

RU 2710379 C2



(19) RU (11) 2 710 379<sup>(13)</sup> C2

(51) МПК  
*C07D 207/277 (2006.01)* *A01N 43/40 (2006.01)*  
*C07D 401/10 (2006.01)* *A01N 43/56 (2006.01)*  
*C07D 403/10 (2006.01)* *A01N 43/66 (2006.01)*  
*C07D 403/12 (2006.01)* *A01N 43/713 (2006.01)*  
*C07D 405/10 (2006.01)*  
*C07D 405/12 (2006.01)*  
*C07D 413/12 (2006.01)*  
*C07D 417/10 (2006.01)*  
*C07D 417/12 (2006.01)*  
*A01N 43/36 (2006.01)*

(12) ОПИСАНИЕ ИЗОБРЕТЕНИЯ К ПАТЕНТУ

(52) СПК

*A01N 43/36 (2019.08); A01N 43/40 (2019.08); A01N 43/56 (2019.08); A01N 43/66 (2019.08); A01N 43/713 (2019.08); C07D 207/277 (2019.08); C07D 211/36 (2019.08); C07D 401/10 (2019.08); C07D 403/10 (2019.08); C07D 403/12 (2019.08); C07D 405/10 (2019.08); C07D 405/12 (2019.08); C07D 413/10 (2019.08); C07D 413/12 (2019.08); C07D 417/10 (2019.08); C07D 417/12 (2019.08); C07D 471/04 (2019.08)*

(21)(22) Заявка: 2017134986, 29.03.2016

(24) Дата начала отсчета срока действия патента:  
29.03.2016

Дата регистрации:  
26.12.2019

Приоритет(ы):

(30) Конвенционный приоритет:  
10.04.2015 US 62/145,598

(43) Дата публикации заявки: 10.04.2019 Бюл. № 10

(45) Опубликовано: 26.12.2019 Бюл. № 36

(85) Дата начала рассмотрения заявки РСТ на  
национальной фазе: 05.10.2017

(86) Заявка РСТ:  
US 2016/024669 (29.03.2016)

(87) Публикация заявки РСТ:  
WO 2016/164201 (13.10.2016)

Адрес для переписки:  
129090, Москва, ул. Б.Спасская, 25, строение 3,  
ООО "Юридическая фирма Городисский и  
Партнеры"

(72) Автор(ы):

ТАГГИ Эндрю Эдмунд (US),  
БЕРЕЗНАК Джеймс Фрэнсис (US),  
САТТЕРФИЛД Эндрю Дункан (US)

(73) Патентообладатель(и):  
ЭфЭмСи Корпорейшн (US)

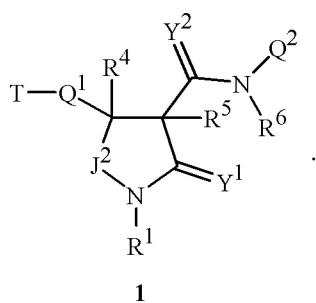
(56) Список документов, цитированных в отчете  
о поиске: WO 1990007500 A1, 12.07.1990. US  
4874422 A, 17.10.1989. RU 2004107485 A,  
27.03.2005. RU 2125050 C1, 20.01.1999.

(54) ЗАМЕЩЕННЫЕ ЦИКЛИЧЕСКИЕ АМИДЫ В КАЧЕСТВЕ ГЕРБИЦИДОВ

(57) Реферат:  
Изобретение относится к соединению  
формулы 1:

R U 2 7 1 0 3 7 9 C 2

R U 2 7 1 0 3 7 9 C 2



Значения  $R^1$ ,  $R^4$ ,  $R^5$ ,  $R^6$ ,  $Q^1$ ,  $Q^2$ ,  $Y^1$ ,  $Y^2$ ,  $T$  и  $J^2$  приведены в формуле изобретения. Также предложены гербицидные композиции и способ контроля роста нежелательной растительности. Соединение формулы 1 может применяться в сельском хозяйстве в качестве гербицидов для борьбы с нежелательной растительностью. 4 н. и 6 з.п. ф-лы, 20 табл., 13 пр.

R U 2 7 1 0 3 7 9 C 2

RU 2710379 C2

RUSSIAN FEDERATION



FEDERAL SERVICE  
FOR INTELLECTUAL PROPERTY

(19) RU (11) 2 710 379<sup>(13)</sup> C2

(51) Int. Cl.  
*C07D 207/277 (2006.01)* *A01N 43/40 (2006.01)*  
*C07D 401/10 (2006.01)* *A01N 43/56 (2006.01)*  
*C07D 403/10 (2006.01)* *A01N 43/66 (2006.01)*  
*C07D 403/12 (2006.01)* *A01N 43/713 (2006.01)*  
*C07D 405/10 (2006.01)*  
*C07D 405/12 (2006.01)*  
*C07D 413/12 (2006.01)*  
*C07D 417/10 (2006.01)*  
*C07D 417/12 (2006.01)*  
*A01N 43/36 (2006.01)*

(12) ABSTRACT OF INVENTION

(52) CPC

*A01N 43/36 (2019.08); A01N 43/40 (2019.08); A01N 43/56 (2019.08); A01N 43/66 (2019.08); A01N 43/713 (2019.08); C07D 207/277 (2019.08); C07D 211/36 (2019.08); C07D 401/10 (2019.08); C07D 403/10 (2019.08); C07D 403/12 (2019.08); C07D 405/10 (2019.08); C07D 405/12 (2019.08); C07D 413/10 (2019.08); C07D 413/12 (2019.08); C07D 417/10 (2019.08); C07D 417/12 (2019.08); C07D 471/04 (2019.08)*

(21)(22) Application: 2017134986, 29.03.2016

(24) Effective date for property rights:  
29.03.2016

Registration date:  
26.12.2019

Priority:

(30) Convention priority:  
10.04.2015 US 62/145,598

(43) Application published: 10.04.2019 Bull. № 10

(45) Date of publication: 26.12.2019 Bull. № 36

(85) Commencement of national phase: 05.10.2017

(86) PCT application:  
US 2016/024669 (29.03.2016)

(87) PCT publication:  
WO 2016/164201 (13.10.2016)

Mail address:  
129090, Moskva, ul. B.Spasskaya, 25, stroenie 3,  
OOO "Yuridicheskaya firma Gorodisskij  
Partnery"

(72) Inventor(s):

TAGGI, Andrew Edmund (US),  
BEREZNAK, James Francis (US),  
SATTERFIELD, Andrew Duncan (US)

(73) Proprietor(s):

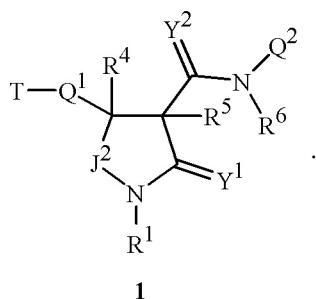
FMC Corporation (US)

RU

2710379

C2

R U 2 7 1 0 3 7 9 C 2



Values of  $R^1$ ,  $R^4$ ,  $R^5$ ,  $R^6$ ,  $Q^1$ ,  $Q^2$ ,  $Y^1$ ,  $Y^2$ ,  $T$  and  $J^2$  are given in the claim. Also disclosed are herbicidal compositions and a method of controlling growth of undesirable vegetation.

EFFECT: compound of formula 1 can be used in agriculture as herbicides for controlling undesirable vegetation.

10 cl, 20 tbl, 13 ex

R U 2 7 1 0 3 7 9 C 2

## ОБЛАСТЬ ТЕХНИКИ, К КОТОРОЙ ОТНОСИТСЯ ИЗОБРЕТЕНИЕ

Настоящее изобретение относится к определенным замещенным циклическим амидам, их *N*-оксидам и солям, а также к композициям и способам их применения для борьбы с нежелательной растительностью.

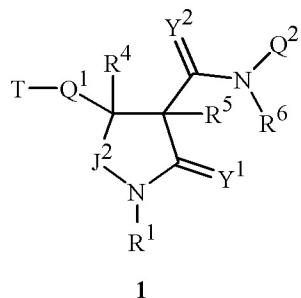
## 5 ПРЕДПОСЫЛКИ ИЗОБРЕТЕНИЯ

Контроль нежелательной растительности чрезвычайно важен для достижения высокой производительности сельскохозяйственных культур. Достижение избирательного контроля роста сорняков, особенно в таких полезных сельскохозяйственных культурах, как рис, соя, сахарная свекла, майс, картофель, пшеница, ячмень, томат и плантационные культуры, среди прочих, является крайне необходимым. Бесконтрольный рост сорняков в таких полезных сельскохозяйственных культурах может вызывать значительное снижение продуктивности и, таким образом, приводить в результате к повышению затрат для потребителя. Контроль нежелательной растительности на незасеваемых участках также является важным. Для этих целей коммерчески доступно множество 10 продуктов, однако остается потребность в новых соединениях, которые являются более эффективными, менее дорогостоящими, менее токсичными, более безопасными для окружающей среды или имеют различные участки приложения действия.

