), 7,36 (br d, J =7,9 Гц, 1H), 4,21 (q, J =9,0 Гц, 0,9H), 4,12 (s, 3H), 3,84 (q, J =8,4 Гц, 1,1H), 3,21 (s, 3H) (примечания: на ЯМР-спектре присутствуют ротамеры).

Пример получения 3. Соединение 1.132.

Оксалилдихлорид (0,49 г, 0,34 мл, 3,8 ммоль) добавляли по каплям к бесцветному раствору пирролидин-1-карбальдегида (0,18 мл, 1,9 ммоль) в дихлорметане (4 мл). Обеспечивали перемешивание реакционной смеси в течение 30 мин (образовывался желтый раствор) и затем ее концентрировали до сухого состояния с получением оранжевого твердого вещества. Полученное растворяли в дихлорметане (5 мл) и затем добавляли этил-3-амино-2-хлор-4-(трифторметил)бензоат (250 мг, 0,934 ммоль) в виде раствора в дихлорметане (1 мл). Образовывалась желтая суспензия. Реакционную смесь перемешивали в течение 10 мин и анализ с помощью LCMS продемонстрировал, что реакция завершилась. Реакционную смесь добавляли по каплям к перемешиваемому насыщенному раствору NaHCO_3 (10 мл) на ледяной бане и перемешивали в течение 5 мин. Органический слой отделяли и водный слой второй раз экстрагировали дихлорметаном (10 мл), затем с помощью CHCl_3 :IPA (7:3, 10 мл). Реакционную смесь высушивали над MgSO_4 , фильтровали и концентрировали *in vacuo*. Материал очищали с помощью флэш-хроматографии (от 0 до 20% EtOAc/изогексан) с получением этил-2-хлор-3-[(Е)-пирролидин-1-илметиленамино]-4-(трифторметил)бензоата (296 мг, 0,849 ммоль) в виде бесцветного масла.

^1H ЯМР (400 МГц, хлороформ) δ =7,50 (d, J =8,3 Гц, 2H), 7,29 (dd, J =0,6, 8,1 Гц, 1H), 4,41 (q, J =7,2 Гц, 2H), 3,63-3,45 (m, 4H), 1,99 (br dd, J =5,9, 14,1 Гц, 4H), 1,40 (t, J =7,2 Гц, 3H).

К перемешиваемому раствору этил-2-хлор-3-[(Е)-пирролидин-1-илметиленамино]-4-(трифторметил)бензоата (296 мг, 0,849 ммоль) в этаноле (4,8 мл) и воде (1,4 мл) добавляли моногидрат гидроксида лития (89 мг, 2,12 ммоль) и реакционную смесь перемешивали при комнатной температуре в течение 2 ч. Реакционную смесь концентрировали *in vacuo* с удалением этанола. Смесь разбавляли водой (2 мл) и добавляли по каплям раствор аммиака (38% в воде) до достижения водным раствором pH 10. Материал очищали с помощью хроматографии с обращенной фазой (от 0 до 12% ацетонитрила +0,1% NH_3 /вода+0,1% NH_3). Фракции, содержащие продукт, объединяли и концентрировали *in vacuo* с получением 2-хлор-3-[(Е)-пирролидин-1-илметиленамино]-4-(трифторметил)бензойной кислоты (242 мг, 0,755 ммоль) в виде бесцветных кристаллов.

^1H ЯМР (400 МГц, DMSO- d_6) δ =7,69 (s, 1H), 7,47 (d, J =8,2 Гц, 1H), 7,06 (d, J =7,9 Гц, 1H), 3,57-3,29 (m, 4H), 2,00-1,78 (m, 4H).

В колбу, содержащую 2-хлор-3-[(Е)-пирролидин-1-илметиленамино]-4-(трифторметил)бензойную кислоту (110 мг, 0,343 ммоль), добавляли безводный 1,4-диоксан (3 мл) и CDI (83 мг, 1,5 экв., 0,515 ммоль). Смесь перемешивали при 100°C в течение 1 ч, затем охлаждали до комнатной температуры. К реакционной смеси добавляли вторую партию CDI (83 мг, 1,5 экв., 0,515 ммоль). Реакционную смесь перемешивали при 100°C в течение 1 ч.

К реакционной смеси добавляли DBU (52 мл, 1 экв., 0,343 ммоль) и 1-метилтетразол-5-амин (51 мг, 1,5 экв., 0,515 ммоль) и реакционную смесь перемешивали при 100°C в течение 18 ч.

Реакционную смесь концентрировали *in vacuo*. Неочищенный материал разбавляли с помощью CH_2Cl_2 (10 мл) и промывали водным раствором бикарбоната натрия (10 мл). Водную фазу дополнительно экстрагировали с помощью CHCl_3 :IPA (10 мл, 7:3). Органические фазы объединяли и высушивали над MgSO_4 , фильтровали и концентрировали *in vacuo*. Материал загружали на целит и очищали с помощью флэш-хроматографии (от 0 до 5% MeOH в CH_2Cl_2). Фракции, содержащие продукт, объединяли и концентрировали *in vacuo* с получением 2-хлор-N-(1-метилтетразол-5-ил)-3-[(Е)-пирролидин-1-илметиленамино]-4-(трифторметил)бензамида (47 мг, 0,12 ммоль) в виде белого твердого вещества.

^1H ЯМР (400 МГц, хлороформ) δ =10,46 (br s, 1H), 7,58 (d, J=8,2 Гц, 1H), 7,49 (s, 1H), 7,30 (d, J=7,8 Гц, 1H), 4,09 (s, 3H), 3,63 (br s, 2H), 3,53 (br t, J=6,4 Гц, 2H), 2,11-1,94 (m, 4H).

Пример получения 4. Соединение 4.033.

(Исходный материал из примера получения 7).

К раствору этил-2-хлор-3-[[этанттиоил(метил)амино]метил]-4-метилсульфонилбензоата (100 мг, 0,275 ммоль) в ацетонитриле (5 мл) добавляли триэтиламин (0,39 мл, 2,7 ммоль), цианамид (58 мг, 1,4 ммоль) и тетрафторборат серебра (270 мг, 1,37 ммоль). Реакционную смесь перемешивали в течение 16 ч в течение ночи при к. т. Раствор фильтровали и затем концентрировали *in vacuo*. Остаток растворяли в EtOAc (20 мл) и промывали раствором карбоната калия (20 мл), соевым раствором (20 мл), высушивали над сульфатом магния и концентрировали *in vacuo*. Продукт очищали с помощью колоночной флэш-хроматографии (0-100% EtOAc/изогексан) с получением этил-2-хлор-3-[[[N-циано-С-метилкарбонимидоил]метиламино]метил]-4-метилсульфонилбензоата (77 мг, 0,21 ммоль). Анализ с помощью ЯМР продемонстрировал существование необходимого продукта в виде смеси изомеров (~1:7).

^1H ЯМР (500 МГц, Хлороформ) δ =8,16 (d, J=8,2 Гц, 1H), 7,83 (d, J=8,2 Гц, 1H), 5,29 (s, 2H), 4,46 (q, J=7,2 Гц, 2H), 3,20 (s, 2,65H), 3,10 (s, 0,35H), 2,91 (s, 2,65H), 2,79 (s, 0,35H), 2,66 (s, 0,35H), 2,45 (s, 2,65H), 1,43 (t, J=7,1 Гц, 3H).

К раствору этил-2-хлор-3-[[[N-циано-С-метилкарбонимидоил]метиламино] метил]-4-метилсульфонилбензоата (77 мг, 0,19 ммоль) в THF (2 мл) и воде (2 мл) добавляли моногидрат гидроксида лития (24 мг, 0,56 ммоль). Реакционную смесь перемешивали при комнатной температуре в течение 30 мин. Смесь подкисляли с помощью 2 н. HCl до pH ~2. Смесь экстрагировали с помощью EtOAc (x3) с повторным подкислением водного слоя в каждом случае для поддержания pH ~2. Объединенные органические вещества высушивали путем пропускания через разделитель фаз и затем концентрировали *in vacuo*. Получали 2-хлор-3-[[[N-циано-С-метилкарбонимидоил]метиламино]метил]-4-метилсульфонилбензойную кислоту (51 мг, 0,14 ммоль) в виде твердого вещества.

Раствор 2-хлор-3-[[[(Z)-N-циано-С-метилкарбонимидоил]метиламино]метил]-4-метилсульфонилбензойной кислоты (54 мг, 0,16 ммоль), 1-метил-1Н-тетразол-5-амин (0,20 ммоль, 21 мг) и DMAP (0,47 ммоль, 58 мг) в CH_2Cl_2 (1,5 мл) перемешивали при к. т. в течение 1 ч. К реакционной смеси добавляли пропилфосфоновый ангидрид (50% вес. в этилацетате, 0,94 ммоль, 0,56 мл), и переносили ее в сосуд для микроволновой обработки, и нагревали в микроволновой печи до 100°C в течение 30 мин. Реакционную смесь концентрировали *in vacuo* с получением оранжевого масла и затем растворяли в EtOAc (25 мл). Органическое вещество промывали водой (осторожно подкисляли до pH ~4) и водный слой дополнительно экстрагировали с помощью EtOAc (x2). Объединенные органические вещества промывали соевым раствором, высушивали над сульфатом магния и концентрировали *in vacuo*. Остаток очищали с помощью препаративной HPLC с обращенной фазой с получением 2-хлор-3-[[[(Z)-N-циано-С-метилкарбонимидоил]метиламино]метил]-4-метилсульфонил-N-(1-метилтетразол-5-ил)бензамида (8,5 мг, 0,018 ммоль) в виде бесцветного масла. Анализ с помощью ЯМР продемонстрировал существование необходимого продукта в виде смеси изомеров (~2:1, не установлено).

^1H ЯМР (400 МГц, Метанол) δ =8,29-8,22 (m, 1H), 7,99-7,88 (m, 1H), 5,37 (s, 2H), 4,06 (s, 3H), 3,93 (s, 1H), 2,95 (s, 2H), 2,83-2,78 (m, 1H), 2,68-2,65 (m, 1H), 2,47 (s, 2H). Примечание: 2H не наблюдали (скрыт остаточным пиком метанола при 3,30 ppm).

Пример получения 5. Соединение 2.049.

Оксалилдихлорид (0,67 г, 0,46 ммоль) добавляли по каплям к раствору N,N-диметилформамида (0,20 мл, 2,6 ммоль) в дихлорметане (3,8 мл) при 0°C. Наблюдали активное выделение пузырьков газа, затем образовывалась белая суспензия. Обеспечивали перемешивание реакционной смеси в течение 30 мин при комнатной температуре и затем ее концентрировали до сухого состояния с получением грязно-белого твердого вещества. Данное твердое вещество суспендировали в дихлорметане (5 мл) и затем добавляли этил-3-амино-2-хлор-4-(трифторметил)бензоат (350 мг, 1,31 ммоль) в виде раствора в дихлорметане (2 мл). В течение нескольких секунд образовывался желтый раствор, который перемешивали в течение 10 мин. Реакционную смесь добавляли по каплям к перемешиваемому насыщ. раствору NaHCO₃ на ледяной бане и перемешивали в течение 10 мин (осторожно: выделение пузырьков газа). Органический слой отделяли, снова экстрагировали дихлорметаном (10 мл), затем CHCl₃:IPA (соотношение 7:3, 10 мл), затем объединенные органические слои высушивали (MgSO₄) и концентрировали *in vacuo*. Материал загружали на целит и очищали с помощью флэш-хроматографии. Колонка: 24 г диоксида кремния. Растворитель А: изогексан. Растворитель В: этилацетат. Градиент: 0-50% В в А в течение 15 мин. Фракции, содержащие продукт, объединяли и концентрировали *in vacuo* с получением этил-2-хлор-3-[(Е)-диметиламинометиленамино]-4-(трифторметил)бензоата (319 мг, 0,989 ммоль) в виде желтого масла.

¹H ЯМР (400 МГц, хлороформ) δ=7,50 (d, J=8,2 Гц, 1H), 7,34-7,28 (1H, 2H), 4,41 (q, J=7,1 Гц, 2H), 3,05 (br d, J=8,8 Гц, 6H), 1,40 (t, J=7,2 Гц, 3H).

К перемешиваемому раствору этил-2-хлор-3-[(Е)-диметиламинометиленамино]-4-(трифторметил)бензоата (300 мг, 0,930 ммоль) в этаноле (5 мл) и воде (1,5 мл) добавляли моногидрат гидроксида лития (98 мг, 2,3 ммоль). После перемешивания при к. т. в течение 2 ч смесь концентрировали *in vacuo*. Материал поглощали в воде (10 мл) и регулировали pH водного раствора до 10 путем добавления избытка раствора аммиака (38% в воде). Полученное непосредственно очищали с помощью флэш-хроматографии с обращенной фазой. Колонка: C-18-AQ (50 г). Растворитель А: вода+0,1% аммиака. Растворитель В: ацетонитрил+0,1% аммиака. Градиент: 0% на протяжении 3 объемов колонки, затем 0-50% В в А на протяжении 10 объемов колонки. Элюировали при 5% В в А. Необходимые фракции концентрировали и высушивали сублимацией с получением 2-хлор-3-[(Е)-диметиламинометиленамино]-4-(трифторметил)бензойной кислоты (280 мг, 274 ммоль) в виде белого твердого вещества.