## 15 КРАТКОЕ ОПИСАНИЕ ИЗОБРЕТЕНИЯ

Настоящее изобретение относится к соединениям формулы 1 (в том числе всем

20 стереоизомерам), их *N*-оксидам и солям, к содержащим их композициям для применения в сельском хозяйстве и к их применению в качестве гербицидов:



30 где

$Q^1$  представляет собой фенильное кольцо или нафталинильную кольцевую систему, причем каждое кольцо или кольцевая система необязательно замещены 1-4

35 заместителями, независимо выбранными из  $R^7$ ; или 5-6-членное гетероароматическое кольцо или 8-10-членную гетероароматическую бициклическую кольцевую систему, причем каждое кольцо или кольцевая система содержат члены кольца, выбранные из атомов углерода и 1-4 гетероатомов, независимо выбранных из не более 2 атомов O, не более 2 атомов S и не более 4 атомов N, причем не более 3 членов кольца, представляющих собой атом углерода, независимо выбраны из C(=O) и C(=S), а члены 40 кольца, представляющие собой атом серы, независимо выбраны из S(=O)<sub>u</sub>(=NR<sup>8</sup>)<sub>v</sub>, причем каждое кольцо или кольцевая система необязательно замещены не более 4 заместителями, независимо выбранными из  $R^7$  при членах кольца, представляющих собой атом углерода, и выбранными из  $R^9$  при членах кольца, представляющих собой 45 атом азота;

$Q^2$  представляет собой фенильное кольцо или нафталинильную кольцевую систему, причем каждое кольцо или кольцевая система необязательно замещены не более 5 заместителями, независимо выбранными из  $R^{10}$ ; или 5-6-членное гетероароматическое

кольцо или 8-10-членную гетероароматическую бициклическую кольцевую систему, причем каждое кольцо или кольцевая система содержат члены кольца, выбранные из атомов углерода и 1-4 гетероатомов, независимо выбранных из не более 2 атомов O, не более 2 атомов S и не более 4 атомов N, причем не более 3 членов кольца,

- 5 представляющих собой атом углерода, независимо выбраны из C(=O) и C(=S), а члены кольца, представляющие собой атом серы, независимо выбраны из S(=O)<sub>u</sub>(=NR<sup>8</sup>)<sub>v</sub>, причем каждое кольцо или кольцевая система необязательно замещены не более 5 заместителями, независимо выбранными из R<sup>10</sup> при членах кольца, представляющих 10 собой атом углерода, и выбранными из R<sup>11</sup> при членах кольца, представляющих собой атом азота;

Т представляет собой J<sup>1</sup>-A-, при этом свободная связь, направленная вправо, рядом с A указывает на точку соединения J<sup>1</sup>-A- с Q<sup>1</sup>; или

- 15 Т представляет собой R<sup>17</sup>ON=CR<sup>17a</sup>-, (R<sup>18</sup>)<sub>2</sub>C=NO-, (R<sup>19</sup>)<sub>2</sub>NN=CR<sup>17a</sup>-, (R<sup>18</sup>)<sub>2</sub>C=NNR<sup>20a</sup>-, R<sup>20</sup>N=CR<sup>17a</sup>-, (R<sup>18</sup>)<sub>2</sub>C=N-, R<sup>17</sup>ON=CR<sup>17a</sup>C(R<sup>23b</sup>)<sub>2</sub>- или (R<sup>18</sup>)<sub>2</sub>C=NOC(R<sup>24a</sup>)<sub>2</sub>-, при этом 20 свободная связь, направленная вправо, указывает на точку соединения с Q<sup>1</sup>;

А представляет собой насыщенную, частично ненасыщенную или полностью 25 ненасыщенную цепь, содержащую 1-3 атома, выбранных из не более 3 атомов углерода, не более 1 атома O, не более 1 атома S и не более 2 атомов N, причем цепь необязательно замещена не более 2 заместителями, независимо выбранными из R<sup>15</sup> при атомах углерода и R<sup>16</sup> при атомах азота;

- 25 каждый из Y<sup>1</sup> и Y<sup>2</sup> независимо представляет собой O, S или NR<sup>12</sup>;

J<sup>1</sup> представляет собой фенильное кольцо или нафталинильную кольцевую систему, причем каждое кольцо или кольцевая система необязательно замещены не более 5 заместителями, независимо выбранными из R<sup>7</sup>; или 4-6-членное гетероциклическое 30 кольцо или 8-10-членную гетероароматическую бициклическую кольцевую систему, причем каждое кольцо или кольцевая система содержат члены кольца, выбранные из атомов углерода и 1-4 гетероатомов, независимо выбранных из не более 2 атомов O, не более 2 атомов S и не более 4 атомов N, причем не более 3 членов кольца, представляющих собой атом углерода, независимо выбраны из C(=O) и C(=S), а члены 35 кольца, представляющие собой атом серы, независимо выбраны из S(=O)<sub>u</sub>(=NR<sup>8</sup>)<sub>v</sub>, причем каждое кольцо или кольцевая система необязательно замещены не более 5 заместителями, независимо выбранными из R<sup>7</sup> при членах кольца, представляющих собой атом углерода, и выбранными из R<sup>9</sup> при членах кольца, представляющих собой 40 атом азота; или C<sub>4</sub>-C<sub>10</sub>циклоалкилалкокси, C<sub>4</sub>-C<sub>10</sub>циклоалкилалкил, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>алкенилокси, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>галогеналкенилокси, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>алкоксиалкокси, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>алкилтиоалкил, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>алкилсульфинилалкил, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>алкилсульфонилалкил, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>алкилсульфонилокси, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>галогеналкилсульфонилокси, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>галогеналкилтио, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>галогеналкилтио, 45 C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>циклоалкилтио, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>алкилсульфинил, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>галогеналкилсульфинил, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>алкилсульфонил, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>галогеналкисульфонил, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>алкинил, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>галогеналкинил, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>алкоксиалкил, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>галогеналкоксиалкил,

С<sub>3</sub>-С<sub>8</sub>галогеналкоксиалкокси, С<sub>2</sub>-С<sub>8</sub>галогеналкоксигалогеналкил, С<sub>1</sub>-С<sub>8</sub>галогеналкил, С<sub>3</sub>-С<sub>8</sub>галогенцилоалкил, С<sub>2</sub>-С<sub>8</sub>алкилкарбонилокси или С<sub>2</sub>-С<sub>8</sub>галогеналкилкарбонилокси;

5 J<sup>2</sup> представляет собой -CR<sup>2</sup>R<sup>3</sup>- или -CR<sup>2</sup>R<sup>3</sup>-CR<sup>2a</sup>R<sup>3a</sup>-, где фрагмент -CR<sup>2</sup>R<sup>3</sup>- соединен с N;

R<sup>1</sup> представляет собой Н, гидрокси, амино, циано, формил, С<sub>3</sub>-С<sub>8</sub>алкилкарбонилалкил, -CPh=N-O(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>алкил), -C(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>алкил)=N-O(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>алкил), -C(O)NH<sub>2</sub>, С<sub>1</sub>-С<sub>6</sub>алкил,

С<sub>1</sub>-С<sub>6</sub>галогеналкил, С<sub>2</sub>-С<sub>6</sub>алкенил, С<sub>3</sub>-С<sub>6</sub>алкинил, С<sub>2</sub>-С<sub>6</sub>цианоалкил, С<sub>3</sub>-С<sub>6</sub>цилоалкил,

10 С<sub>4</sub>-С<sub>8</sub>цилоалкилалкил, С<sub>2</sub>-С<sub>8</sub>алкоксиалкил, С<sub>3</sub>-С<sub>8</sub>алкоксиалкоксиалкил,

С<sub>2</sub>-С<sub>8</sub>галогеналкоксиалкил, С<sub>2</sub>-С<sub>8</sub>алкилтиоалкил, С<sub>2</sub>-С<sub>8</sub>алкилсульфинилалкил,

С<sub>2</sub>-С<sub>8</sub>алкилсульфонилалкил, С<sub>2</sub>-С<sub>8</sub>алкилкарбонил, С<sub>2</sub>-С<sub>8</sub>галогеналкилкарбонил,

С<sub>4</sub>-С<sub>10</sub>цилоалкилкарбонил, С<sub>2</sub>-С<sub>8</sub>алкоксикарбонил, С<sub>2</sub>-С<sub>8</sub>галогеналкоксикарбонил,

15 С<sub>4</sub>-С<sub>10</sub>цилоалкоцикарбонил, С<sub>2</sub>-С<sub>8</sub>алкиламинокарбонил,

С<sub>3</sub>-С<sub>10</sub>диалкиламинокарбонил, С<sub>4</sub>-С<sub>10</sub>цилоалкиламинокарбонил, С<sub>1</sub>-С<sub>6</sub>алкокси,

С<sub>1</sub>-С<sub>6</sub>алкилтио, С<sub>1</sub>-С<sub>6</sub>галогеналкилтио, С<sub>3</sub>-С<sub>8</sub>цилоалкилтио, С<sub>1</sub>-С<sub>6</sub>алкилсульфинил,

С<sub>1</sub>-С<sub>6</sub>галогеналкилсульфинил, С<sub>3</sub>-С<sub>8</sub>цилоалкилсульфинил, С<sub>1</sub>-С<sub>6</sub>алкилсульфонил,

20 С<sub>1</sub>-С<sub>6</sub>галогеналкилсульфонил, С<sub>3</sub>-С<sub>8</sub>цилоалкилсульфонил, С<sub>1</sub>-С<sub>6</sub>алкиламиносульфонил,

С<sub>2</sub>-С<sub>8</sub>диалкиламиносульфонил, С<sub>3</sub>-С<sub>10</sub>триалкилсилил, фенилкарбонил или G<sup>1</sup>;

каждый из R<sup>2</sup> и R<sup>3</sup> независимо представляет собой Н, галоген, гидрокси, С<sub>1</sub>-С<sub>4</sub>алкил, С<sub>1</sub>-С<sub>4</sub>галогеналкил или С<sub>1</sub>-С<sub>4</sub>алкокси; или

25 R<sup>2</sup> и R<sup>3</sup> взяты вместе с атомом углерода, с которым они связаны, с образованием С<sub>3</sub>-С<sub>7</sub>цилоалкильного кольца;

каждый из R<sup>2a</sup> и R<sup>3a</sup> независимо представляет собой Н, галоген или С<sub>1</sub>-С<sub>4</sub>алкил; или

30 R<sup>2a</sup> и R<sup>3a</sup> взяты вместе с атомом углерода, с которым они связаны, с образованием С<sub>3</sub>-С<sub>7</sub>цилоалкильного кольца;

каждый из R<sup>4</sup> и R<sup>5</sup> независимо представляет собой Н, галоген, гидроксил, С<sub>1</sub>-С<sub>4</sub>алкокси или С<sub>1</sub>-С<sub>4</sub>алкил;

35 R<sup>6</sup> представляет собой Н, гидрокси, амино, С<sub>1</sub>-С<sub>6</sub>алкил, С<sub>1</sub>-С<sub>6</sub>галогеналкил,

С<sub>2</sub>-С<sub>6</sub>алкенил, С<sub>3</sub>-С<sub>6</sub>алкинил, С<sub>2</sub>-С<sub>8</sub>алкоксиалкил, С<sub>2</sub>-С<sub>8</sub>галогеналкоксиалкил,

С<sub>2</sub>-С<sub>8</sub>алкилтиоалкил, С<sub>2</sub>-С<sub>8</sub>алкилсульфинилалкил, С<sub>2</sub>-С<sub>8</sub>алкилсульфонилалкил,

С<sub>2</sub>-С<sub>8</sub>алкилкарбонил, С<sub>2</sub>-С<sub>8</sub>галогеналкилкарбонил, С<sub>4</sub>-С<sub>10</sub>цилоалкилкарбонил,

40 С<sub>2</sub>-С<sub>8</sub>алкоксикарбонил, С<sub>2</sub>-С<sub>8</sub>галогеналкоксикарбонил, С<sub>4</sub>-С<sub>10</sub>цилоалкоцикарбонил,

С<sub>2</sub>-С<sub>8</sub>алкиламинокарбонил, С<sub>3</sub>-С<sub>10</sub>диалкиламинокарбонил,

С<sub>4</sub>-С<sub>10</sub>цилоалкиламинокарбонил, С<sub>1</sub>-С<sub>6</sub>алкокси, С<sub>1</sub>-С<sub>6</sub>алкилтио, С<sub>1</sub>-С<sub>6</sub>галогеналкилтио,

С<sub>3</sub>-С<sub>8</sub>цилоалкилтио, С<sub>1</sub>-С<sub>6</sub>алкилсульфинил, С<sub>1</sub>-С<sub>6</sub>галогеналкилсульфинил,

45 С<sub>3</sub>-С<sub>8</sub>цилоалкилсульфинил, С<sub>1</sub>-С<sub>6</sub>алкилсульфонил, С<sub>1</sub>-С<sub>6</sub>галогеналкилсульфонил,

С<sub>3</sub>-С<sub>8</sub>цилоалкилсульфонил, С<sub>1</sub>-С<sub>6</sub>алкиламиносульфонил, С<sub>2</sub>-С<sub>8</sub>диалкиламиносульфонил,

С<sub>3</sub>-С<sub>10</sub>триалкилсилил или G<sup>1</sup>;

каждый  $R^7$  независимо представляет собой галоген, гидроксил, циано, нитро,  $C_1$ - $C_4$ алкил,  $C_1$ - $C_4$ цианоалкил,  $C_1$ - $C_4$ цианоалкокси,  $C_1$ - $C_4$ галогеналкил,  $C_2$ - $C_4$ алкенил,  $C_2$ - $C_4$ галогеналкенил,  $C_2$ - $C_4$ алкинил,  $C_2$ - $C_4$ галогеналкинил,  $C_1$ - $C_4$ нитроалкил,  $C_2$ - $C_4$ нитроалкенил,  $C_2$ - $C_4$ алкоксиалкил,  $C_3$ - $C_8$ алкоксиалкоксиалкил,  $C_2$ - $C_4$ галогеналкоксиалкил,  $C_3$ - $C_4$ циклоалкил,  $C_3$ - $C_4$ галогенциклоалкил, циклопропилметил, 1-метилциклопропил, 2-метилциклопропил,  $C_1$ - $C_4$ алкокси,  $C_1$ - $C_4$ галогеналкокси,  $C_2$ - $C_4$ алкенилокси,  $C_2$ - $C_4$ галогеналкенилокси,  $C_3$ - $C_4$ алкинилокси,  $C_3$ - $C_4$ галогеналкинилокси,  $C_3$ - $C_4$ циклоалкокси,  $C_1$ - $C_4$ алкилтио,  $C_1$ - $C_4$ галогеналкилтио,  $C_1$ - $C_4$ алкилсульфинил,  $C_1$ - $C_4$ галогеналкилсульфинил,  $C_1$ - $C_4$ алкилсульфонил,  $C_1$ - $C_4$ галогеналкилсульфонил, гидрокси,  $-CHO$ ,  $C_2$ - $C_4$ алкилкарбонил,  $C_2$ - $C_4$ алкилкарбонилокси,  $C_1$ - $C_4$ алкилсульфонилокси,  $C_1$ - $C_4$ галогеналкилсульфонилокси, амино,  $C_1$ - $C_4$ алкиламино,  $C_2$ - $C_4$ диалкиламино, формиламино,  $C_2$ - $C_4$ алкилкарбониламино,  $-SF_5$ ,  $-SCN$ ,  $C_3$ - $C_4$ триалкилсилил, trimetilsiiliilmetil или trimetilsiiliilmetoksi; или два смежных  $R^7$  взяты вместе с атомами углерода, с которыми они связаны, с образованием  $C_3$ - $C_7$ циклоалкильного кольца;

20 каждый R<sup>10</sup> независимо представляет собой галоген, гидроксил, циано, нитро, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>алкил, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>галогеналкил, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>нитроалкил, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>алкенил, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>алкоксиалкил, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>алкоксиалкоксиалкил, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>дианоалкил, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>дианоалкокси, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>галогеналкенил, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>нитроалкенил, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>алкинил, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>галогеналкинил, C<sub>4</sub>-C<sub>10</sub>циклоалкилалкил, C<sub>4</sub>-C<sub>10</sub>галогенциклоалкилалкил, C<sub>5</sub>-C<sub>12</sub>алкилциклоалкилалкил, C<sub>5</sub>-C<sub>12</sub>циклоалкилалкенил, C<sub>5</sub>-C<sub>12</sub>циклоалкилалкинил, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>циклоалкил, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>галогенциклоалкил, C<sub>4</sub>-C<sub>10</sub>алкилциклоалкил, C<sub>6</sub>-C<sub>12</sub>циклоалкилциклоалкил, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>циклоалкенил, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>галогенциклоалкенил, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>алкоксиалкил, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>галогеналкоксиалкил, C<sub>4</sub>-C<sub>10</sub>циклоалкоксиалкил, C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub>алкоксиалкоксиалкил, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>алкилтиоалкил, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>алкилсульфинилалкил, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>алкилсульфонилалкил, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>алкиламиноалкил, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>галогеналкиламиноалкил, C<sub>4</sub>-C<sub>10</sub>циклоалкиламиноалкил, C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub>диалкиламиноалкил, -CHO, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>алкилкарбонил, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>галогеналкилкарбонил, C<sub>4</sub>-C<sub>10</sub>циклоалкилкарбонил, -C(=O)OH, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>алкоксикарбонил, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>галогеналкоксикарбонил, C<sub>4</sub>-C<sub>10</sub>циклоалкоксикарбонил, C<sub>5</sub>-C<sub>12</sub>циклоалкилалкоксикарбонил, -C(=O)NH<sub>2</sub>, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>алкиламинокарбонил, C<sub>4</sub>-C<sub>10</sub>циклоалкиламинокарбонил, C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub>диалкиламинокарбонил, гидрокси, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>алкокси, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>галогеналкокси, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>алкоксиалкокси, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>алкенилокси, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>галогеналкенилокси, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>алкинилокси, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>галогеналкинилокси, C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub>алкилкарбонилалкокси, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>алкилкарбониллокси, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>галогеналкилкарбониллокси, C<sub>4</sub>-C<sub>10</sub>циклоалкилкарбониллокси, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>алкилсульфониллокси, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>галогеналкилсульфониллокси, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>алкилтио, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>галогеналкилтио, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>циклоалкилтио, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>алкилсульфинил, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>галогеналкилсульфинил, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>галогеналкилсульфонил,

С<sub>3</sub>-С<sub>8</sub>циклоалкилсульфонил, амино, С<sub>1</sub>-С<sub>8</sub>алкиламино, С<sub>1</sub>-С<sub>6</sub>галогеналкиламино, С<sub>3</sub>-С<sub>8</sub>циклоалкиламино, С<sub>2</sub>-С<sub>8</sub>диалкиламино, С<sub>2</sub>-С<sub>8</sub>галогендиалкиламино, формиламино, С<sub>2</sub>-С<sub>8</sub>алкилкарбониламино, С<sub>2</sub>-С<sub>8</sub>галогеналкилкарбониламино,

5 С<sub>1</sub>-С<sub>6</sub>алкилсульфониламино, С<sub>1</sub>-С<sub>6</sub>галогеналкилсульфониламино, -SF<sub>5</sub>, -SCN, С<sub>3</sub>-С<sub>12</sub>триалкилсилил, С<sub>4</sub>-С<sub>12</sub>триалкилсилилалкил, С<sub>4</sub>-С<sub>12</sub>триалкилсилилалкокси или G<sup>2</sup>; или

10 два смежных R<sup>10</sup> взяты вместе с атомами углерода, с которыми они связаны, с образованием С<sub>3</sub>-С<sub>7</sub>циклоалкильного кольца;