¹H ЯМР (400 МГц, DMSO-d₆) δ=7,42 (s, 1H), 7,34 (d, J=8,1 Гц, 1H), 6,85 (d, J=7,9 Гц, 1H), 3,05-2,87 (m, 6H).

В колбу, содержащую 2-хлор-3-[(Е)-диметиламинометиленамино]-4-(трифторметил)бензойную кислоту (270 мг, 0,916 ммоль), добавляли безводный 1,4-диоксан (8 мл) и N,N'-карбонилдиимидазол (223 мг, 1,37 ммоль). Добавляли DBU (0,140 мл, 0,916 ммоль) и 5-метил-1,3,4-оксадиазол-2-амин (136 мг, 1,37 ммоль) и смесь нагревали при 100°C в течение 16 ч. Материал охлаждали до к. т. и концентрировали *in vacuo*. Добавляли насыщенный раствор бикарбоната натрия (10 мл) и DCM (10 мл) и слои разделяли. Водный слой экстрагировали с помощью DCM (10 мл) и CHCl₃:IPA (7:3, 10 мл). Объединенные органические слои высушивали над MgSO₄, фильтровали и концентрировали *in vacuo*. Материал загружали на целит и очищали с помощью флэш-хроматографии. 24 г диоксида кремния. Растворитель А: дихлорметан. Растворитель В: метанол. Градиент: 0-10% В в А в течение 25 мин. Фракции, содержащие продукт, объединяли и концентрировали *in vacuo* с получением 2-хлор-3-[(Е)-диметиламинометиленамино]-N-(5-метил-1,3,4-оксадиазол-2-ил)-4-(трифторметил)бензамида (75 мг, 0,20 ммоль) в виде белого твердого вещества.

¹H ЯМР (400 МГц, DMSO-d₆) δ=7,60-7,50 (m, 2H), 7,18-7,11 (m, 1H), 3,02 (s, 3H), 2,98-2,90 (m, 3H), 2,46-2,33 (m, 3H).

Пример получения 6. Соединение 3.129.

В сухую колбу добавляли этил-3-(бромметил)-2-хлор-4-метилсульфонилбензоат (2,7 г, 7,6 ммоль), карбонат калия (1, г, 9,1 ммоль) и безводный ацетонитрил (41 мл). Реакционную смесь продували и помещали в атмосферу азота. К реакционной смеси по каплям добавляли суспензию N'-гидрокси-N,N-диметилацетамида (0,85 г, 8,4 ммоль) в безводном ацетонитриле (20 мл) и реакционную смесь перемешивали при комнатной температуре в течение 13 дней. Добавляли дополнительную порцию N'-гидрокси-N,N-диметилацетамида (0,16 г, 1,5 ммоль) и карбоната калия (0,21 г, 1,5 ммоль) и реакционную смесь перемешивали при к. т. в течение дополнительного дня. Реакционную смесь разбавляли дихлорметаном (50 мл) и к реакционной смеси добавляли воду (10 мл). Фазы разделяли и органическую фазу пропускали через картридж для разделения фаз и концентрировали *in vacuo* с получением желтого масла. Неочищенный материал очищали с помощью флэш-хроматографии (растворитель А = гексан, растворитель В = этилацетат) с градиентом 0-50% этилацетата с получением необходимого продукта, этил-2-хлор-3-[(Z)-1-(диметиламино)этилиденамино]оксиметил-4-метилсульфонилбензоата (1,56 г, 4,13 ммоль), в виде желтого масла.

¹H ЯМР (400 МГц, хлороформ) δ=8,11 (d, J=8,3 Гц, 1H), 7,73 (d, J=8,3 Гц, 1H), 5,56 (s, 2H), 4,55-4,33 (m, 2H), 3,39 (s, 3H), 2,73 (s, 6H), 1,94 (s, 3H), 1,42 (t, J=7,2 Гц, 3H).

К перемешиваемому раствору этил-2-хлор-3-[[[(Z)-1-(диметиламино)этилиденамино]оксиметил]-4-метилсульфонилбензоата (1,5 г, 4,0 ммоль) в этаноле (23 мл) и воде (6,4 мл) добавляли моногидрат гидроксида лития (0,42 г, 9,9 ммоль), добавляли к реакционной смеси и ее перемешивали при комнатной температуре в течение 16 ч. Реакционную смесь концентрировали *in vacuo* с удалением этанола. Неочищенный материал подкисляли с помощью 2 н. HCl до pH 3 и затем добавляли водный раствор аммиака до достижения pH, составляющего pH 10. Данную смесь загружали в колонку с обращенной фазой (высокий pH), которая была уравновешена с помощью 0,1% раствора аммиака в воде и ацетонитриле. Образец загружали в виде жидкости в уравновешенную колонку и элюировали с применением 0% ацетонитрила в воде (0,1% NH₃) до выхода фронта растворителя, затем градиентом от 0 до 50% ацетонитрила в воде (0,1% NH₃) до элюирования продукта (примерно 30%). Материал поглощали в минимальном количестве воды и очень небольшом количестве ацетонитрила и высушивали сублимацией в течение ночи. Получали продукт, 2-хлор-3-[[[(Z)-1-(диметиламино)этилиденамино]оксиметил]-4-метилсульфонилбензойную кислоту (1,31 г, 3,76 ммоль), в виде грязно-белого твердого вещества.

¹H ЯМР (400 МГц, DMSO-d₆) δ=7,84 (d, J=8,1 Гц, 1H), 7,43 (d, J=8,1 Гц, 1H), 7,36-7,21 (m, 1H), 5,35 (s, 2H), 3,37 (s, 3H), 2,69 (s, 6H), 1,88 (s, 3H).

К раствору 2-хлор-3-[[[(Z)-1-(диметиламино)этилиденамино]оксиметил]-4-метилсульфонилбензойной кислоты (500 мг, 1,43 ммоль) в дихлорметане (7,5 мл) добавляли DMF (0,011 мл, 0,14 ммоль). Реакционную смесь продували и помещали в атмосферу азота. Добавляли по каплям оксалилхлорид (0,24 мл, 0,96 ммоль); при добавлении происходило выделение пузырьков газа и образовывался красный твердый осадок. Реакционную смесь перемешивали при комнатной температуре в течение 1 ч и она становилась розово-красной суспензией. Реакционную смесь концентрировали *in vacuo* с получением розового пенообразного твердого вещества и остаток растворяли в дихлорметане (7,5 мл). Реакционную смесь охлаждали до 0°C в атмосфере азота и через 5 мин добавляли по каплям триэтиламин (0,81 мл, 0,734 ммоль) с последующим добавлением одной порцией циклогексан-1,3-диона (161 мг, 1,43 ммоль). Обеспечивали нагревание реакционной смеси до к. т. в течение 1 ч. К реакционной смеси добавляли ацетонциангидрин (0,33 мл, 0,36 ммоль). Реакционную смесь перемешивали при комнатной температуре в течение ночи. Реакционную смесь концентрировали *in vacuo* и затем неочищенный материал загружали на целит и очищали с помощью флэш-хроматографии с применением системы растворителей толуол/1,4-диоксан/этанол/триэтиламин/вода 10:4:2:2:0,5. Неочищенный материал (темно-зеленое масло) разбавляли дихлорметаном (10 мл) и промывали с помощью 10% вес./об. раствора лимонной кислоты (10 мл). Органическую фазу высушивали над MgSO₄, фильтровали и концентрировали *in vacuo* с получением N'-[[2-хлор-3-(2,6-диоксоциклогексанкарбонил)-6-метилсульфонилфенил]метокси]-N,N-диметилацетамида (114 мг, 0,527 ммоль) в виде желтого масла (114 мг).

¹H ЯМР (CDCl₃): 8,12 (d, J=8,1 Гц, 1H), 5,54 (s, 2H), 3,37 (s, 3H), 2,81 (t, J=6,4 Гц, 2H), 2,73 (s, 6H), 2,44 (t, J=6,4 Гц, 2H), 2,13-2,02 (m, 2H), 1,92 (s, 3H).

Пример получения 7. Соединение 4.016.

К раствору метиламина (2М в THF, 55 мл, 109 ммоль) добавляли по каплям этил-3-(бромметил)-2-хлор-4-метилсульфонилбензоат (2,43 г, 6,83 ммоль) в ацетонитриле (13,7 мл). Реакционную смесь перемешивали при комнатной температуре в течение 10 мин. Анализ с помощью LCMS продемонстрировал образование продукта и отсутствие оставшегося исходного материала. Реакционную смесь концентрировали *in vacuo* и затем разбавляли с помощью DCM (250 мл). Органическое вещество промывали насыщ. раствором K₂CO₃ (100 мл), соевым раствором (100 мл) и концентрировали *in vacuo* с получением этил-2-хлор-3-(метиламинометил)-4-метилсульфонилбензоата (2,08 г, 6,46 ммоль) в виде бесцветного масла.

¹H ЯМР (400 МГц, хлороформ) δ=8,10 (d, J=8,2 Гц, 1H), 7,71 (d, J=8,3 Гц, 1H), 4,44 (q, J=7,1 Гц, 2H), 4,33 (s, 2H), 3,37 (s, 3H), 2,55 (s, 3H), 1,42 (t, J=7,1 Гц, 3H).

К раствору этил-2-хлор-3-(метиламинометил)-4-метилсульфонилбензоата (500 мг, 1,55 ммоль), 4-диметиламинопиридина (19,4 мг, 0,155 ммоль) и триэтиламина (318 мг, 0,437 мл, 3,11 ммоль) в тетрагидрофуране (13,8 г, 15,5 мл) добавляли по каплям этилдитиоацетат (381 мг, 0,364 мл, 3,11 ммоль). При осуществлении реакции применяли оборудование, оснащенное обратным холодильником, реакционную смесь перемешивали и нагревали до 50°C в течение 10 дней. Анализ с помощью LCMS продемонстрировал образование продукта, но также присутствие оставшегося исходного материала. Реакционную смесь охлаждали до комнатной температуры и затем концентрировали *in vacuo* с удалением THF. Смесь разбавляли с помощью EtOAc (50 мл) и промывали водой (50 мл × 2), соевым раствором (50 мл) и концентрировали *in vacuo*. Продукт очищали с помощью колоночной флэш-хроматографии (0-60% EtOAc/изогексан) с получением этил-2-хлор-3-[[этанттиоил(метил)амино]метил]-4-метилсульфонилбензоата (217 мг, 0,596 ммоль) в виде коричневой смолы.

¹H ЯМР (400 МГц, хлороформ) δ=8,23-8,14 (m, 1H), 7,89-7,80 (m, 1H), 5,79 (br s, 2H), 4,46 (q, J=7,2 Гц, 2H), 3,20 (s, 2,6H), 3,15 (s, 0,4H), 3,10 (s, 0,4H), 2,99 (s, 2,6H), 2,94-2,91 (1H, 0,4H), 2,71 (s, 2,6H), 1,42 (t, J=7,2 Гц, 3H).

К раствору этил-2-хлор-3-[[этанттиоил(метил)амино]метил]-4-метилсульфонилбензоата (120 мг, 0,330 ммоль) в ацетонитриле (3,89 г, 4,95 мл, 94,2 ммоль) добавляли триэтиламин (337 мг, 0,464 мл, 3,30

ммоль), гидрохлорид О-метилгидроксиламина (141 мг, 1,65 ммоль) и тетрафторборат серебра (0,3242 г, 1,65 ммоль). Реакционную смесь перемешивали в течение ночи при комнатной температуре. Анализ с помощью LCMS продемонстрировал образование продукта и отсутствие оставшегося исходного материала. Раствор фильтровали через слой диоксида кремния с удалением осадка серебра и промывали с помощью MeCN (20 мл). Смесь концентрировали *in vacuo* с удалением MeCN. Остаток растворяли в EtOAc (20 мл) и промывали водой (20 мл), соевым раствором (20 мл), высушивали над сульфатом магния и концентрировали *in vacuo*. Продукт очищали с помощью колоночной флэш-хроматографии (0-50% EtOAc/изогексан) с получением этил-2-хлор-3-[[[N-метокси-С-метилкарбонимидоил]метиламино]метил]-4-метилсульфонилбензоата (90 мг, 0,239 ммоль) в виде коричневой смолы.

¹H ЯМР (400 МГц, хлороформ) δ=8,13 (d, J=8,2 Гц, 1H), 7,70 (d, J=8,2 Гц, 1H), 4,94 (s, 2H), 4,45 (q, J=7,2 Гц, 2H), 3,71 (s, 3H), 3,20 (s, 3H), 2,61 (s, 3H), 2,05 (s, 3H), 1,42 (t, J=7,2 Гц, 3H).

К раствору этил-2-хлор-3-[[[N-метокси-С-метилкарбонимидоил]метиламино]метил]-4-метилсульфонилбензоата (95 мг, 0,252 ммоль) в тетрагидрофуране (1,69 г, 1,90 мл, 23,4 ммоль) и воде (1,9 г, 1,9 мл, 0,106 ммоль) добавляли гидроксид лития (53,9 мг, 2,25 ммоль). Реакционную смесь перемешивали при комнатной температуре в течение 30 мин. Анализ с помощью LCMS продемонстрировал образование продукта. Смесь частично концентрировали *in vacuo* с удалением тетрагидрофурана. Полученный водный раствор разбавляли водой (1 мл) и подкисляли с помощью нескольких капель 2 М HCl до pH ~2. Затем повышали основность смеси с помощью водного раствора NH₃ до pH ~9. Полученный раствор загружали на колонку с обращенной фазой и очищали с применением хроматографии с обращенной фазой (0-20% MeCN в H₂O, содержащей 0,1% NH₃). Полученные из колонки фракции, содержащие продукт, объединяли и концентрировали с применением сублимационной сушилки в течение выходных дней с получением 2-хлор-3-[[[N-метокси-С-метилкарбонимидоил]метиламино]метил]-4-метилсульфонилбензойной кислоты (84 мг, 0,229 ммоль) в виде желтой смолы.

Раствор 2-хлор-3-[[[N-метокси-С-метилкарбонимидоил]метиламино]метил]-4-метилсульфонилбензойной кислоты (65 мг, 0,186 ммоль), 1-метил-1Н-тетразол-5-амин (25,3 мг, 0,242 ммоль) и 4-диметиламинопиридина (69,0 мг, 0,559 ммоль) в DCM (2,47 г, 1,86 мл, 29,0 ммоль) перемешивали при комнатной температуре в течение 1 ч. К реакционной смеси добавляли 1-пропанфосфоновый ангидрид (0,712 г, 0,666 мл, 1,12 ммоль), и переносили в сосуд для микроволновой обработки, и нагревали в микроволновой печи до 100°C в течение 30 мин. Анализ с помощью LCMS продемонстрировал образование продукта. Реакционную смесь концентрировали *in vacuo* с получением оранжевого масла. Раствор разбавляли в воде (5 мл) и повышали основность с помощью конц. раствора NH₃ до pH ~9/10. Продукт очищали с помощью колоночной хроматографии с обращенной фазой (0-50% MeCN в H₂O, содержащей 0,1% NH₃). Содержащие продукт фракции концентрировали с применением сублимационной сушилки с получением 2-хлор-3-[[[N-метокси-С-метилкарбонимидоил]метиламино]метил]-4-метилсульфонил-N-(1-метилтетразол-5-ил)бензамида (8,3 мг, 0,019 ммоль) в виде бесцветной смолы.

¹H ЯМР (400 МГц, метанол) δ=8,20 (d, J=8,2 Гц, 1H), 7,83 (d, J=8,1 Гц, 1H), 4,95 (s, 2H), 4,06 (s, 3H), 3,68 (s, 3H), 3,27 (s, 3H), 2,60 (s, 3H), 2,06 (s, 3H).

Пример получения 8. Соединение 5.014.

К раствору метиламина (2М в THF, 40 г, 46 мл, 92,6 ммоль) добавляли по каплям этил-3-(бромметил)-2-хлор-4-(трифторметил)бензоат (2,0 г, 5,79 ммоль) в ацетонитриле (11,6 мл). Реакционную смесь перемешивали при комнатной температуре в течение 10 мин. Анализ с помощью LCMS продемонстрировал образование продукта и отсутствие оставшегося исходного материала. Реакционную смесь концентрировали *in vacuo*, затем разбавляли с помощью EtOAc (200 мл) и промывали насыщ. раствором K₂CO₃ (100 мл), соевым раствором (100 мл) и концентрировали *in vacuo* с получением этил-2-хлор-3-(метиламинометил)-4-(трифторметил)бензоата (1,80 г, 5,78 ммоль) в виде желтого масла. Анализ с помощью ЯМР продемонстрировал присутствие необходимого продукта.

¹H ЯМР (400 МГц, хлороформ) δ=7,73-7,53 (m, 2H), 4,43 (q, J=7,1 Гц, 2H), 4,01 (d, J=0,7 Гц, 2H), 2,51 (s, 3H), 1,41 (t, J=7,1 Гц, 3H) (N-H не наблюдали). ¹⁹F ЯМР (376 МГц, хлороформ) δ=-58,94.

К раствору этил-2-хлор-3-(метиламинометил)-4-(трифторметил)бензоата (500 мг, 1,69 ммоль), 4-диметиламинопиридина (21,1 мг, 0,169 ммоль) и триэтиламина (346 мг, 0,476 мл, 3,38 ммоль) в тетрагидрофуране (15,0 г, 16,9 мл) добавляли по каплям этилдитиоацетат (415 мг, 0,396 мл, 3,38 ммоль). При осуществлении реакции применяли оборудование, оснащенное обратным холодильником, реакционную смесь перемешивали и нагревали до 60°C в течение 10 дней. Анализ с помощью LCMS продемонстрировал образование продукта, но также присутствие оставшегося исходного материала. Реакционную смесь охлаждали до комнатной температуры и затем концентрировали *in vacuo* с удалением тетрагидрофурана. Смесь разбавляли с помощью DCM (50 мл) и воды (50 мл). Водный слой экстрагировали с помощью DCM (50 мл×2), и затем органические вещества промывали соевым раствором (50 мл), и концентрировали *in vacuo*. Продукт очищали с помощью колоночной флэш-хроматографии (0-30% EtOAc/изогексан) с получением этил-2-хлор-3-[[этанттиоил(метил)амино]метил]-4-(трифторметил)бензоата (370 мг, 0,941 ммоль) в виде коричневой смолы. ЯМР продемонстрировал наличие двух ротамеров.

¹H ЯМР (400 МГц, хлороформ) δ=7,87-7,71 (m, 2H), 5,54 (br s, 1,5H), 5,09 (s, 0,5H), 4,50-4,39 (m, 2H),

3,09 (s, 0,75H), 2,89 (s, 3H), 2,72 (s, 2,25H), 1,46-1,37 (1H, 3H).

К раствору этил-2-хлор-3-[[этанттионил(метил)амино]метил]-4-(трифторметил)бензоата (370 мг, 1,05 ммоль) в ацетонитриле (12,3 г, 15,7 мл) добавляли триэтиламин (1,07 г, 1,47 мл, 10,46 ммоль), гидрохлорид О-метилгидроксилamina (446 мг, 5,23 ммоль) и тетрафторборат серебра (1,03 г, 5,23 ммоль). Реакционную смесь перемешивали в течение 5 дней при комнатной температуре. Анализ с помощью LCMS продемонстрировал образование продукта и отсутствие оставшегося исходного материала. Раствор фильтровали через слой диоксида кремния с удалением осадка серебра и промывали с помощью MeCN (20 мл). Смесь концентрировали *in vacuo* с удалением MeCN. Остаток растворяли в EtOAc (20 мл) и промывали водой (20 мл), соевым раствором (20 мл), высушивали над сульфатом магния и концентрировали *in vacuo*. Продукт очищали с помощью колоночной флэш-хроматографии (0-20% EtOAc/изогексан) с получением этил-2-хлор-3-[[[(Z)-N-метокси-С-метилкарбонимидоил]метиламино]метил]-4-(трифторметил)бензоата (254 мг, 0,692 ммоль) в виде коричневой смолы.

¹H ЯМР (400 МГц, хлороформ) δ =7,67 (s, 2H), 4,66 (d, J=0,9 Гц, 2H), 4,44 (q, J=7,2 Гц, 2H), 3,74 (s, 3H), 2,48 (s, 3H), 2,04 (s, 3H), 1,41 (t, J=7,2 Гц, 3H).

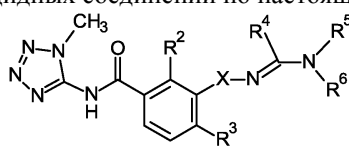
¹⁹F ЯМР (376 МГц, хлороформ) δ =-58,33 (s, 1F).

К раствору этил-2-хлор-3-[[[N-метокси-С-метилкарбонимидоил]метиламино]метил]-4-(трифторметил)бензоата (250 мг, 0,682 ммоль) в тетрагидрофуране (4,45 г, 5,0 мл, 61,6 ммоль) и воде (5,0 г, 5,0 мл, 277 ммоль) добавляли гидроксид лития (87,4 мг, 2,05 ммоль). Реакционную смесь перемешивали при комнатной температуре в течение 3 ч. Анализ с помощью LCMS продемонстрировал образование продукта. Полученный водный раствор разбавляли водой (1 мл) и подкисляли с помощью нескольких капель 2 М HCl до pH ~2. Смесь затем концентрировали *in vacuo* с удалением THF и большей части воды. Затем смесь разбавляли водой (всего 2 мл) и повышали ее основность с помощью водного раствора NH₃ до pH ~9. Полученный раствор загружали в колонку с обращенной фазой и очищали с применением хроматографии с обращенной фазой (0-20% MeCN в H₂O, содержащей 0,1% NH₃). Содержащие продукт фракции концентрировали с применением сублимационной сушилки в течение ночи с получением 2-хлор-3-[[[N-метокси-С-метилкарбонимидоил]метиламино]метил]-4-(трифторметил)бензойной кислоты (207 мг, 0,580 ммоль).

Раствор 2-хлор-3-[[[N-метокси-С-метилкарбонимидоил]метиламино]метил]-4-(трифторметил)бензойной кислоты (75 мг, 0,221 ммоль), 5-метил-1,3,4-оксадиазол-2-амин (29,4 мг, 0,287 ммоль) и 4-диметиламинопиридина (82,0 мг, 0,665 ммоль) в DCM (2,93 г, 2,21 мл, 34,5 ммоль) перемешивали при комнатной температуре в течение 1 ч. К реакционной смеси добавляли 1-пропанфосфоновый ангидрид (846 мг, 0,791 мл, 1,33 ммоль), и переносили в сосуд для микроволновой обработки, и нагревали в микроволновой печи до 80°C в течение 1 ч. Анализ с помощью LCMS продемонстрировал образование продукта. Реакционную смесь концентрировали *in vacuo* с получением оранжевого масла. Смесь растворяли в DCM (20 мл) и разделяли с помощью разбавленного раствора NaHCO₃ (20 мл). Водный слой промывали с помощью DCM (20 мл×5). Объединенные органические вещества промывали соевым раствором (20 мл) и концентрировали *in vacuo*. Продукт очищали с получением 2-хлор-3-[[[N-метокси-С-метилкарбонимидоил]метиламино]метил]-N-(5-метил-1,3,4-оксадиазол-2-ил)-4-(трифторметил)бензамида (4,0 мг, 9,53 мкмоль) в виде бесцветной смолы.

¹H ЯМР (400 МГц, Метанол) δ =7,83 (d, J=8,1 Гц, 1H), 7,68 (d, J=8,1 Гц, 1H), 4,65 (s, 2H), 3,68 (s, 3H), 2,55-2,44 (m, 6H), 2,04 (s, 3H).