каждый R<sup>7</sup> независимо представляет собой галоген, гидроксил, циано, нитро, С<sub>1</sub>-С<sub>8</sub>алкил, С<sub>2</sub>-С<sub>4</sub>алкоксиалкил, С<sub>3</sub>-С<sub>8</sub>алкоксиалкоксиалкил, С<sub>1</sub>-С<sub>4</sub>цианоалкил, С<sub>1</sub>-С<sub>4</sub>цианоалкокси, С<sub>1</sub>-С<sub>8</sub>галогеналкил, С<sub>1</sub>-С<sub>8</sub>нитроалкил, С<sub>2</sub>-С<sub>8</sub>алкенил, 15 С<sub>2</sub>-С<sub>8</sub>галогеналкенил, С<sub>2</sub>-С<sub>8</sub>нитроалкенил, С<sub>2</sub>-С<sub>8</sub>алкинил, С<sub>2</sub>-С<sub>8</sub>галогеналкинил, С<sub>4</sub>-С<sub>10</sub>циклоалкилалкил, С<sub>4</sub>-С<sub>10</sub>галогенциклоалкилалкил, С<sub>5</sub>-С<sub>12</sub>алкилциклоалкилалкил, С<sub>5</sub>-С<sub>12</sub>циклоалкилалкенил, С<sub>5</sub>-С<sub>12</sub>циклоалкилалкинил, С<sub>3</sub>-С<sub>8</sub>циклоалкил, 20 С<sub>3</sub>-С<sub>8</sub>галогенциклоалкил, С<sub>4</sub>-С<sub>10</sub>алкилциклоалкил, С<sub>6</sub>-С<sub>12</sub>циклоалкилциклоалкил, С<sub>3</sub>-С<sub>8</sub>циклоалкенил, С<sub>3</sub>-С<sub>8</sub>галогенциклоалкенил, С<sub>2</sub>-С<sub>8</sub>алкоксиалкил, С<sub>2</sub>-С<sub>8</sub>галогеналкоксиалкил, С<sub>4</sub>-С<sub>10</sub>циклоалкоксиалкил, С<sub>2</sub>-С<sub>8</sub>алкилтиоалкил, С<sub>2</sub>-С<sub>8</sub>алкилсульфинилалкил, С<sub>2</sub>-С<sub>8</sub>алкилсульфонилалкил, С<sub>2</sub>-С<sub>8</sub>алкиламиноалкил, С<sub>2</sub>-С<sub>8</sub>галогеналкиламиноалкил, С<sub>4</sub>-С<sub>10</sub>циклоалкиламиноалкил, 25 С<sub>3</sub>-С<sub>10</sub>диалкиламиноалкил, -CHO, С<sub>2</sub>-С<sub>8</sub>алкилкарбонил, С<sub>2</sub>-С<sub>8</sub>галогеналкилкарбонил, С<sub>4</sub>-С<sub>10</sub>циклоалкилкарбонил, -C(=O)OH, С<sub>2</sub>-С<sub>8</sub>алкоксикарбонил, С<sub>2</sub>-С<sub>8</sub>галогеналкоксикарбонил, С<sub>4</sub>-С<sub>10</sub>циклоалкоксикарбонил, 30 С<sub>5</sub>-С<sub>12</sub>циклоалкилалкоксикарбонил, -C(=O)NH<sub>2</sub>, С<sub>2</sub>-С<sub>8</sub>алкиламинокарбонил, С<sub>4</sub>-С<sub>10</sub>циклоалкиламинокарбонил, С<sub>3</sub>-С<sub>10</sub>диалкиламинокарбонил, гидрокси, С<sub>1</sub>-С<sub>8</sub>алкокси, С<sub>1</sub>-С<sub>8</sub>галогеналкокси, С<sub>2</sub>-С<sub>8</sub>алкоксиалкокси, С<sub>2</sub>-С<sub>8</sub>алкенилокси, С<sub>2</sub>-С<sub>8</sub>галогеналкенилокси, С<sub>3</sub>-С<sub>8</sub>алкинилокси, С<sub>3</sub>-С<sub>8</sub>галогеналкинилокси, С<sub>3</sub>-С<sub>8</sub>циклоалкокси, С<sub>3</sub>-С<sub>8</sub>галогенциклоалкокси, С<sub>4</sub>-С<sub>10</sub>циклоалкилалкокси, 35 С<sub>3</sub>-С<sub>10</sub>алкилкарбонилалкокси, С<sub>2</sub>-С<sub>8</sub>алкилкарбониллокси, С<sub>2</sub>-С<sub>8</sub>галогеналкилкарбониллокси, С<sub>1</sub>-С<sub>8</sub>алкилсульфониллокси, С<sub>1</sub>-С<sub>8</sub>галогеналкилсульфониллокси, С<sub>1</sub>-С<sub>8</sub>алкилтио, С<sub>1</sub>-С<sub>8</sub>галогеналкилтио, С<sub>3</sub>-С<sub>8</sub>циклоалкилтио, С<sub>1</sub>-С<sub>8</sub>алкилсульфинил, С<sub>1</sub>-С<sub>8</sub>галогеналкилсульфинил, 40 С<sub>3</sub>-С<sub>8</sub>циклоалкилсульфонил, амино, С<sub>1</sub>-С<sub>8</sub>алкиламино, С<sub>1</sub>-С<sub>6</sub>галогеналкиламино, С<sub>3</sub>-С<sub>8</sub>циклоалкиламино, С<sub>2</sub>-С<sub>8</sub>диалкиламино, С<sub>2</sub>-С<sub>8</sub>галогендиалкиламино, формиламино, С<sub>2</sub>-С<sub>8</sub>алкилкарбониламино, С<sub>2</sub>-С<sub>8</sub>галогеналкилкарбониламино, С<sub>1</sub>-С<sub>6</sub>алкилсульфониламино, С<sub>1</sub>-С<sub>6</sub>галогеналкилсульфониламино, -SF<sub>5</sub>, -SCN, 45 С<sub>3</sub>-С<sub>12</sub>триалкилсилил, С<sub>4</sub>-С<sub>12</sub>триалкилсилилалкил, С<sub>4</sub>-С<sub>12</sub>триалкилсилилалкокси; или

два смежных R<sup>7</sup> взяты вместе с атомами углерода, с которыми они связаны, с образованием С<sub>3</sub>-С<sub>7</sub>циклоалкильного кольца;

каждый  $R^8$  независимо представляет собой Н, циано,  $C_2$ - $C_3$ алкилкарбонил или  $C_2$ - $C_3$ галогеналкилкарбонил;

каждый из  $R^9$ ,  $R^{9'}$  и  $R^{11}$  независимо представляет собой циано,  $C_1$ - $C_3$ алкил,

<sup>5</sup>  $C_2$ - $C_3$ алкенил,  $C_2$ - $C_3$ алкинил,  $C_3$ - $C_6$ циклоалкил,  $C_2$ - $C_3$ алкоксиалкил,  $C_1$ - $C_3$ алкокси,  $C_2$ - $C_3$ алкилкарбонил,  $C_2$ - $C_3$ алкоксикарбонил,  $C_2$ - $C_3$ алкиламиноалкил или  $C_3$ - $C_4$ диалкиламиноалкил;

<sup>10</sup> каждый  $R^{12}$  независимо представляет собой Н, циано,  $C_1$ - $C_4$ алкил,  $C_1$ - $C_4$ галогеналкил,  $C_1$ - $C_4$ алкокси,  $C_1$ - $C_4$ галогеналкокси,  $-(C=O)CH_3$  или  $-(C=O)CF_3$ ;

<sup>15</sup> каждый  $G^1$  независимо представляет собой фенил, фенилметил (т. е. бензил), пиридинилметил, фенилкарбонил (т. е. бензоил), фенокси, фенилэтинил, фенилсульфонил, фенилкарбонилалкил или 5- или 6-членное гетероароматическое кольцо, причем каждый из них необязательно замещен по членам кольца не более 5 заместителями, независимо выбранными из  $R^{13}$ ;

<sup>20</sup> каждый  $G^2$  независимо представляет собой фенил, фенилметил (т. е. бензил), пиридинилметил, фенилкарбонил (т. е. бензоил), фенилкарбонилалкил, фенокси, фенилэтинил, фенилсульфонил или 5- или 6-членное гетероароматическое кольцо, причем каждый из них необязательно замещен по членам кольца не более 5 заместителями, независимо выбранными из  $R^{14}$ ;

<sup>25</sup> каждый из  $R^{13}$  и  $R^{14}$  независимо представляет собой галоген, циано, гидрокси, амино, нитро,  $-CHO$ ,  $-C(=O)OH$ ,  $-C(=O)NH_2$ ,  $-SO_2NH_2$ ,  $C_1$ - $C_6$ алкил,  $C_1$ - $C_6$ галогеналкил,  $C_2$ - $C_6$ алкенил,  $C_2$ - $C_6$ алкинил,  $C_2$ - $C_8$ алкилкарбонил,  $C_2$ - $C_8$ галогеналкилкарбонил,  $C_2$ - $C_8$ алкоксикарбонил,  $C_4$ - $C_{10}$ циклоалкоксикарбонил,  $C_5$ - $C_{12}$ циклоалкилалкоксикарбонил,  $C_2$ - $C_8$ алкиламиноалкарбонил,  $C_3$ - $C_{10}$ диалкиламиноалкарбонил,  $C_1$ - $C_6$ алкокси,  $C_1$ - $C_6$ галогеналкокси, <sup>30</sup>  $C_2$ - $C_8$ алкилкарбонилокси,  $C_1$ - $C_6$ алкилтио,  $C_1$ - $C_6$ галогеналкилтио,  $C_1$ - $C_6$ алкилсульфинил,  $C_1$ - $C_6$ галогеналкилсульфинил,  $C_1$ - $C_6$ алкилсульфонил,  $C_1$ - $C_6$ галогеналкилсульфонил,  $C_1$ - $C_6$ алкиламиносульфонил,  $C_2$ - $C_8$ диалкиламиносульфонил,  $C_3$ - $C_{10}$ триалкилсилил,  $C_1$ - $C_6$ алкиламино,  $C_2$ - $C_8$ диалкиламино,  $C_2$ - $C_8$ алкилкарбониламино, <sup>35</sup>  $C_1$ - $C_6$ алкилсульфониламино, фенил, пиридинил или тиенил;

<sup>40</sup> каждый  $R^{15}$  независимо представляет собой галоген, циано, гидрокси,  $C_1$ - $C_4$ алкил,  $C_1$ - $C_4$ галогеналкил,  $C_1$ - $C_4$ алкокси,  $C_1$ - $C_4$ галогеналкокси,  $C_2$ - $C_4$ алкоксиалкил,  $C_2$ - $C_4$ алкилкарбонил,  $C_2$ - $C_4$ алкоксикарбонил или  $C_3$ - $C_6$ циклоалкил;

<sup>45</sup> каждый  $R^{16}$  независимо представляет собой Н, циано,  $C_1$ - $C_4$ алкил,  $C_1$ - $C_4$ галогеналкил,  $C_1$ - $C_4$ алкокси,  $C_2$ - $C_4$ алкилкарбонил,  $C_2$ - $C_4$ алкоксикарбонил или  $C_3$ - $C_6$ циклоалкил;

<sup>50</sup> каждый  $R^{17}$  независимо представляет собой Н,  $C_1$ - $C_6$ алкил,  $C_3$ - $C_8$ циклоалкил,  $C_4$ - $C_8$ циклоалкилалкил,  $C_1$ - $C_6$ галогеналкил,  $C_2$ - $C_6$ алкенил,  $C_3$ - $C_6$ алкинил,  $C_2$ - $C_8$ алкоксиалкил,  $C_2$ - $C_8$ галогеналкоксиалкил,  $C_2$ - $C_8$ алкилтиоалкил,  $C_2$ - $C_8$ алкилсульфинилалкил,  $C_2$ - $C_8$ алкилсульфонилалкил,  $C_2$ - $C_8$ алкилкарбонил,

C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>галогеналкилкарбонил, C<sub>4</sub>-C<sub>10</sub>циклоалкилкарбонил, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>алкоксикарбонил,

C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>галогеналкоксикарбонил, C<sub>4</sub>-C<sub>10</sub>циклоалкоксикарбонил,

C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>алкиламинокарбонил, C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub>диалкиламинокарбонил,

5 C<sub>4</sub>-C<sub>10</sub>циклоалкиламинокарбонил, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>алкилсульфинил, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>галогеналкилсульфинил,

C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>циклоалкилсульфинил, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>алкилсульфонил, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>галогеналкилсульфонил,

C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>циклоалкилсульфонил, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>алкиламиносульфонил, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>диалкиламиносульфонил,

C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub>trialкилсилил или G<sup>1</sup>;

10 каждый R<sup>17a</sup> независимо представляет собой H, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>алкил, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>циклоалкил,

C<sub>4</sub>-C<sub>8</sub>циклоалкилалкил, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>галогеналкил, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>алкенил, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>алкинил,

C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>алкоксиалкил, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>галогеналкоксиалкил, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>алкилтиоалкил,

C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>алкилсульфинилалкил, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>алкилсульфонилалкил, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>алкокси, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>алкилтио,

15 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>галогеналкилтио, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>циклоалкилтио, C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub>trialкилсилил или G<sup>1</sup>;

каждый R<sup>18</sup> независимо представляет собой H, гидрокси, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>алкил,

C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>циклоалкил, C<sub>4</sub>-C<sub>8</sub>циклоалкилалкил, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>галогеналкил, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>алкенил,

20 C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>алкинил, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>алкоксиалкил, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>галогеналкоксиалкил, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>алкилтиоалкил,

C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>алкилсульфинилалкил, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>алкилсульфонилалкил, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>алкилкарбонил,

C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>галогеналкилкарбонил, C<sub>4</sub>-C<sub>10</sub>циклоалкилкарбонил, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>алкоксикарбонил,

C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>галогеналкоксикарбонил, C<sub>4</sub>-C<sub>10</sub>циклоалкоксикарбонил,

C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>алкиламинокарбонил, C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub>диалкиламинокарбонил,

25 C<sub>4</sub>-C<sub>10</sub>циклоалкиламинокарбонил, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>алкокси, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>алкилтио, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>галогеналкилтио,

C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>циклоалкилтио, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>алкилсульфинил, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>галогеналкилсульфинил,

C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>циклоалкилсульфинил, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>алкилсульфонил, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>галогеналкилсульфонил,

30 C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>циклоалкилсульфонил, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>алкиламиносульфонил, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>диалкиламиносульфонил,

C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub>trialкилсилил или G<sup>1</sup>;

каждый R<sup>19</sup> независимо представляет собой H, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>алкил, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>циклоалкил,

C<sub>4</sub>-C<sub>8</sub>циклоалкилалкил, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>галогеналкил, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>алкенил, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>алкинил,

35 C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>алкоксиалкил, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>галогеналкоксиалкил, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>алкилтиоалкил,

C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>алкилсульфинилалкил, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>алкилсульфонилалкил, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>алкилкарбонил,

C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>галогеналкилкарбонил, C<sub>4</sub>-C<sub>10</sub>циклоалкилкарбонил, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>алкоксикарбонил,

C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>галогеналкоксикарбонил, C<sub>4</sub>-C<sub>10</sub>циклоалкоксикарбонил,

40 C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>алкиламинокарбонил, C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub>диалкиламинокарбонил,

C<sub>4</sub>-C<sub>10</sub>циклоалкиламинокарбонил, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>алкокси, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>алкилсульфинил,

C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>галогеналкилсульфинил, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>циклоалкилсульфинил, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>алкилсульфонил,

C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>галогеналкилсульфонил, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>циклоалкилсульфонил, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>алкиламиносульфонил,

45 C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>диалкиламиносульфонил, C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub>trialкилсилил или G<sup>1</sup>;

каждый R<sup>20</sup> независимо представляет собой H, гидрокси, амино, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>алкил,

C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>циклоалкил, C<sub>4</sub>-C<sub>8</sub>циклоалкилалкил, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>галогеналкил, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>алкенил,

С<sub>3</sub>-С<sub>6</sub>алкинил, С<sub>2</sub>-С<sub>8</sub>алкоксиалкил, С<sub>2</sub>-С<sub>8</sub>галогеналкоксиалкил, С<sub>2</sub>-С<sub>8</sub>алкилтиоалкил, С<sub>2</sub>-С<sub>8</sub>алкилсульфинилалкил, С<sub>2</sub>-С<sub>8</sub>алкилсульфонилалкил, С<sub>2</sub>-С<sub>8</sub>алкилкарбонил, С<sub>2</sub>-С<sub>8</sub>галогеналкилкарбонил, С<sub>4</sub>-С<sub>10</sub>циклоалкилкарбонил, С<sub>2</sub>-С<sub>8</sub>алкоксикарбонил, С<sub>2</sub>-С<sub>8</sub>галогеналкоксикарбонил, С<sub>4</sub>-С<sub>10</sub>циклоалкоксикарбонил, С<sub>2</sub>-С<sub>8</sub>алкиламинокарбонил, С<sub>3</sub>-С<sub>10</sub>диалкиламинокарбонил, С<sub>4</sub>-С<sub>10</sub>циклоалкиламинокарбонил, С<sub>1</sub>-С<sub>6</sub>алкокси, С<sub>1</sub>-С<sub>6</sub>алкилсульфинил, С<sub>1</sub>-С<sub>6</sub>галогеналкилсульфинил, С<sub>3</sub>-С<sub>8</sub>циклоалкилсульфинил, С<sub>1</sub>-С<sub>6</sub>алкилсульфонил, С<sub>1</sub>-С<sub>6</sub>галогеналкилсульфонил, С<sub>3</sub>-С<sub>8</sub>циклоалкилсульфонил, С<sub>1</sub>-С<sub>6</sub>алкиламиносульфонил, С<sub>2</sub>-С<sub>8</sub>диалкиламиносульфонил, С<sub>3</sub>-С<sub>10</sub>триалкилсилил или G<sup>1</sup>;

каждый R<sup>20a</sup> независимо представляет собой Н, С<sub>1</sub>-С<sub>6</sub>алкил, С<sub>3</sub>-С<sub>8</sub>циклоалкил,

С<sub>4</sub>-С<sub>8</sub>циклоалкилалкил, С<sub>1</sub>-С<sub>6</sub>галогеналкил, С<sub>2</sub>-С<sub>6</sub>алкенил, С<sub>3</sub>-С<sub>6</sub>алкинил,

С<sub>2</sub>-С<sub>8</sub>алкоксиалкил, С<sub>2</sub>-С<sub>8</sub>галогеналкоксиалкил, С<sub>2</sub>-С<sub>8</sub>алкилтиоалкил,

С<sub>2</sub>-С<sub>8</sub>алкилсульфинилалкил, С<sub>2</sub>-С<sub>8</sub>алкилсульфонилалкил,

С<sub>1</sub>-С<sub>6</sub>алкоксиС<sub>3</sub>-С<sub>10</sub>триалкилсилил или G<sup>1</sup>;

каждый R<sup>23b</sup> независимо представляет собой Н, галоген, циано, гидрокси, С<sub>1</sub>-С<sub>4</sub>алкил,

С<sub>3</sub>-С<sub>8</sub>циклоалкил, С<sub>4</sub>-С<sub>8</sub>циклоалкилалкил, С<sub>1</sub>-С<sub>4</sub>галогеналкил, С<sub>1</sub>-С<sub>4</sub>алкокси,

С<sub>1</sub>-С<sub>4</sub>галогеналкокси, С<sub>2</sub>-С<sub>4</sub>алкоксиалкил, С<sub>2</sub>-С<sub>4</sub>алкилкарбонил, С<sub>2</sub>-С<sub>4</sub>алкоксикарбонил или С<sub>3</sub>-С<sub>6</sub>циклоалкил;

каждый R<sup>24a</sup> независимо представляет собой Н, С<sub>1</sub>-С<sub>4</sub>алкил, С<sub>3</sub>-С<sub>8</sub>циклоалкил,

С<sub>4</sub>-С<sub>8</sub>циклоалкилалкил, С<sub>1</sub>-С<sub>4</sub>галогеналкил, С<sub>1</sub>-С<sub>4</sub>алкокси, С<sub>1</sub>-С<sub>4</sub>галогеналкокси,

С<sub>2</sub>-С<sub>4</sub>алкоксиалкил, С<sub>2</sub>-С<sub>4</sub>алкилкарбонил, С<sub>2</sub>-С<sub>4</sub>алкоксикарбонил или С<sub>3</sub>-С<sub>6</sub>циклоалкил;

каждый из u и v независимо равняется 0, 1 или 2 в каждом случае S(=O)<sub>u</sub>(=NR<sup>8</sup>)<sub>v</sub>, при

условии, что сумма u и v равняется 0, 1 или 2;

при условии, что если

а) J<sup>1</sup> представляет собой незамещенное фенильное кольцо, А является отличным от -CH<sub>2</sub>-, -O-, -C≡C-, -C(=O)- или -SO<sub>2</sub>-; или

б) J<sup>1</sup> представляет собой незамещенное пиридинильное кольцо, А является отличным от -CH<sub>2</sub>-;

в) J<sup>1</sup> представляет собой С<sub>4</sub>-С<sub>10</sub>циклоалкилалкил, А является отличным от алкила; или

г) J<sup>1</sup>-А- находится в пара-положении Q<sup>1</sup>, А является отличным от О, а J<sup>1</sup> является отличным от 2-фуранилметила.

Более конкретно, настоящее изобретение относится к соединению формулы 1 (в том числе всем стереоизомерам), его N-оксиду или соли. Настоящее изобретение также относится к гербицидной композиции, содержащей соединение по настоящему

изобретению (т. е. в гербицидно эффективном количестве) и по меньшей мере один компонент, выбранный из группы, состоящей из поверхностно-активных веществ, твердых разбавителей и жидких разбавителей. Настоящее изобретение также относится к способу контроля роста нежелательной растительности, предусматривающему

приведение в контакт растительности или окружающей ее среды с гербицидно эффективным количеством соединения по настоящему изобретению (например, в виде описанной в данном документе композиции).

Настоящее изобретение также включает гербицидную смесь, содержащую (а)

5 соединение, выбранное из соединения формулы 1, его *N*-оксидов и солей, и (б) по меньшей мере один дополнительный активный ингредиент, выбранный из (б1) - (б16) и солей соединений (б1) - (б16), как описано ниже.