Таблица 1
Примеры гербицидных соединений по настоящему изобретению



Номер соединения	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	X	¹ H-ЯМР (в CDCl ₃ , если не указано иное)
1.001	Me	Me	H	Me	Me	-	
1.002	Me	Me	H	Me	Me	CH ₂	
1.003	Me	Me	H	Me	Et	-	
1.004	Me	Me	H	Me	Et	CH ₂	
1.005	Me	Me	H	Et	Me	-	
1.006	Me	Me	H	Et	Me	CH ₂	
1.007	Me	Me	H	Et	Et	-	
1.008	Me	Me	H	Et	Et	CH ₂	
1.009	Me	Cl	H	Me	Me	-	
1.010	Me	Cl	H	Me	Me	CH ₂	
1.011	Me	Cl	H	Me	Et	-	
1.012	Me	Cl	H	Me	Et	CH ₂	
1.013	Me	Cl	H	Et	Me	-	
1.014	Me	Cl	H	Et	Me	CH ₂	
1.015	Me	Cl	H	Et	Et	-	
1.016	Me	Cl	H	Et	Et	CH ₂	
1.017	Me	CF ₃	H	Me	Me	-	¹ H ЯМР (400 МГц, d4-метанол) 7,57 (d, 1H), 7,36 (d, 1H), 7,29 (d, 1H), 4,05 (s, 3H), 3,05 (s, 6H), 2,27 (s, 3H)
1.018	Me	CF ₃	H	Me	Me	CH ₂	
1.019	Me	CF ₃	H	Me	Et	-	
1.020	Me	CF ₃	H	Me	Et	CH ₂	
1.021	Me	CF ₃	H	Et	Me	-	
1.022	Me	CF ₃	H	Et	Me	CH ₂	
1.023	Me	CF ₃	H	Et	Et	-	
1.024	Me	CF ₃	H	Et	Et	CH ₂	
1.025	Me	SO ₂ Me	H	Me	Me	-	¹ H ЯМР (400 МГц, DMSO-d ₆) d = 7,71 (d, J=8,2 Гц, 1H), 7,39 (s,

							1H), 7,30 (d, J=8,2 Гц, 1H), 3,88 (s, 3H), 3,24 (s, 3H), 3,00 (s, 6H), 2,18 (s, 3H)
1.026	Me	SO ₂ Me	H	Me	Me	CH ₂	
1.027	Me	SO ₂ Me	H	Me	Et	-	1НЯМР(400МГц, хлороформ): 10,76(brs,1H), 7,87(d,1H), 7,42-7,31(m,1,7H), 4,10(s,3H), 3,61-3,52(m,0,7H), 3,33(q,1,3H), 3,22(s,3H), 3,06(s,2H), 3,03(s,1H), 2,32(s,3H), 1,25(q,3H)
1.028	Me	SO ₂ Me	H	Me	Et	CH ₂	
1.029	Me	SO ₂ Me	H	Et	Me	-	
1.030	Me	SO ₂ Me	H	Et	Me	CH ₂	
1.031	Me	SO ₂ Me	H	Et	Et	-	1НЯМР(400МГц,хлороформ): 11,21-10,14(m,1H), 7,87(d,1H), 7,36(d,1H), 7,31(s,1H), 4,10(s,3H), 3,56(q,2H), 3,31(q,2H), 3,21(s,3H), 2,33(s,3H), 1,33-1,21(m,6H)
1.032	Me	SO ₂ Me	H	Et	Et	CH ₂	
1.033	Cl	Me	H	Me	Me	-	
1.034	Cl	Me	H	Me	Me	CH ₂	
1.035	Cl	Me	H	Me	Et	-	
1.036	Cl	Me	H	Me	Et	CH ₂	
1.037	Cl	Me	H	Et	Me	-	
1.038	Cl	Me	H	Et	Me	CH ₂	
1.039	Cl	Me	H	Et	Et	-	
1.040	Cl	Me	H	Et	Et	CH ₂	
1.041	Cl	Cl	H	Me	Me	-	1H ЯМР (400МГц, DMSO-d6) δ = 12,13 - 11,48 (m, 1H), 7,59 (s, 1H), 7,51 (d, J=8,3 Гц, 1H), 7,23 (d, J=8,3 Гц, 1H), 3,97 (s, 3H), 3,06 - 2,96 (m, 6H)
1.042	Cl	Cl	H	Me	Me	CH ₂	
1.043	Cl	Cl	H	Me	Et	-	

1.044	Cl	Cl	H	Me	Et	CH ₂	
1.045	Cl	Cl	H	Et	Me	-	
1.046	Cl	Cl	H	Et	Me	CH ₂	
1.047	Cl	Cl	H	Et	Et	-	
1.048	Cl	Cl	H	Et	Et	CH ₂	
1.049	Cl	CF ₃	H	Me	Me	-	1H ЯМР (400МГц, DMSO-d6) δ = 11,86 (br s, 1H), 7,83 - 7,59 (m, 2H), 7,55 - 7,33 (m, 1H), 4,00 (s, 3H), 3,07 (br s, 3H), 2,99 (br s, 3H)
1.050	Cl	CF ₃	H	Me	Me	CH ₂	
1.051	Cl	CF ₃	H	Me	Et	-	
1.052	Cl	CF ₃	H	Me	Et	CH ₂	
1.053	Cl	CF ₃	H	Et	Me	-	
1.054	Cl	CF ₃	H	Et	Me	CH ₂	
1.055	Cl	CF ₃	H	Et	Et	-	δ = 10,42 (br s, 1H), 7,60 (d, J=8,2 Гц, 1H), 7,36 (s, 1H), 7,31 (d, J=8,1 Гц, 1H), 4,12 (s, 3H), 3,54 (q, J=7,1 Гц, 2H), 3,31 (q, J=7,2 Гц, 2H), 1,29 - 1,23 (m, 6H)
1.056	Cl	CF ₃	H	Et	Et	CH ₂	
1.057	Cl	SO ₂ Me	H	Me	Me	-	1H ЯМР (400МГц, DMSO-d6): 3,05(d, 6H), 3,33(s, 3H), 3,98(s, 3H), 7,41(d, 1H), 7,62(s, 1H), 7,87(d, 1H)
1.058	Cl	SO ₂ Me	H	Me	Me	CH ₂	
1.059	Cl	SO ₂ Me	H	Me	Et	-	
1.060	Cl	SO ₂ Me	H	Me	Et	CH ₂	
1.061	Cl	SO ₂ Me	H	Et	Me	-	
1.062	Cl	SO ₂ Me	H	Et	Me	CH ₂	
1.063	Cl	SO ₂ Me	H	Et	Et	-	
1.064	Cl	SO ₂ Me	H	Et	Et	CH ₂	
1.065	CF ₃	Me	H	Me	Me	-	
1.066	CF ₃	Me	H	Me	Me	CH ₂	
1.067	CF ₃	Me	H	Me	Et	-	
1.068	CF ₃	Me	H	Me	Et	CH ₂	

1.069	CF ₃	Me	H	Et	Me	-	
1.070	CF ₃	Me	H	Et	Me	CH ₂	
1.071	CF ₃	Me	H	Et	Et	-	
1.072	CF ₃	Me	H	Et	Et	CH ₂	
1.073	CF ₃	Cl	H	Me	Me	-	
1.074	CF ₃	Cl	H	Me	Me	CH ₂	
1.075	CF ₃	Cl	H	Me	Et	-	
1.076	CF ₃	Cl	H	Me	Et	CH ₂	
1.077	CF ₃	Cl	H	Et	Me	-	
1.078	CF ₃	Cl	H	Et	Me	CH ₂	
1.079	CF ₃	Cl	H	Et	Et	-	
1.080	CF ₃	Cl	H	Et	Et	CH ₂	
1.081	CF ₃	CF ₃	H	Me	Me	-	
1.082	CF ₃	CF ₃	H	Me	Me	CH ₂	
1.083	CF ₃	CF ₃	H	Me	Et	-	
1.084	CF ₃	CF ₃	H	Me	Et	CH ₂	
1.085	CF ₃	CF ₃	H	Et	Me	-	
1.086	CF ₃	CF ₃	H	Et	Me	CH ₂	
1.087	CF ₃	CF ₃	H	Et	Et	-	
1.088	CF ₃	CF ₃	H	Et	Et	CH ₂	
1.089	CF ₃	SO ₂ Me	H	Me	Me	-	1НЯМР(500МГц,Хлороф орм): 8,23(d,1H), 7,36(s,1H), 7,24(d,1H), 4,11(s,3H), 3,27(s,3H), 3,07(d,6H)
1.090	CF ₃	SO ₂ Me	H	Me	Me	CH ₂	
1.091	CF ₃	SO ₂ Me	H	Me	Et	-	
1.092	CF ₃	SO ₂ Me	H	Me	Et	CH ₂	
1.093	CF ₃	SO ₂ Me	H	Et	Me	-	
1.094	CF ₃	SO ₂ Me	H	Et	Me	CH ₂	
1.095	CF ₃	SO ₂ Me	H	Et	Et	-	
1.096	CF ₃	SO ₂ Me	H	Et	Et	CH ₂	
1.097	SO ₂ Me	Me	H	Me	Me	-	
1.098	SO ₂ Me	Me	H	Me	Me	CH ₂	
1.099	SO ₂ Me	Me	H	Me	Et	-	
1.100	SO ₂ Me	Me	H	Me	Et	CH ₂	

1.101	SO ₂ Me	Me	H	Et	Me	-	
1.102	SO ₂ Me	Me	H	Et	Me	CH ₂	
1.103	SO ₂ Me	Me	H	Et	Et	-	
1.104	SO ₂ Me	Me	H	Et	Et	CH ₂	
1.105	SO ₂ Me	Cl	H	Me	Me	-	
1.106	SO ₂ Me	Cl	H	Me	Me	CH ₂	
1.107	SO ₂ Me	Cl	H	Me	Et	-	
1.108	SO ₂ Me	Cl	H	Me	Et	CH ₂	
1.109	SO ₂ Me	Cl	H	Et	Me	-	
1.110	SO ₂ Me	Cl	H	Et	Me	CH ₂	
1.111	SO ₂ Me	Cl	H	Et	Et	-	
1.112	SO ₂ Me	Cl	H	Et	Et	CH ₂	
1.113	SO ₂ Me	CF ₃	H	Me	Me	-	
1.114	SO ₂ Me	CF ₃	H	Me	Me	CH ₂	
1.115	SO ₂ Me	CF ₃	H	Me	Et	-	
1.116	SO ₂ Me	CF ₃	H	Me	Et	CH ₂	
1.117	SO ₂ Me	CF ₃	H	Et	Me	-	
1.118	SO ₂ Me	CF ₃	H	Et	Me	CH ₂	
1.119	SO ₂ Me	CF ₃	H	Et	Et	-	
1.120	SO ₂ Me	CF ₃	H	Et	Et	CH ₂	
1.121	SO ₂ Me	SO ₂ Me	H	Me	Me	-	
1.122	SO ₂ Me	SO ₂ Me	H	Me	Me	CH ₂	
1.123	SO ₂ Me	SO ₂ Me	H	Me	Et	-	
1.124	SO ₂ Me	SO ₂ Me	H	Me	Et	CH ₂	
1.125	SO ₂ Me	SO ₂ Me	H	Et	Me	-	
1.126	SO ₂ Me	SO ₂ Me	H	Et	Me	CH ₂	
1.127	SO ₂ Me	SO ₂ Me	H	Et	Et	-	
1.128	SO ₂ Me	SO ₂ Me	H	Et	Et	CH ₂	
1.129	Cl	SO ₂ Me	Me	Me	Me	-CH ₂ O-	d = 8,15 (d, J=8,2 Γ _{нн} , 1H), 7,76 (d, J=8,1 Γ _{нн} , 1H), 5,54 (s, 2H), 4,14 (s, 3H), 3,41 (s, 3H), 2,72 (s, 6H), 1,94 (s, 3H)
1.130	Cl	CF ₃	H	CF ₃ CH ₂ -	Me	-	δ = 11,21 (br s, 1H), 7,65 - 7,56 (m, 2H), 7,36 (br d, J=7,9 Γ _{нн} , 1H), 4,21 (q, J=9,0 Γ _{нн} , 0,9H), 4,12 (s, 3H), 3,84 (q, J=8,4 Γ _{нн} ,

							1,1H), 3,21 (s, 3H)
1.131	Cl	CF ₃	H	Me	-фенил	-	¹ H ЯМР (400МГц, хлороформ) δ = 10,63 (br s, 1H), 7,98 (s, 1H), 7,66 (d, J=8,2 Гц, 1H), 7,46 - 7,34 (m, 3H), 7,24 - 7,16 (m, 3H), 4,11 (s, 3H), 3,56 (s, 3H)
1.132	Cl	CF ₃	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -		-	δ = 10,46 (br s, 1H), 7,58 (d, J=8,2 Гц, 1H), 7,49 (s, 1H), 7,30 (d, J=7,8 Гц, 1H), 4,09 (s, 3H), 3,63 (br s, 2H), 3,53 (br t, J=6,4 Гц, 2H), 2,11 - 1,94 (m, 4H)
1.133	Cl	CF ₃	Me	Me	Et	-	
1.134	Cl	CF ₃	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ - 2"		-	δ = 10,52 (br s, 1H), 7,59 (d, J=8,1 Гц, 1H), 7,35 (s, 1H), 7,30 (d, J=7,9 Гц, 1H), 4,11 (s, 3H), 3,67 (br s, 2H), 3,34 (br s, 2H), 1,72 (br d, J=4,5 Гц, 2H), 1,64 (br s, 4H)
1.135	Cl	CF ₃	H	-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -		-	δ = 11,86 (br s, 1H), 7,71 (d, J=8,1 Гц, 1H), 7,66 (s, 1H), 7,41 (d, J=7,9 Гц, 1H), 4,00 (s, 3H), 3,63 (br s, 6H), 3,46 (br s, 2H)
1.136	Cl	CF ₃	H	Me	Et	-	δ = 10,46 (br s, 1H), 7,60 (d, J=8,1 Гц, 1H), 7,40 (s, 0,6H), 7,35 - 7,28 (m, 1,4H), 4,11 (s, 3H), 3,56 (q, J=6,8 Гц, 0,8H), 3,33 (q, J=7,2 Гц, 1,2H), 3,08 (s, 1,8H), 3,04 (s, 1,2H), 1,24 (br t, J=7,0 Гц, 3H)
1.137	Cl	CF ₃	Me	Me	Me	-CH ₂ CH ₂ -	
1.138	Cl	CF ₃	Me	Me	Me	O	
1.139	Cl	CF ₃	CF ₃	Me	Me	-	7,59(d,1H),7,31(d,J=8,1Hz,1H),4,11(s,3H),3,17(s,6H)
1.140	Cl	CF ₃	H	Me	-iPr	-	¹ HЯМР(400МГц,d4-метанол): 1,23-1,32(m,6H), 2,90-2,99(m,3H), 3,67-3,83(m,1H), 3,99-

							4,09(m,3H), 7,30-7,39(m,1H), 7,54(s,1H), 7,61-7,72(m,1H)
1.141	Cl	SO ₂ Me	H	-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -		-	1НЯМР(400МГц, d4-метанол): 3,26-3,28(m,3H), 3,46-3,53(m,2H), 3,71-3,80(m,6H), 4,06(s,3H), 7,39(d,1H), 7,55(s, 1H), 7,98(d, 1H)
1.142	Cl	SO ₂ Me	H	Me	-CH ₂ CF ₃	-	1НЯМР(400МГц,хлороформ): 8,04-8,00(m,1H), 7,63(d, 1H), 7,44-7,39(m,1H), 4,23(q, 1H), 4,13(s,3H), 3,86(q, 1H), 3,29-3,17 (m,6H)
1.143	Me	SO ₂ Me	H	Me	-CH ₂ CF ₃	-	1НЯМР(400МГц,d4-метанол): 7,92(d,1H), 7,49(s,1H), 7,42(d,1H), 4,41-4,29(m,1H), 4,14-4,03(m,4H), 3,25-3,13(m,6H), 2,27(s,3H)
1.144	Me	SO ₂ Me	H	Me	-iPr	-	1НЯМР(400МГц,хлороформ): 7,89(d,1H), 7,43-7,31(m, 1,8H), 7,24(s,0,2H), 4,80(td,0,2H), 4,10(s,3H), 3,64(sept,0,8H), 3,25-3,17(m,3H), 2,98(s,2,3H), 2,90(s,0,7H), 2,31(s,3H), 1,28(d,6H)
1.145	Cl	SO ₂ Me	H	Me	-фенил	-	1НЯМР(400МГц,хлороформ): 10,24(brs,1H), 7,97(d, 1H), 7,84(s, 1H), 7,43(d, 1H), 7,39-7,33(m,2H), 7,25-7,13(m,3H), 4,11(s,3H), 3,56(s,3H), 3,23(s,3H), 2,36(s,3H)
1.146	Me	SO ₂ Me	H	-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -		-	1НЯМР(400МГц,d4-метанол): 7,90(d, 1H), 7,43-7,32(m,2H), 4,05(s,3H), 3,75(brs,6H), 3,45(brd,2H), 3,21(s,3H), 2,28(s,3H)
1.147	Me	CF ₃	H	-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -		-	1НЯМР(400МГц,d4-метанол): 7,58(d,1H), 7,39-7,31(m,2H),
							4,05(s,3H), 3,72(brs,8H), 2,27(s,3H)
1.148	Cl	CF ₃	Me	Me	Me	-	1НЯМР(400МГц,d4-метанол)7,67(d,1H),7,31(d,1H),4,06(s,3H),3,11(s,6H),1,81(s,3H)
1.149	Cl	CHF ₂	H	Me	Me	-	
1.150	Cl	CHF ₂	H	Me	Me	CH ₂	
1.151	Cl	CHF ₂	H	Me	Et	-	
1.152	Cl	CHF ₂	H	Me	Et	CH ₂	
1.153	Cl	CHF ₂	H	Et	Me	-	
1.154	Cl	CHF ₂	H	Et	Me	CH ₂	
1.155	Cl	CHF ₂	H	Et	Et	-	
1.156	Cl	CHF ₂	H	Et	Et	CH ₂	

Таблица 2
Примеры гербицидных соединений по настоящему изобретению



Номер соединения	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	X	¹ H-ЯМР (в CDCl ₃ , если не указано иное)
2.001	Me	Me	H	Me	Me	-	
2.002	Me	Me	H	Me	Me	CH ₂	
2.003	Me	Me	H	Me	Et	-	
2.004	Me	Me	H	Me	Et	CH ₂	
2.005	Me	Me	H	Et	Me	-	
2.006	Me	Me	H	Et	Me	CH ₂	
2.007	Me	Me	H	Et	Et	-	
2.008	Me	Me	H	Et	Et	CH ₂	
2.009	Me	Cl	H	Me	Me	-	
2.010	Me	Cl	H	Me	Me	CH ₂	
2.011	Me	Cl	H	Me	Et	-	
2.012	Me	Cl	H	Me	Et	CH ₂	
2.013	Me	Cl	H	Et	Me	-	
2.014	Me	Cl	H	Et	Me	CH ₂	
2.015	Me	Cl	H	Et	Et	-	
2.016	Me	Cl	H	Et	Et	CH ₂	
2.017	Me	CF ₃	H	Me	Me	-	¹ HЯМР (400 МГц, d4- метанол) 7,55 (d, 1H), 7,29 (d, 1H), 7,25 (d, 1H), 3,04 (s, 6H), 2,51 (s, 3H), 2,23 (s, 3H)
2.018	Me	CF ₃	H	Me	Me	CH ₂	
2.019	Me	CF ₃	H	Me	Et	-	
2.020	Me	CF ₃	H	Me	Et	CH ₂	
2.021	Me	CF ₃	H	Et	Me	-	
2.022	Me	CF ₃	H	Et	Me	CH ₂	
2.023	Me	CF ₃	H	Et	Et	-	

2.024	Me	CF ₃	H	Et	Et	CH ₂	
2.025	Me	SO ₂ Me	H	Me	Me	-	(DMSO) δ = 8,14 - 7,15 (m, 3H), 3,29 (s, 3H), 3,23 - 3,05 (m, 6H), 2,49 (br s, 3H), 2,32 - 2,15 (m, 3H)
2.026	Me	SO ₂ Me	H	Me	Me	CH ₂	
2.027	Me	SO ₂ Me	H	Me	Et	-	δ = 10,88(brs,1H), 7,86(d,1H), 7,33(s,0,7H), 7,30(d,1H), 7,24(s,0,3H), 3,62-3,51(m,0,7H), 3,30(q,1,3H), 3,21(s,3H), 3,05(s,2H), 3,01(s,1H), 2,54(s,3H), 2,29(s,3H), 1,32-1,19(m,3H)
2.028	Me	SO ₂ Me	H	Me	Et	CH ₂	
2.029	Me	SO ₂ Me	H	Et	Me	-	
2.030	Me	SO ₂ Me	H	Et	Me	CH ₂	
2.031	Me	SO ₂ Me	H	Et	Et	-	δ = 7,91-7,82(m,1H), 7,31-7,27(m,2H), 3,55(q,2H), 3,28(q,2H), 3,20(s,3H), 2,54(s,3H), 2,29(s,3H), 1,26(td,6H)
2.032	Me	SO ₂ Me	H	Et	Et	CH ₂	
2.033	Cl	Me	H	Me	Me	-	
2.034	Cl	Me	H	Me	Me	CH ₂	
2.035	Cl	Me	H	Me	Et	-	
2.036	Cl	Me	H	Me	Et	CH ₂	
2.037	Cl	Me	H	Et	Me	-	
2.038	Cl	Me	H	Et	Me	CH ₂	
2.039	Cl	Me	H	Et	Et	-	
2.040	Cl	Me	H	Et	Et	CH ₂	
2.041	Cl	Cl	H	Me	Me	-	

2.042	Cl	Cl	H	Me	Me	CH ₂	
2.043	Cl	Cl	H	Me	Et	-	
2.044	Cl	Cl	H	Me	Et	CH ₂	
2.045	Cl	Cl	H	Et	Me	-	
2.046	Cl	Cl	H	Et	Me	CH ₂	
2.047	Cl	Cl	H	Et	Et	-	
2.048	Cl	Cl	H	Et	Et	CH ₂	
2.049	Cl	CF ₃	H	Me	Me	-	(DMSO) δ = 7,60 - 7,50 (m, 2H), 7,18 - 7,11 (m, 1H), 3,02 (s, 3H), 2,98 - 2,90 (m, 3H), 2,46 - 2,33 (m, 3H)
2.050	Cl	CF ₃	H	Me	Me	CH ₂	
2.051	Cl	CF ₃	H	Me	Et	-	
2.052	Cl	CF ₃	H	Me	Et	CH ₂	
2.053	Cl	CF ₃	H	Et	Me	-	
2.054	Cl	CF ₃	H	Et	Me	CH ₂	
2.055	Cl	CF ₃	H	Et	Et	-	δ = 7,54 (d, J=8,1 Гц, 1H), 7,29 - 7,26 (m, 2H), 3,52 (q, J=7,1 Гц, 2H), 3,28 (q, J=7,1 Гц, 2H), 2,54 (s, 3H), 1,28 - 1,21 (m, 6H)
2.056	Cl	CF ₃	H	Et	Et	CH ₂	
2.057	Cl	SO ₂ Me	H	Me	Me	-	δ = 7,95(d, 1H), 7,51(s, 1H), 7,28(d, 1H), 3,30 (s, 3H), 3,10(s, 6H), 2,51(s, 3H)
2.058	Cl	SO ₂ Me	H	Me	Me	CH ₂	
2.059	Cl	SO ₂ Me	H	Me	Et	-	
2.060	Cl	SO ₂ Me	H	Me	Et	CH ₂	
2.061	Cl	SO ₂ Me	H	Et	Me	-	
2.062	Cl	SO ₂ Me	H	Et	Me	CH ₂	
2.063	Cl	SO ₂ Me	H	Et	Et	-	
2.064	Cl	SO ₂ Me	H	Et	Et	CH ₂	

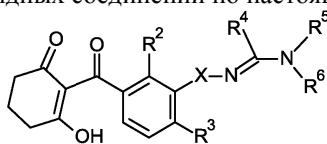
2.065	CF ₃	Me	H	Me	Me	-	
2.066	CF ₃	Me	H	Me	Me	CH ₂	
2.067	CF ₃	Me	H	Me	Et	-	
2.068	CF ₃	Me	H	Me	Et	CH ₂	
2.069	CF ₃	Me	H	Et	Me	-	
2.070	CF ₃	Me	H	Et	Me	CH ₂	
2.071	CF ₃	Me	H	Et	Et	-	
2.072	CF ₃	Me	H	Et	Et	CH ₂	
2.073	CF ₃	Cl	H	Me	Me	-	
2.074	CF ₃	Cl	H	Me	Me	CH ₂	
2.075	CF ₃	Cl	H	Me	Et	-	
2.076	CF ₃	Cl	H	Me	Et	CH ₂	
2.077	CF ₃	Cl	H	Et	Me	-	
2.078	CF ₃	Cl	H	Et	Me	CH ₂	
2.079	CF ₃	Cl	H	Et	Et	-	
2.080	CF ₃	Cl	H	Et	Et	CH ₂	
2.081	CF ₃	CF ₃	H	Me	Me	-	
2.082	CF ₃	CF ₃	H	Me	Me	CH ₂	
2.083	CF ₃	CF ₃	H	Me	Et	-	
2.084	CF ₃	CF ₃	H	Me	Et	CH ₂	
2.085	CF ₃	CF ₃	H	Et	Me	-	
2.086	CF ₃	CF ₃	H	Et	Me	CH ₂	
2.087	CF ₃	CF ₃	H	Et	Et	-	
2.088	CF ₃	CF ₃	H	Et	Et	CH ₂	
2.089	CF ₃	SO ₂ Me	H	Me	Me	-	
2.090	CF ₃	SO ₂ Me	H	Me	Me	CH ₂	
2.091	CF ₃	SO ₂ Me	H	Me	Et	-	
2.092	CF ₃	SO ₂ Me	H	Me	Et	CH ₂	
2.093	CF ₃	SO ₂ Me	H	Et	Me	-	
2.094	CF ₃	SO ₂ Me	H	Et	Me	CH ₂	
2.095	CF ₃	SO ₂ Me	H	Et	Et	-	
2.096	CF ₃	SO ₂ Me	H	Et	Et	CH ₂	
2.097	SO ₂ Me	Me	H	Me	Me	-	
2.098	SO ₂ Me	Me	H	Me	Me	CH ₂	
2.099	SO ₂ Me	Me	H	Me	Et	-	