### ПОДРОБНОЕ ОПИСАНИЕ ИЗОБРЕТЕНИЯ

Подразумевается, что используемые в настоящем документе выражения "содержит",

10 "содержащий", "включает", "включающий", "имеет", "имеющий", "включает в себя", "включающий в себя", "характеризующийся тем, что" или любые другие их варианты распространяются на неисключительное включение, если явно не указано какое-либо ограничение. Например, композиция, смесь, процесс, способ, изделие или прибор, которые содержат перечень элементов, не обязательно ограничиваются только этими

15 элементами, но могут включать другие элементы, которые не перечислены явно или присущи такой композиции, смеси, процессу, способу, изделию или прибору.

Переходная фраза "состоящий из" исключает любой неуказанный элемент, стадию или ингредиент. При наличии в пункте формулы изобретения такая фраза не будет допускать включение в пункт формулы изобретения материалов, отличных от тех,

20 которые перечислены, за исключением примесей, обычно связанных с ними. Если фраза "состоящий из" появляется в отличительной части пункта формулы изобретения, а не сразу после ограничительной части, она ограничивает только элемент, изложенный в этой отличительной части; при этом другие элементы не исключаются из пункта формулы изобретения в целом.

25 Переходная фраза "по сути состоящий из" применяется для обозначения композиции, способа или прибора, что включает материалы, стадии, признаки, компоненты или элементы, в дополнение к буквально раскрываемым, при условии, что эти дополнительные материалы, стадии, признаки, компоненты или элементы существенно не влияют на основную и новую характеристику(характеристики) заявленного

30 изобретения. Выражение "по сути состоящий из" занимает промежуточное положение между "содержащий" и "состоящий из".

Если заявители определили настоящее изобретение или его часть неограничивающим выражением, таким как "содержащий", явно следует понимать, что (если не указано иное) описание следует толковать как также описывающее такое изобретение с

35 применением выражений "по сути состоящий из" или "состоящий из".

Кроме того, если прямо не указано обратное, "или" относится к включающему "или", а не к исключающему "или". Например, условие А или В удовлетворяет любым из следующих условий: А истинно (или присутствует) и В ошибочно (или не присутствует), А ошибочно (или не присутствует) и В истинно (или присутствует), и как А, так и В

40 истинны (или присутствуют).

Также подразумевается, что упоминание элемента или компонента настоящего изобретения в единственном числе не предполагает ограничения в отношении числа примеров (т. е. случаев присутствия) элемента или компонента. Поэтому единственное число следует понимать как включающее одно или по меньшей мере одно, а форма единственного числа для обозначения элемента или компонента также включает множественное число, за исключением случаев, когда явно подразумевается единственное число.

Как изложено в данном документе, выражение "проросток", применяемое либо

отдельно, либо в комбинации слов, означает молодое растение, развивающееся из зародыша семени.

Как изложено в данном документе, выражение "широколиственный", применяемое либо отдельно, либо в таких словах, как "широколиственный сорняк", означает

5 двудольное или двудольное растение, выражение, применяемое для описания группы покрытосеменных растений, характеризующихся наличием двух семядоль у зародышей.

10 В вышеуказанных перечислениях выражение "алкил", используемое либо отдельно, либо в сложных словах, таких как "алкилтио" или "галогеналкил", включает линейный или разветвленный алкил, такой как метил, этил, *n*-пропил, *изопропил* или различные изомеры бутила, пентила или гексила. "Алкенил" включает линейные или разветвленные алкены, такие как этенил, 1-пропенил, 2-пропенил, и различные изомеры бутенила, пентенила и гексенила. "Алкенил" также включает полиены, такие как 1,2-пропадиенил и 2,4-гексадиенил.

15 "Алcoxси" включает, например, метокси, этокси, *n*-пропилокси, изопропилокси и различные изомеры бутокси, пентокси и гексилокси. "Алcoxсиалкил" обозначает замещение алcoxси по алкилу. Примеры "алcoxсиалкила" включают  $\text{CH}_3\text{OCH}_2-$ ,  $\text{CH}_3\text{OCH}_2\text{CH}_2-$ ,  $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{OCH}_2-$ ,  $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_2-$  и  $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{CH}_2-$ .

20 "Алcoxсиалкоxсиалкил" обозначает замещение алcoxси по фрагменту алcoxси фрагмента алcoxсиалкила. Примеры "алcoxсиалкоxсиалкила" включают  $\text{CH}_3\text{OCH}_2\text{OCH}_2-$ ,  $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{O}(\text{CH}_3)\text{CHOCH}_2-$  и  $(\text{CH}_3\text{O})_2\text{CHOCH}_2-$ . "Алcoxсиалкоxси" обозначает замещение алcoxси по алcoxси. "Алкенилокси" включает линейные или разветвленные алкенилокси-фрагменты. Примеры "алкенилокси" включают  $\text{H}_2\text{C}=\text{CH}-\text{CH}_2\text{O}-$ ,  $(\text{CH}_3)_2\text{C}=\text{CH}=\text{CH}_2\text{O}-$ ,  $(\text{CH}_3)\text{CH}=\text{CH}=\text{CH}_2\text{O}-$ ,  $(\text{CH}_3)\text{CH}=\text{C}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{O}-$  и  $\text{CH}_2=\text{CH}-\text{CH}_2\text{O}-$ . "Алкинилокси" включает линейные или разветвленные алкинилокси-фрагменты. Примеры "алкинилокси" включают  $\text{HC}\equiv\text{CCH}_2\text{O}-$ ,  $\text{CH}_3\text{C}\equiv\text{CCH}_2\text{O}-$  и  $\text{CH}_3\text{C}\equiv\text{CCH}_2\text{CH}_2\text{O}-$ . "Алкилтио" включает разветвленные или линейные фрагменты алкилтио, такие как метилтио, этилтио и различные изомеры пропилтио, бутилтио, пентилтио и гексилтио. "Алкилсульфинил" включает оба энантиомера

30 алкилсульфинильной группы. Примеры "алкилсульфинила" включают  $\text{CH}_3\text{S}(\text{O})-$ ,  $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{S}(\text{O})-$ ,  $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{S}(\text{O})-$ ,  $(\text{CH}_3)_2\text{CHS}(\text{O})-$  и различные изомеры бутилсульфинила, пентилсульфинила и гексилсульфинила. Примеры "алкилсульфонила" включают  $\text{CH}_3\text{S}(\text{O})_2-$ ,  $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{S}(\text{O})_2-$ ,  $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{S}(\text{O})_2-$ ,  $(\text{CH}_3)_2\text{CHS}(\text{O})_2-$  и различные изомеры

35 бутилсульфонила, пентилсульфонила и гексилсульфонила. Примеры "алкилсульфониламино" включают  $\text{CH}_3\text{S}(\text{O})_2\text{NH}-$ ,  $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{S}(\text{O})_2\text{NH}-$ ,  $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{S}(\text{O})_2\text{NH}-$ ,  $(\text{CH}_3)_2\text{CHS}(\text{O})_2\text{NH}-$  и различные изомеры бутилсульфониламино, пентилсульфониламино и гексилсульфониламино. Примеры "алкилсульфонилокси"

40 включают  $\text{CH}_3\text{S}(\text{O})_2\text{O}-$ ,  $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{S}(\text{O})_2\text{O}-$ ,  $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{S}(\text{O})_2\text{O}-$ ,  $(\text{CH}_3)_2\text{CHS}(\text{O})_2\text{O}-$  и различные изомеры бутилсульфонилокси, пентилсульфонилокси и гексилсульфонилокси.

"Алкилтиоалкил" обозначает замещение алкилтио по алкилу. Примеры "алкилтиоалкила" включают  $\text{CH}_3\text{SCH}_2-$ ,  $\text{CH}_3\text{SCH}_2\text{CH}_2-$ ,  $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{SCH}_2-$ ,

45  $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{SCH}_2-$  и  $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{SCH}_2\text{CH}_2-$ . "Цианоалкил" обозначает алкильную группу, замещенную одной цианогруппой. Примеры "цианоалкила" включают  $\text{NCCH}_2$ ,  $\text{NCCH}_2\text{CH}_2-$  и  $\text{CH}_3\text{CH}(\text{CN})\text{CH}_2-$ . «Цианоалcoxси» обозначает алcoxсигруппу, замещенную одной цианогруппой. Примеры "цианоалcoxси" включают  $\text{NCCH}_2\text{O}-$ ,  $\text{NCCH}_2\text{CH}_2\text{O}-$  и

CH<sub>3</sub>CH(CN)CH<sub>2</sub>O-. "Алкилсульфинилалкил" обозначает замещение алкилсульфила по алкилу. Примеры "алкилсульфинилалкила" включают CH<sub>3</sub>S(=O)CH<sub>2</sub>-, CH<sub>3</sub>S(=O)CH<sub>2</sub>-, CH<sub>3</sub>CH<sub>2</sub>-, CH<sub>3</sub>CH<sub>2</sub>S(=O)CH<sub>2</sub>- и CH<sub>3</sub>CH<sub>2</sub>S(=O)CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>-.

5 "Алкилсульфонилалкил" обозначает замещение алкилсульфонила по алкилу. Примеры "алкилсульфонилалкила" включают CH<sub>3</sub>S(=O)<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>-, CH<sub>3</sub>S(=O)<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>-, CH<sub>3</sub>CH<sub>2</sub>S(=O)<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>- и CH<sub>3</sub>CH<sub>2</sub>S(=O)<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>-.

10 "Алкиламино", "диалкиламино" и т. п. определены аналогично вышеприведенным примерам. Примеры "алкиламиноалкила" включают CH<sub>3</sub>NHCH<sub>2</sub>-, (CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>CHNHCH<sub>2</sub>- и CH<sub>3</sub>NHCH(CH<sub>3</sub>)-. Примеры "алкиламинокарбонила" включают

15 CH<sub>3</sub>NHC(O)-, (CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>CHNHC(O)- и CH<sub>3</sub>CH<sub>2</sub>NHC(O)-. Примеры "диалкиламиноалкила" включают (CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>NCH<sub>2</sub>-, (CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>NC(CH<sub>3</sub>)H- и (CH<sub>3</sub>)(CH<sub>3</sub>)NCH<sub>2</sub>-.