2.100	SO ₂ Me	Me	H	Me	Et	CH ₂	
2.101	SO ₂ Me	Me	H	Et	Me	-	
2.102	SO ₂ Me	Me	H	Et	Me	CH ₂	
2.103	SO ₂ Me	Me	H	Et	Et	-	
2.104	SO ₂ Me	Me	H	Et	Et	CH ₂	
2.105	SO ₂ Me	Cl	H	Me	Me	-	
2.106	SO ₂ Me	Cl	H	Me	Me	CH ₂	
2.107	SO ₂ Me	Cl	H	Me	Et	-	
2.108	SO ₂ Me	Cl	H	Me	Et	CH ₂	
2.109	SO ₂ Me	Cl	H	Et	Me	-	
2.110	SO ₂ Me	Cl	H	Et	Me	CH ₂	
2.111	SO ₂ Me	Cl	H	Et	Et	-	
2.112	SO ₂ Me	Cl	H	Et	Et	CH ₂	
2.113	SO ₂ Me	CF ₃	H	Me	Me	-	
2.114	SO ₂ Me	CF ₃	H	Me	Me	CH ₂	
2.115	SO ₂ Me	CF ₃	H	Me	Et	-	
2.116	SO ₂ Me	CF ₃	H	Me	Et	CH ₂	
2.117	SO ₂ Me	CF ₃	H	Et	Me	-	
2.118	SO ₂ Me	CF ₃	H	Et	Me	CH ₂	
2.119	SO ₂ Me	CF ₃	H	Et	Et	-	
2.120	SO ₂ Me	CF ₃	H	Et	Et	CH ₂	
2.121	SO ₂ Me	SO ₂ Me	H	Me	Me	-	
2.122	SO ₂ Me	SO ₂ Me	H	Me	Me	CH ₂	
2.123	SO ₂ Me	SO ₂ Me	H	Me	Et	-	
2.124	SO ₂ Me	SO ₂ Me	H	Me	Et	CH ₂	
2.125	SO ₂ Me	SO ₂ Me	H	Et	Me	-	
2.126	SO ₂ Me	SO ₂ Me	H	Et	Me	CH ₂	
2.127	SO ₂ Me	SO ₂ Me	H	Et	Et	-	
2.128	SO ₂ Me	SO ₂ Me	H	Et	Et	CH ₂	
2.129	Cl	SO ₂ Me	Me	Me	Me	-CH ₂ O-	δ = 8,13 (d, J=8,2 Γ _н , 1H), 7,75 (d, J=8,2 Γ _н , 1H), 5,55 (s, 2H), 3,40 (s, 3H), 2,73 (s, 6H), 2,54 (s, 3H), 1,94 (s, 3H)
2.130	Cl	CF ₃	H	CF ₃ CH ₂	Me	-	δ = 7,54 (m, 1H),

				-			7,40 (m, 1H), 7,31 (m, 1H), 4,19 (q, J=9,0 Гц, 0,9H), 3,78 (q, J=8,4 Гц, 1,1H), 3,19 (s, 1,8H), 3,16 (s, 1,2H), 2,52 (s, 3H)
2.131	Cl	CF ₃	H	Me	-фенил	-	δ = 11,12 (br s, 1H), 7,97 (s, 1H), 7,60 (d, J=8,1 Гц, 1H), 7,41 - 7,36 (m, 2H), 7,33 (d, J=7,9 Гц, 1H), 7,22 - 7,13 (m, 3H), 3,54 (s, 3H), 2,38 (s, 3H)
2.132	Cl	CF ₃	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -		-	δ = 7,60 - 7,50 (m, 2H), 7,28 (d, J=8,6 Гц, 1H), 3,60 - 3,49 (m, 4H), 2,54 (s, 3H), 2,05 - 1,94 (m, 4H)
2.133	Cl	CF ₃	Me	Me	Et	-	
2.134	Cl	CF ₃	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -		-	
2.135	Cl	CF ₃	H	-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -		-	
2.136	Cl	CF ₃	H	Me	Et	-	δ = 10,15 (br s, 1H), 7,55 (d, J=8,2 Гц, 1H), 7,35 (s, 0,6H), 7,29 (d, J=8,2 Гц, 1H), 7,26 (s, 0,4H), 3,54 (q, J=6,9 Гц, 0,8H), 3,31 (q, J=7,2 Гц, 1,2H), 3,04 (s, 1,8H), 3,01 (s, 1,2H), 2,54 (s, 3H), 1,26 - 1,20 (m, 3H)
2.137	Cl	CF ₃	Me	Me	Me	-CH ₂ CH ₂ -	
2.138	Cl	CF ₃	Me	Me	Me	O	
2.139	Cl	CF ₃	CF ₃	Me	Me	-	
2.140	Cl	CF ₃	H	Me	-iPr	-	1НЯМР(400МГц, d4-метанол) 1,18-

							1,34(m,6H), 2,45-2,54(m,3H), 2,90-3,00(m,3H), 3,68-3,80(m,1H), 7,21-7,31(m,1H), 7,36(d,1H), 7,53(s,1H), 7,58-7,70(m,1H)
2.141	Cl	SO ₂ Me	H	-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -	-		
2.142	Cl	SO ₂ Me	H	Me	-CH ₂ CF ₃	-	$\delta = 8,01$ -7,96(m,1H), 7,56-7,40(m,2H), 4,27-4,17(m,1H), 3,81(q, 1H), 3,26-3,14(m,6H), 2,55(s,3H)
2.143	Me	SO ₂ Me	H	Me	-CH ₂ CF ₃	-	1НЯМР(400МГц, d4-метанол): 7,89(d,1H), 7,48(s,1H), 7,31(d,1H), 4,34(q,0,7H), 4,08(q,1,3H), 3,26-3,10(m,6H), 2,51(s,3H), 2,23(s,3H)
2.144	Me	SO ₂ Me	H	Me	-iPr	-	1НЯМР(400МГц, d4-метанол): 7,87(d,1H), 7,43(s,0,8H), 7,27(d,1,2H), 3,72(td,1H), 3,22(s,3H), 3,00(s,2,4H), 2,92(s,0,6H), 2,51(s,3H), 2,24(s,3H), 1,28(d,6H)
2.145	Cl	SO ₂ Me	H	Me	-фенил	-	$\delta = 7,96$ (d,1H), 7,87(s,1H), 7,41-7,34(m,3H), 7,25-7,14(m,3H), 3,56(s,3H), 3,23(s,3H), 2,43(s,3H), 2,35(s,3H)
2.146	Me	SO ₂ Me	H	-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -	-		1НЯМР(400МГц, d4-метанол):
							7,87(d,1H), 7,36(s,1H), 7,28(d,1H), 3,75(brs,6H), 3,54-3,37(m,2H), 3,20(s,3H), 2,51(s,3H), 2,24(s,3H)
2.147	Me	CF ₃	H	-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -	-		1НЯМР(400МГц, d4-метанол): 7,55(d,1H), 7,34(d,1H), 7,25(d,1H), 3,81-3,36(m,8H), 2,51(s,3H), 2,23(s,3H)
2.148	Cl	CF ₃	Me	Me	Me	-	1НЯМР(400МГц, d4-метанол): 7,64(d,1H), 7,23(d,1H), 3,10(s,6H), 2,50(s,3H), 1,80(s,3H)
2.149	Cl	CHF ₂	H	Me	Me	-	
2.150	Cl	CHF ₂	H	Me	Me	CH ₂	
2.151	Cl	CHF ₂	H	Me	Et	-	
2.152	Cl	CHF ₂	H	Me	Et	CH ₂	
2.153	Cl	CHF ₂	H	Et	Me	-	
2.154	Cl	CHF ₂	H	Et	Me	CH ₂	
2.155	Cl	CHF ₂	H	Et	Et	-	
2.156	Cl	CHF ₂	H	Et	Et	CH ₂	

Таблица 3
Примеры гербицидных соединений по настоящему изобретению



Номер соединения	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	X	¹ H-ЯМР (в CDCl ₃ , если не указано иное)
3.001	Me	Me	H	Me	Me	-	
3.002	Me	Me	H	Me	Me	CH ₂	
3.003	Me	Me	H	Me	Et	-	
3.004	Me	Me	H	Me	Et	CH ₂	
3.005	Me	Me	H	Et	Me	-	
3.006	Me	Me	H	Et	Me	CH ₂	
3.007	Me	Me	H	Et	Et	-	
3.008	Me	Me	H	Et	Et	CH ₂	
3.009	Me	Cl	H	Me	Me	-	
3.010	Me	Cl	H	Me	Me	CH ₂	
3.011	Me	Cl	H	Me	Et	-	
3.012	Me	Cl	H	Me	Et	CH ₂	
3.013	Me	Cl	H	Et	Me	-	
3.014	Me	Cl	H	Et	Me	CH ₂	
3.015	Me	Cl	H	Et	Et	-	
3.016	Me	Cl	H	Et	Et	CH ₂	
3.017	Me	CF ₃	H	Me	Me	-	¹ HЯМР(400МГц,d4-метанол) 7,75(brs,1H),7,51(d,1H),7,05(d,1H),3,18(brd,6H),2,49(t,4H),2,11(s,3H),1,97(quin, 2H)
3.018	Me	CF ₃	H	Me	Me	CH ₂	
3.019	Me	CF ₃	H	Me	Et	-	
3.020	Me	CF ₃	H	Me	Et	CH ₂	
3.021	Me	CF ₃	H	Et	Me	-	
3.022	Me	CF ₃	H	Et	Me	CH ₂	
3.023	Me	CF ₃	H	Et	Et	-	
3.024	Me	CF ₃	H	Et	Et	CH ₂	
3.025	Me	SO ₂ Me	H	Me	Me	-	(DMSO) δ = 7,66 (d,

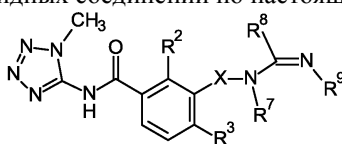
							J=8,1 Гц, 1H), 7,40 (s, 1H), 6,90 (d, J=8,2 Гц, 1H), 3,24 (s, 3H), 3,00 (br d, J=4,6 Гц, 6H), 2,64 - 2,51 (m, 4H), 1,99 - 1,91 (m, 5H)
3.026	Me	SO ₂ Me	H	Me	Me	CH ₂	
3.027	Me	SO ₂ Me	H	Me	Et	-	
3.028	Me	SO ₂ Me	II	Me	Et	CH ₂	
3.029	Me	SO ₂ Me	H	Et	Me	-	
3.030	Me	SO ₂ Me	H	Et	Me	CH ₂	
3.031	Me	SO ₂ Me	H	Et	Et	-	
3.032	Me	SO ₂ Me	H	Et	Et	CH ₂	
3.033	Cl	Me	H	Me	Me	-	
3.034	Cl	Me	H	Me	Me	CH ₂	
3.035	Cl	Me	H	Me	Et	-	
3.036	Cl	Me	H	Me	Et	CH ₂	
3.037	Cl	Me	H	Et	Me	-	
3.038	Cl	Me	H	Et	Me	CH ₂	
3.039	Cl	Me	H	Et	Et	-	
3.040	Cl	Me	H	Et	Et	CH ₂	
3.041	Cl	Cl	H	Me	Me	-	
3.042	Cl	Cl	H	Me	Me	CH ₂	
3.043	Cl	Cl	H	Me	Et	-	
3.044	Cl	Cl	H	Me	Et	CH ₂	
3.045	Cl	Cl	H	Et	Me	-	
3.046	Cl	Cl	H	Et	Me	CH ₂	
3.047	Cl	Cl	H	Et	Et	-	
3.048	Cl	Cl	H	Et	Et	CH ₂	
3.049	Cl	CF ₃	H	Me	Me	-	(DMSO): 7,59 - 7,49 (m, 2H), 6,94 (d, J=8,1 Гц, 1H), 3,01 (s, 3H), 2,97 - 2,90 (m, 3H), 2,70 - 2,51 (m, 4H), 1,93 (quin, J=6,3 Гц, 2H)
3.050	Cl	CF ₃	H	Me	Me	CH ₂	
3.051	Cl	CF ₃	H	Me	Et	-	
3.052	Cl	CF ₃	H	Me	Et	CH ₂	

3.053	Cl	CF ₃	H	Et	Me	-	
3.054	Cl	CF ₃	H	Et	Me	CH ₂	
3.055	Cl	CF ₃	H	Et	Et	-	
3.056	Cl	CF ₃	H	Et	Et	CH ₂	
3.057	Cl	SO ₂ Me	H	Me	Me	-	1НЯМР(400МГц,хлороформ): 7,95(d,1H), 7,42(s,1H), 6,87(d,1H), 3,29(s,3H), 3,06(d,6H), 2,80(t,2H), 2,45(t, 2H), 2,06(quin,2H)
3.058	Cl	SO ₂ Me	H	Me	Me	CH ₂	
3.059	Cl	SO ₂ Me	H	Me	Et	-	
3.060	Cl	SO ₂ Me	H	Me	Et	CH ₂	
3.061	Cl	SO ₂ Me	H	Et	Me	-	
3.062	Cl	SO ₂ Me	H	Et	Me	CH ₂	
3.063	Cl	SO ₂ Me	H	Et	Et	-	
3.064	Cl	SO ₂ Me	H	Et	Et	CH ₂	
3.065	CF ₃	Me	H	Me	Me	-	
3.066	CF ₃	Me	H	Me	Me	CH ₂	
3.067	CF ₃	Me	H	Me	Et	-	
3.068	CF ₃	Me	H	Me	Et	CH ₂	
3.069	CF ₃	Me	H	Et	Me	-	
3.070	CF ₃	Me	H	Et	Me	CH ₂	
3.071	CF ₃	Me	H	Et	Et	-	
3.072	CF ₃	Me	H	Et	Et	CH ₂	
3.073	CF ₃	Cl	H	Me	Me	-	
3.074	CF ₃	Cl	H	Me	Me	CH ₂	
3.075	CF ₃	Cl	H	Me	Et	-	
3.076	CF ₃	Cl	H	Me	Et	CH ₂	
3.077	CF ₃	Cl	H	Et	Me	-	
3.078	CF ₃	Cl	H	Et	Me	CH ₂	
3.079	CF ₃	Cl	H	Et	Et	-	
3.080	CF ₃	Cl	H	Et	Et	CH ₂	
3.081	CF ₃	CF ₃	H	Me	Me	-	
3.082	CF ₃	CF ₃	H	Me	Me	CH ₂	
3.083	CF ₃	CF ₃	H	Me	Et	-	
3.084	CF ₃	CF ₃	H	Me	Et	CH ₂	

3.085	CF ₃	CF ₃	H	Et	Me	-	
3.086	CF ₃	CF ₃	H	Et	Me	CH ₂	
3.087	CF ₃	CF ₃	H	Et	Et	-	
3.088	CF ₃	CF ₃	H	Et	Et	CH ₂	
3.089	CF ₃	SO ₂ Me	H	Me	Me	-	
3.090	CF ₃	SO ₂ Me	H	Me	Me	CH ₂	
3.091	CF ₃	SO ₂ Me	H	Me	Et	-	
3.092	CF ₃	SO ₂ Me	H	Me	Et	CH ₂	
3.093	CF ₃	SO ₂ Me	H	Et	Me	-	
3.094	CF ₃	SO ₂ Me	H	Et	Me	CH ₂	
3.095	CF ₃	SO ₂ Me	H	Et	Et	-	
3.096	CF ₃	SO ₂ Me	H	Et	Et	CH ₂	
3.097	SO ₂ Me	Me	H	Me	Me	-	
3.098	SO ₂ Me	Me	H	Me	Me	CH ₂	
3.099	SO ₂ Me	Me	H	Me	Et	-	
3.100	SO ₂ Me	Me	H	Me	Et	CH ₂	
3.101	SO ₂ Me	Me	H	Et	Me	-	
3.102	SO ₂ Me	Me	H	Et	Me	CH ₂	
3.103	SO ₂ Me	Me	H	Et	Et	-	
3.104	SO ₂ Me	Me	H	Et	Et	CH ₂	
3.105	SO ₂ Me	Cl	H	Me	Me	-	
3.106	SO ₂ Me	Cl	H	Me	Me	CH ₂	
3.107	SO ₂ Me	Cl	H	Me	Et	-	
3.108	SO ₂ Me	Cl	H	Me	Et	CH ₂	
3.109	SO ₂ Me	Cl	H	Et	Me	-	
3.110	SO ₂ Me	Cl	H	Et	Me	CH ₂	
3.111	SO ₂ Me	Cl	H	Et	Et	-	
3.112	SO ₂ Me	Cl	H	Et	Et	CH ₂	
3.113	SO ₂ Me	CF ₃	H	Me	Me	-	
3.114	SO ₂ Me	CF ₃	H	Me	Me	CH ₂	
3.115	SO ₂ Me	CF ₃	H	Me	Et	-	
3.116	SO ₂ Me	CF ₃	H	Me	Et	CH ₂	
3.117	SO ₂ Me	CF ₃	H	Et	Me	-	
3.118	SO ₂ Me	CF ₃	H	Et	Me	CH ₂	
3.119	SO ₂ Me	CF ₃	H	Et	Et	-	

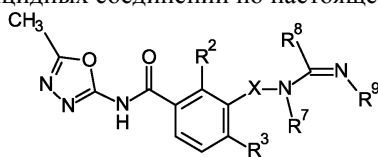
3.120	SO ₂ Me	CF ₃	H	Et	Et	CH ₂	
3.121	SO ₂ Me	SO ₂ Me	H	Me	Me	-	
3.122	SO ₂ Me	SO ₂ Me	H	Me	Me	CH ₂	
3.123	SO ₂ Me	SO ₂ Me	H	Me	Et	-	
3.124	SO ₂ Me	SO ₂ Me	H	Me	Et	CH ₂	
3.125	SO ₂ Me	SO ₂ Me	H	Et	Me	-	
3.126	SO ₂ Me	SO ₂ Me	H	Et	Me	CH ₂	
3.127	SO ₂ Me	SO ₂ Me	H	Et	Et	-	
3.128	SO ₂ Me	SO ₂ Me	H	Et	Et	CH ₂	
3.129	Cl	SO ₂ Me	Me	Me	Me	-CH ₂ O-	δ = 8,12 (d, J=8,1 Гц, 1H), 5,54 (s, 2H), 3,37 (s, 3H), 2,81 (t, J=6,4 Гц, 2H), 2,73 (s, 6H), 2,44 (t, J=6,4 Гц, 2H), 2,13 - 2,02 (m, 2H), 1,92 (s, 3H)
3.130	Cl	CF ₃	H	CF ₃ CH ₂ -	Me	-	1НЯМР(400МГц, d4-метанол): 7,69-7,54(m, 2H), 7,06-6,93(m, 1H), 4,27(q, 0,6H), 4,11(q, 1,4H), 3,17(s, 3H), 2,87-2,40(m, 4H), 2,04(quin, 2H)
3.131	Cl	CF ₃	H	Me	-фенил	-	
3.132	Cl	CF ₃	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -		-	
3.133	Cl	CF ₃	Me	Me	Et	-	
3.134	Cl	CF ₃	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -		-	
3.135	Cl	CF ₃	H	-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -		-	
3.136	Cl	CF ₃	H	Me	Et	-	
3.137	Cl	CF ₃	Me	Me	Me	-CH ₂ CH ₂ -	
3.138	Cl	CF ₃	Me	Me	Me	O	
3.139	Cl	CF ₃	CF ₃	Me	Me	-	
3.140	Cl	CF ₃	H	Me	-iPr	-	
3.141	Cl	SO ₂ Me	H	-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -		-	
3.142	Cl	SO ₂ Me	H	Me	-CH ₂ CF ₃	-	
3.143	Me	SO ₂ Me	H	Me	-CH ₂ CF ₃	-	
3.144	Me	SO ₂ Me	H	Me	-iPr	-	
3.145	Cl	SO ₂ Me	H	Me	-фенил	-	
3.146	Me	SO ₂ Me	H	-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -		-	
3.147	Me	CF ₃	H	-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -		-	
3.148	Cl	CF ₃	Me	Me	Me	-	
3.149	Cl	CHF ₂	H	Me	Me	-	
3.150	Cl	CHF ₂	H	Me	Me	CH ₂	
3.151	Cl	CHF ₂	H	Me	Et	-	
3.152	Cl	CHF ₂	H	Me	Et	CH ₂	
3.153	Cl	CHF ₂	H	Et	Me	-	
3.154	Cl	CHF ₂	H	Et	Me	CH ₂	
3.155	Cl	CHF ₂	H	Et	Et	-	
3.156	Cl	CHF ₂	H	Et	Et	CH ₂	

Таблица 4
Примеры гербицидных соединений по настоящему изобретению



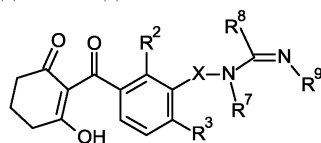
Номер соединения	R ²	R ³	R ⁷	R ⁸	R ⁹	X	¹ H-ЯМР (в CDCl ₃ , если не указано иное)
4.001	Me	Me	Me	Me	MeO	-	
4.002	Me	Me	Me	Me	MeO	CH ₂	
4.003	Me	Cl	Me	Me	MeO	-	
4.004	Me	Cl	Me	Me	MeO	CH ₂	
4.005	Me	CF ₃	Me	Me	MeO	-	
4.006	Me	CF ₃	Me	Me	MeO	CH ₂	
4.007	Me	SO ₂ Me	Me	Me	MeO	-	
4.008	Me	SO ₂ Me	Me	Me	MeO	CH ₂	
4.009	Cl	Me	Me	Me	MeO	-	
4.010	Cl	Me	Me	Me	MeO	CH ₂	
4.011	Cl	Cl	Me	Me	MeO	-	
4.012	Cl	Cl	Me	Me	MeO	CH ₂	
4.013	Cl	CF ₃	Me	Me	MeO	-	
4.014	Cl	CF ₃	Me	Me	MeO	CH ₂	(Метанол) δ = 7,94 - 7,84
							(m, 1H), 7,79 (d, J=8,1 Гц, 1H), 4,67 (s, 2H), 4,08 (s, 3H), 3,68 (s, 3H), 2,51 (s, 3H), 2,05 (s, 3H)
4.015	Cl	SO ₂ Me	Me	Me	MeO	-	
4.016	Cl	SO ₂ Me	Me	Me	MeO	CH ₂	(Метанол) δ = 8,20 (d, J=8,2 Гц, 1H), 7,83 (d, J=8,1 Гц, 1H), 4,95 (s, 2H), 4,06 (s, 3H), 3,68 (s, 3H), 3,27 (s, 3H), 2,60 (s, 3H), 2,06 (s, 3H)
4.017	CF ₃	Me	Me	Me	MeO	-	
4.018	CF ₃	Me	Me	Me	MeO	CH ₂	
4.019	CF ₃	Cl	Me	Me	MeO	-	
4.020	CF ₃	Cl	Me	Me	MeO	CH ₂	
4.021	CF ₃	CF ₃	Me	Me	MeO	-	
4.022	CF ₃	CF ₃	Me	Me	MeO	CH ₂	
4.023	CF ₃	SO ₂ Me	Me	Me	MeO	-	
4.024	CF ₃	SO ₂ Me	Me	Me	MeO	CH ₂	
4.025	SO ₂ Me	Me	Me	Me	MeO	-	
4.026	SO ₂ Me	Me	Me	Me	MeO	CH ₂	
4.027	SO ₂ Me	Cl	Me	Me	MeO	-	
4.028	SO ₂ Me	Cl	Me	Me	MeO	CH ₂	
4.029	SO ₂ Me	CF ₃	Me	Me	MeO	-	
4.030	SO ₂ Me	CF ₃	Me	Me	MeO	CH ₂	
4.031	SO ₂ Me	SO ₂ Me	Me	Me	MeO	-	
4.032	SO ₂ Me	SO ₂ Me	Me	Me	MeO	CH ₂	
4.033	Cl	SO ₂ Me	Me	Me	CN	CH ₂	¹ H ЯМР (400МГц, Метанол) d = 8,29 - 8,22 (m, 1H), 7,99 - 7,88 (m, 1H), 5,37 (s, 2H), 4,06 (s, 3H), 3,93 (s, 1H), 2,95 (s, 2H), 2,83 - 2,78 (m, 1H), 2,68 - 2,65 (m, 1H), 2,47 (s, 2H).
4.034	Cl	CF ₃	Me	Me	CN	CH ₂	¹ H ЯМР (400МГц, Метанол) d = 7,90 (d, J=8,1 Гц, 1H), 7,83 (s, 1H), 5,09 (s, 2H), 4,06 - 3,95 (m, 3H), 2,84 (s, 2,25H), 2,74 (s, 0,75H), 2,64 (s, 0,75H), 2,47 (s, 2,25H)