20 Примеры "алкиламинокарбонила" включают CH<sub>3</sub>NC(O)- и CH<sub>3</sub>CH<sub>2</sub>NC(O)-. Примеры "диалкиламинокарбонила" включают (CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>NC(O)-. Примеры "диалкиламиносульфонила" включают (CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>NS(O)<sub>2</sub>-.

25 "Циклоалкил" включает, например, циклопропил, циклобутил, циклопентил и циклогексил. Выражение "алкилциклоалкил" обозначает замещение алкила по фрагменту циклоалкила и включает, например, этилциклопропил, изопропилциклобутил, 3-метилцикlopентил и 4-метилциклогексил. Выражение "циклоалкилалкил" обозначает замещение циклоалкила по фрагменту алкила. Примеры "циклоалкилалкила" включают циклопропилметил, циклопентилэтил и другие фрагменты циклоалкила, связанные с линейными или разветвленными алкильными группами. Выражение "циклоалкокси" обозначает циклоалкил, соединенный посредством атома кислорода, например, циклопентилокси и циклогексилокси. "Циклоалкоксиалкил" обозначает замещение циклоалкила по фрагменту алкила. Примеры "циклоалкоксиалкила" включают циклопропоксиметил, циклопентоксиэтил и другие фрагменты циклоалкокси, связанные с линейными или разветвленными алкильными группами. "Циклоалкилалкокси" обозначает циклоалкилалкил, связанный посредством атома кислорода, присоединенного к алкильной цепи. Примеры "циклоалкилалкокси" включают циклопропилметокси, циклопентилэтокси и другие фрагменты циклоалкила, связанные с линейными или разветвленными алкокси-группами. "Циклоалкенил" включает группы, такие как циклопентенил и циклогексенил, а также группы с более чем одной двойной связью, такие как 1,3- и 1,4-циклогексадиенил.

30 35 Выражение "галоген" либо отдельно, либо в сложных словах, таких как "галогеналкил", или при использовании в описаниях, таких как "алкил, замещенный галогеном", включает фтор, хлор, бром или йод. Кроме того, при использовании в сложных словах, таких как "галогеналкил", или при использовании в описаниях, таких как "алкил, замещенный галогеном", указанный алкил может быть частично или полностью замещен атомами галогена, которые могут быть одинаковыми или разными. Примеры "галогеналкила" или "алкила, замещенного галогеном" включают F<sub>3</sub>C-, ClCH<sub>2</sub>-, CF<sub>3</sub>CH<sub>2</sub>- и CF<sub>3</sub>CCl<sub>2</sub>-.

40 Выражения "галогенциклоалкил", "галогеналкокси", "галогеналкилтио", "галогеналкенил", "галогеналкинил" и подобные им определяются аналогично выражению "галогеналкил". Примеры "галогеналкокси" включают CF<sub>3</sub>O-, CCl<sub>3</sub>CH<sub>2</sub>O-, HCF<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>O- и CF<sub>3</sub>CH<sub>2</sub>O-. Примеры "галогеналкилтио" включают CCl<sub>3</sub>S-, CF<sub>3</sub>S-, CCl<sub>3</sub>CH<sub>2</sub>S- и ClCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>S-.

45 Примеры "галогеналкилсульфила" включают CF<sub>3</sub>S(O)-, CCl<sub>3</sub>S(O)-, CF<sub>3</sub>CH<sub>2</sub>S(O)- и CF<sub>3</sub>CF<sub>2</sub>S(O)-. Примеры "галогеналкисульфонила"

включают  $\text{CF}_3\text{S(O)}_2^-$ ,  $\text{CCl}_3\text{S(O)}_2^-$ ,  $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{S(O)}_2^-$  и  $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{S(O)}_2^-$ . Примеры "галогеналкенила" включают  $(\text{Cl})_2\text{C}=\text{CH}=\text{CH}_2^-$  и  $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{CH}=\text{CH}=\text{CH}_2^-$ . Примеры "галогеналкинила" включают  $\text{HC}\equiv\text{CCHCl}-$ ,  $\text{CF}_3\text{C}\equiv\text{C}-$ ,  $\text{CCl}_3\text{C}\equiv\text{C}-$  и  $\text{FCH}_2\text{C}\equiv\text{CCH}_2^-$ .  
<sub>5</sub> Примеры "галогеналкоксиалкокси" включают  $\text{CF}_3\text{OCH}_2\text{O}-$ ,  $\text{ClCH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{O}-$ ,  $\text{Cl}_3\text{CCH}_2\text{OCH}_2\text{O}-$  и разветвленные производные алкила.

"Алкилкарбонил" обозначает линейные или разветвленные фрагменты алкила, связанные с фрагментом  $\text{C}(\text{=O})$ . Примеры "алкилкарбонила" включают  $\text{CH}_3\text{C}(\text{=O})-$ ,  $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{C}(\text{=O})-$  и  $(\text{CH}_3)_2\text{CHC}(\text{=O})-$ . Примеры "алкилкарбонилалкокси" включают  $\text{CH}_3\text{C}(\text{=O})\text{CH}_2\text{O}-$ ,  $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{C}(\text{=O})\text{CH}_2\text{O}-$  и  $(\text{CH}_3)_2\text{CHC}(\text{=O})\text{CH}_2\text{O}-$ . Примеры "алкоксикарбонила" включают  $\text{CH}_3\text{OC}(\text{=O})-$ ,  $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{OC}(\text{=O})-$ ,  $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OC}(\text{=O})-$ ,  $(\text{CH}_3)_2\text{CHOC}(\text{=O})-$  и различные изомеры бутокси- или пентоксикарбонила.

"Алкилкарбонилокси" обозначает алкилкарбонильный фрагмент, связанный посредством атома кислорода, присоединенного к карбонилу. Примеры "алкилкарбонилокси" включают  $\text{CH}_3\text{C}(\text{=O})\text{O}-$ ,  $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{C}(\text{=O})\text{O}-$  и  $(\text{CH}_3)_2\text{CHC}(\text{=O})\text{O}-$ .

Общее число атомов углерода в группе заместителя обозначают приставкой " $\text{C}_i\text{-C}_j$ ", в которой  $i$  и  $j$  являются числами от 1 до 12. Например,  $\text{C}_1\text{-C}_4$ алкилсульфонил определяет группы от метилсульфонила до бутилсульфонила;  $\text{C}_2$ алкоксиалкил определяет  $\text{CH}_3\text{OCH}_2^-$ ;  $\text{C}_3$ алкоксиалкил определяет, например,  $\text{CH}_3\text{CH}(\text{OCH}_3)-$ ,  $\text{CH}_3\text{OCH}_2\text{CH}_2^-$  или  $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{OCH}_2^-$ ; и  $\text{C}_4$ алкоксиалкил определяет различные изомеры алкильной группы, замещенной алкокси-группой, содержащей всего четыре атома углерода, при этом примеры включают  $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_2^-$  и  $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{CH}_2^-$ .

Если соединение замещено заместителем, содержащим индекс, который указывает на то, что число указанных заместителей может превышать 1, то указанные заместители (если их число превышает 1) независимо выбраны из группы определенных заместителей (например,  $[(\text{R}^{10})_n]$ , причем  $n$  равняется 1, 2, 3, 4 или 5). Кроме того, если индекс указывает диапазон, например,  $(\text{R})_{i-j}$ , то число заместителей может быть выбрано из целых чисел от  $i$  до  $j$  включительно. Если группа содержит заместитель, которым может быть водород, например,  $(\text{R}^1$  или  $\text{R}^6$ ), то в случае, когда этот заместитель представляет собой водород, это понимают как равнозначное тому, что указанная группа является незамещенной. Если показано, что переменная группа необязательно присоединена к положению, например,  $[(\text{R}^{10})_n]$ , где  $n$  может равняться 0, то водород может находиться в данном положении, даже если это не указано в определении переменной группы. Если одно или несколько положений в группе указаны как "без заместителей" или "незамещенные", то атомы водорода присоединены с заполнением любой свободной валентности.

Выражение "полностью насыщенный" в отношении кольца атомов означает, что все связи между атомами кольца являются одинарными. Выражение "полностью ненасыщенный" в отношении кольца означает, что связи между атомами в кольце являются одинарными или двойными связями в соответствии с теорией валентных связей, и, кроме того, связи между атомами в кольце включают наибольшее возможное число двойных связей, при этом двойные связи не должны быть кумулированными (т. е. без  $\text{C}=\text{C}=\text{C}$ ,  $\text{N}=\text{C}=\text{C}$  и т. д.). Выражение "частично ненасыщенный" в отношении кольца обозначает кольцо, содержащее по меньшей мере один член кольца, связанный со

смежным членом кольца посредством двойной связи, и которое теоретически может содержать число некумулированных двойных связей между смежными членами кольца (т. е. в своей полностью ненасыщенной соответствующей форме), большее, чем число присутствующих двойных связей (т. е. в своей частично ненасыщенной форме). Если 5 полностью ненасыщенное кольцо удовлетворяет правилу Хюккеля, то оно также может быть описано как ароматическое.

Если не указано иное, "кольцо" или "кольцевая система" как компонент формулы 1 (например, заместитель  $Q^1$ ) являются карбоциклическими или гетероциклическими. Выражение "кольцевая система" обозначает два или более конденсированных кольца. 10 Выражения "бициклическая кольцевая система" и "конденсированная бициклическая кольцевая система" обозначают кольцевую систему, состоящую из двух конденсированных колец, в которой каждое кольцо может быть насыщенным, частично ненасыщенным или полностью ненасыщенным, если не указано иное. Выражение "конденсированная гетеробициклическая кольцевая система" обозначает 15 конденсированную бициклическую кольцевую систему, в которой по меньшей мере один атом кольца не представляет собой углерод. "Мостиковая бициклическая кольцевая система" образуется путем связывания сегмента из одного или нескольких атомов с несмежными членами кольца в кольце. Выражение "член кольца" означает атом или 20 другой фрагмент (например,  $C(=O)$ ,  $C(=S)$ ,  $S(O)$  или  $S(O)_2$ ), образующий каркас кольца или кольцевой системы.