Таблица 5
Примеры гербицидных соединений по настоящему изобретению



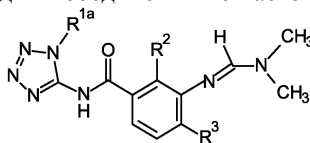
Номер соединения	R ²	R ³	R ⁷	R ⁸	R ⁹	X	¹ H-ЯМР (в CDCl ₃ , если не указано иное)
5.001	Me	Me	Me	Me	MeO	-	
5.002	Me	Me	Me	Me	MeO	CH ₂	
5.003	Me	Cl	Me	Me	MeO	-	
5.004	Me	Cl	Me	Me	MeO	CH ₂	
5.005	Me	CF ₃	Me	Me	MeO	-	
5.006	Me	CF ₃	Me	Me	MeO	CH ₂	
5.007	Me	SO ₂ Me	Me	Me	MeO	-	
5.008	Me	SO ₂ Me	Me	Me	MeO	CH ₂	
5.009	Cl	Me	Me	Me	MeO	-	
5.010	Cl	Me	Me	Me	MeO	CH ₂	
5.011	Cl	Cl	Me	Me	MeO	-	
5.012	Cl	Cl	Me	Me	MeO	CH ₂	
5.013	Cl	CF ₃	Me	Me	MeO	-	
5.014	Cl	CF ₃	Me	Me	MeO	CH ₂	(Метанол) δ = 7,83 (d, J=8,1 Гц, 1H), 7,68 (d, J=8,1 Гц, 1H), 4,65 (s, 2H), 3,68 (s, 3H), 2,55 - 2,44 (m, 6H), 2,04 (s, 3H)
5.015	Cl	SO ₂ Me	Me	Me	MeO	-	
5.016	Cl	SO ₂ Me	Me	Me	MeO	CH ₂	(Метанол) δ = 8,18 (d, J=8,2 Гц, 1H), 7,75 (d, J=8,2 Гц, 1H), 4,94 (s, 2H), 3,67 (s, 3H), 3,27 (s, 3H), 2,59 (s, 3H), 2,51 (s, 3H), 2,06 (s, 3H)
5.017	CF ₃	Me	Me	Me	MeO	-	
5.018	CF ₃	Me	Me	Me	MeO	CH ₂	
5.019	CF ₃	Cl	Me	Me	MeO	-	
5.020	CF ₃	Cl	Me	Me	MeO	CH ₂	
5.021	CF ₃	CF ₃	Me	Me	MeO	-	
5.022	CF ₃	CF ₃	Me	Me	MeO	CH ₂	
5.023	CF ₃	SO ₂ Me	Me	Me	MeO	-	
5.024	CF ₃	SO ₂ Me	Me	Me	MeO	CH ₂	
5.025	SO ₂ Me	Me	Me	Me	MeO	-	
5.026	SO ₂ Me	Me	Me	Me	MeO	CH ₂	
5.027	SO ₂ Me	Cl	Me	Me	MeO	-	
5.028	SO ₂ Me	Cl	Me	Me	MeO	CH ₂	
5.029	SO ₂ Me	CF ₃	Me	Me	MeO	-	
5.030	SO ₂ Me	CF ₃	Me	Me	MeO	CH ₂	
5.031	SO ₂ Me	SO ₂ Me	Me	Me	MeO	-	
5.032	SO ₂ Me	SO ₂ Me	Me	Me	MeO	CH ₂	
5.033	Cl	SO ₂ Me	Me	Me	CN	CH ₂	
5.034	Cl	CF ₃	Me	Me	CN	CH ₂	

Таблица 6
Примеры гербицидных соединений по настоящему изобретению



Номер соединения	R ²	R ³	R ⁷	R ⁸	R ⁹	X	¹ H-ЯМР (в CDCl ₃ , если не указано иное)
6.001	Me	Me	Me	Me	MeO	-	
6.002	Me	Me	Me	Me	MeO	CH ₂	
6.003	Me	Cl	Me	Me	MeO	-	
6.004	Me	Cl	Me	Me	MeO	CH ₂	
6.005	Me	CF ₃	Me	Me	MeO	-	
6.006	Me	CF ₃	Me	Me	MeO	CH ₂	
6.007	Me	SO ₂ Me	Me	Me	MeO	-	
6.008	Me	SO ₂ Me	Me	Me	MeO	CH ₂	
6.009	Cl	Me	Me	Me	MeO	-	
6.010	Cl	Me	Me	Me	MeO	CH ₂	
6.011	Cl	Cl	Me	Me	MeO	-	
6.012	Cl	Cl	Me	Me	MeO	CH ₂	
6.013	Cl	CF ₃	Me	Me	MeO	-	
6.014	Cl	CF ₃	Me	Me	MeO	CH ₂	
6.015	Cl	SO ₂ Me	Me	Me	MeO	-	
6.016	Cl	SO ₂ Me	Me	Me	MeO	CH ₂	
6.017	CF ₃	Me	Me	Me	MeO	-	
6.018	CF ₃	Me	Me	Me	MeO	CH ₂	
6.019	CF ₃	Cl	Me	Me	MeO	-	
6.020	CF ₃	Cl	Me	Me	MeO	CH ₂	
6.021	CF ₃	CF ₃	Me	Me	MeO	-	
6.022	CF ₃	CF ₃	Me	Me	MeO	CH ₂	
6.023	CF ₃	SO ₂ Me	Me	Me	MeO	-	
6.024	CF ₃	SO ₂ Me	Me	Me	MeO	CH ₂	
6.025	SO ₂ Me	Me	Me	Me	MeO	-	
6.026	SO ₂ Me	Me	Me	Me	MeO	CH ₂	
6.027	SO ₂ Me	Cl	Me	Me	MeO	-	
6.028	SO ₂ Me	Cl	Me	Me	MeO	CH ₂	
6.029	SO ₂ Me	CF ₃	Me	Me	MeO	-	
6.030	SO ₂ Me	CF ₃	Me	Me	MeO	CH ₂	
6.031	SO ₂ Me	SO ₂ Me	Me	Me	MeO	-	
6.032	SO ₂ Me	SO ₂ Me	Me	Me	MeO	CH ₂	
6.033	Cl	SO ₂ Me	Me	Me	CN	CH ₂	
6.034	Cl	CF ₃	Me	Me	CN	CH ₂	

Таблица 7
Примеры гербицидных соединений по настоящему изобретению



Номер соединения	R ^{1a}	R ²	R ³	¹ H-ЯМР (в CDCl ₃ , если не указано иное)
7.001	Et	Me	SO ₂ Me	7,95 (d, 1H), 7,33 (d, 1H), 7,27 (s, 1H), 4,47 (q, J=7,3 Гц, 2H), 3,22 (s, 3H), 3,07 (br d, 6H), 2,31 (s, 3H), 2,08 (s, 3H), 1,64 (t, J=7,3 Гц, 4H)
7.002	nPr	Me	SO ₂ Me	¹ HЯМР(400МГц,d4-метанол)7,89(d,1H),7,38-7,30(m,2H), 5,49(s,1H), 4,34(t,2H), 3,23(s,3H), 3,08(brd,6H), 2,28(s,3H), 2,08-1,93(m,2H), 0,98(t,3H)
7.003	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	Me	SO ₂ Me	9,74-9,22(m,1H), 7,94(d,1H), 7,26-7,23 (m, 2H), 4,62(t,2H), 3,84(t,2H), 3,37(s,3H), 3,22(s,3H), 3,07(d,6H), 2,33(s,3H)

Биологические примеры

Семена ряда тестируемых видов высевали в стандартную почву в горшках: (*Lolium perenne* (LOLPE), *Amaranthus retroflexus* (AMARE), *Abutilon theophrasti* (ABUTH), *Setaria faberi* (SETFA), *Echinochloa crus-galli* (ECHCG), *Ipomoea hederacea* (IPOHE)). После культивирования в течение одного дня (до появления всходов) или после 8 дней культивирования (после появления всходов) в контролируемых условиях в теплице (при 24/16°C, день/ночь; 14 ч светового периода; 65% влажности), растения опрыскивали водным раствором для опрыскивания, полученным из состава с техническим активным ингредиентом в растворе ацетон/вода (50:50), содержащем 0,5% Tween 20 (полиоксиэтиленсорбитанмонолаурат, CAS RN 9005-64-5). Соединения применяли при 500 г/га, если не указано иное. Затем тестируемые растения выращивали в теплице при контролируемых условиях в теплице (при 24/16°C, день/ночь; 14 ч светового периода; 65% влажности) и поливали дважды в день. Через 13 дней в случае применения до и после появления всходов тестируемое растение оценивали в отношении степени нанесенного растению повреждения в процентах. Значения биологической активности показаны в следующей таблице по пяти-балльной шкале (5=80-100%; 4=60-79%; 3=40-59%; 2=20-39%; 1=0-19%).

Таблица В1

Соединение	Применение ПОСЛЕ появления всходов					Применение ДО появления всходов				
	AMARE	ABUTH	SETFA	ECHCG	IPOHE	AMARE	ABUTH	SETFA	ECHCG	IPOHE
1.017	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5
1.025	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5
1.027	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5
1.031	5	5	5	5	5	5	5	5	5	4
1.041	5	5	5	5	5	5	5	-	5	5
1.049	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5
1.055	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5
1.057**	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5
1.129	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5
1.130	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5
1.131	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5
1.132	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5
1.135*	5	5	5	3	5	5	5	5	5	5
1.139	5	5	5	5	4	5	5	5	5	5
1.140	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5
1.142*	5	5	5	5	5	5	5	5	5	4
1.144	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5
1.145	4	3	5	5	4	5	5	5	5	4
1.148	5	4	5	5	4	5	5	5	5	5
2.017	5	4	5	5	4	5	5	4	5	5
2.025	5	5	5	5	5	5	5	5	5	3
2.027	5	5	5	5	5	5	5	5	5	4
2.031	5	5	5	5	4	5	4	5	5	4
2.049	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5
2.055	5	4	5	5	4	5	5	5	5	5
2.129	5	5	5	5	5	5	5	3	3	2
2.131	5	4	5	5	3	5	3	5	5	2

2.132	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5
2.140	5	5	5	5	4	5	5	5	5	4
2.142*	5	5	5	5	5	5	3	5	5	1
2.143	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5
2.144	5	5	5	5	4	5	5	5	5	3
2.148	5	5	5	5	3	5	5	5	5	5
3.017	3	5	5	5	5	5	5	4	5	5
3.025	5	5	5	5	5	5	5	4	5	4
3.049	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5
3.057	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5
3.130	5	5	5	5	4	5	5	5	5	5
4.014	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5
4.016	4	3	5	5	4	5	5	5	5	5
5.016	4	3	5	5	4	5	5	5	5	5
7.002	5	5	5	5	4	5	5	5	5	5
7.003	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5

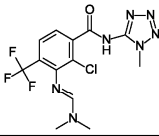
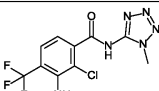
(-)=Нет данных.

* Применение при 250 г/га.

** Применение при 125 г/га.

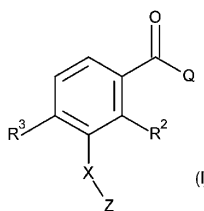
Таблица В2

Сравнительный эксперимент проводили для демонстрации преимущества, обеспечиваемого соединением по настоящему изобретению. Таким образом, биологическую эффективность соединения 1.049 по настоящему изобретению сравнивали с соединением C1, которое представляет собой соединение на основе анилина того типа, который указан в WO2012/028579. Результаты представлены в виде (%) наблюдаемой фитотоксичности. Результат демонстрирует, что соединения по настоящему изобретению обеспечивают значительно улучшенный контроль проблемных видов сорняков, например, при применении на *Echinochloa crus-galli* (ECHCG) и *Setaria faberi* (SETFA) при сходных нормах применения

Соединение	Норма г/ га	Применение ПОСЛЕ появления всходов	Применение ДО появления всходов		
		ECHCG	SETFA	ECHCG	SETFA
1.049		90	90	90	90
C1					
	31	0	20	0	0

ФОРМУЛА ИЗОБРЕТЕНИЯ

1. Соединение формулы (I)

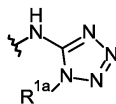


или его агрономически приемлемая соль,

где R^2 выбран из группы, состоящей из галогена, C_1 - C_6 алкила, C_3 - C_6 циклоалкила, C_1 - C_6 галогеналкила и $-S(O)_pC_1$ - C_6 алкила;

R^3 выбран из группы, состоящей из галогена, C_1 - C_6 алкила, C_1 - C_6 галогеналкила и $-S(O)_pC_1$ - C_6 алкила;

Q представляет собой Q^1 :

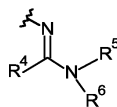


Q^1 ;

R^{1a} представляет собой C_1 - C_4 алкил- или C_1 - C_3 -алкокси- C_1 - C_3 -алкил-;

X представляет собой $-(CH_2)_n-$, и n равняется 0;

Z представляет собой Z^1 :



R^4 выбран из группы, состоящей из водорода, C_1 - C_6 алкила, C_1 - C_6 галогеналкила и C_3 - C_6 циклоалкила;

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

R^6 выбран из группы, состоящей из водорода, C_1 - C_6 алкила, C_1 - C_6 галогеналкила, циано и фенила, где фенил необязательно замещен 1, 2 или 3 заместителями, выбранными из группы, состоящей из галогена, C_1 - C_6 алкила, C_1 - C_6 галогеналкила и C_1 - C_6 алкокси; или

R^5 и R^6 вместе представляют собой $-CH_2CH_2CH_2CH_2-$, $-CH_2CH_2CH_2CH_2CH_2-$ или $-CH_2CH_2OCH_2CH_2-$; и

$p=0, 1$ или 2 .

2. Соединение по п.1, где R^2 выбран из группы, состоящей из метила, Cl , $-CF_3$ и $-SO_2$ метила.

3. Соединение по п.1, где R^3 выбран из группы, состоящей из метила, Cl , $-CF_3$ и $-SO_2$ метила.

4. Соединение по любому из предыдущих пунктов, где R^{1a} выбран из группы, состоящей из метила, этила и n -пропила.

5. Гербицидная композиция, содержащая соединение по любому из пп.1-4 и приемлемое с точки зрения сельского хозяйства вспомогательное средство для составления.

6. Гербицидная композиция по п.5, дополнительно содержащая по меньшей мере один дополнительный гербицид или антидот гербицида.

7. Способ контроля сорняков в месте произрастания, включающий применение по отношению к месту произрастания достаточного для контроля сорняков количества композиции по любому из пп.5, 6.

8. Применение соединения формулы (I) по п.1 в качестве гербицида.