Выражения "карбоциклическое кольцо" или "карбоциклическая кольцевая система" обозначают кольцо или кольцевую систему, где атомы, образующие остов кольца, 25 выбраны только из углерода. Если не указано иное, карбоциклическое кольцо может быть насыщенным, частично ненасыщенным или полностью ненасыщенным кольцом. Если полностью ненасыщенное карбоциклическое кольцо удовлетворяет правилу Хюккеля, то указанное кольцо также называют "ароматическим кольцом". "Насыщенный карбоциклический" относится к кольцу, имеющему остов, состоящий из атомов углерода, соединенных друг с другом одинарными связями; если не указано 30 иное, оставшиеся валентности углерода заполнены атомами водорода.

Выражения "гетероциклическое кольцо", "гетероцикл" или "гетероциклическая кольцевая система" обозначают кольцо или кольцевую систему, в которой по меньшей мере один атом, образующий остов кольца, не является углеродом, например, азот, 35 кислород или сера. Как правило, гетероциклическое кольцо содержит не более 4 атомов азота, не более 2 атомов кислорода и не более 2 атомов серы. Если не указано иное, гетероциклическое кольцо может быть насыщенным, частично ненасыщенным или полностью ненасыщенным кольцом. Если полностью ненасыщенное гетероциклическое кольцо удовлетворяет правилу Хюккеля, то указанное кольцо также называют 40 "гетероароматическим кольцом". Выражение "гетероароматическая бициклическая кольцевая система" обозначает гетероциклическую кольцевую систему, в которой по меньшей мере одно кольцо кольцевой системы является ароматическим. Если не указано иное, гетероциклические кольца и кольцевые системы могут быть присоединены посредством любого доступного углерода или азота путем замещения водорода по указанному углероду или азоту.

45 "Ароматический" указывает, что каждый из атомов кольца находится по сути в той же плоскости и имеет  $p$ -орбиталь, перпендикулярную плоскости кольца, и что  $(4n+2)\pi$  электронов, где  $n$  является положительным целым числом, связаны с кольцом в соответствии с правилом Хюккеля. Выражение "ароматическая кольцевая система" обозначает карбоциклическую или гетероциклическую кольцевую систему, в которой

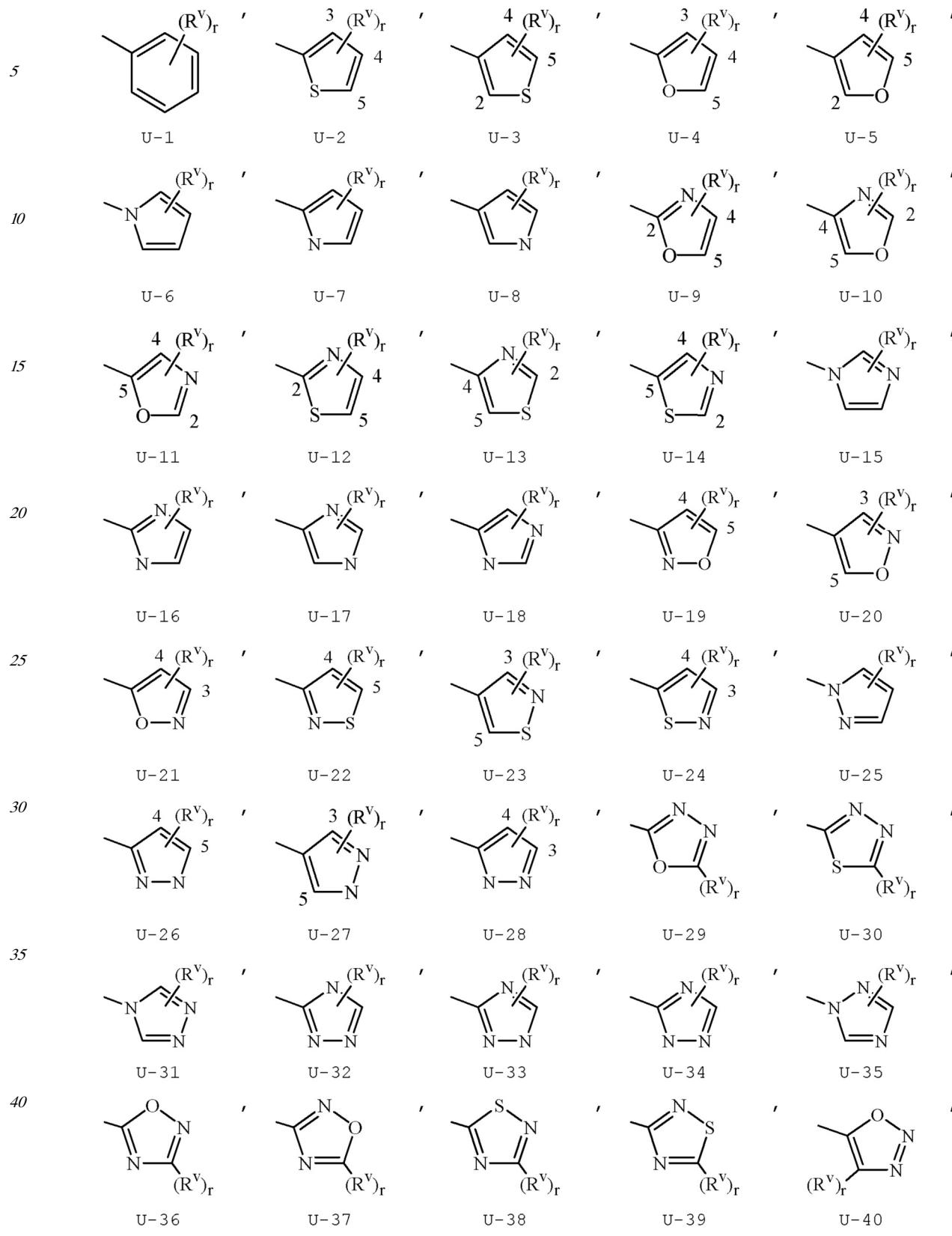
по меньшей мере одно кольцо кольцевой системы является ароматическим.

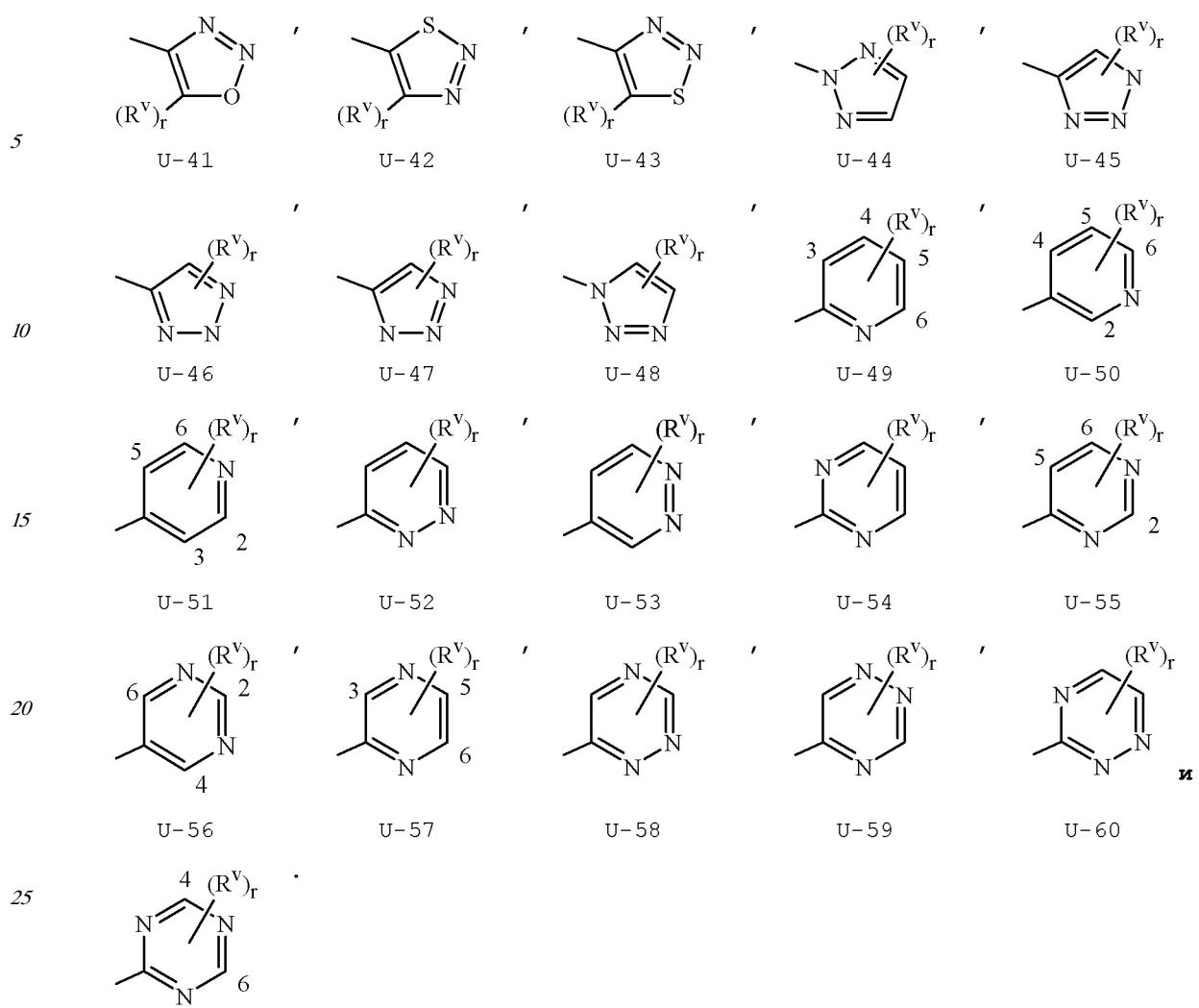
Выражение "необязательно замещенный" по отношению к гетероциклическим кольцам относится к группам, которые являются незамещенными или имеют по меньшей мере один заместитель, не являющийся водородом, который не подавляет биологическую активность, которой обладает незамещенный аналог. Следующие определения, используемые в данном документе, применяются если не указано иное. Выражение "необязательно замещенный" применяют взаимозаменяя с фразой "замещенный или незамещенный" или с выражением "(не)замещенный". Если не указано иное, необязательно замещенная группа может иметь заместитель в каждом замещаемом положении группы и каждое замещение не зависит от другого.

Как отмечено выше,  $Q^1$ ,  $J^1$  и  $Q^2$  могут представлять собой (среди прочего) фенил, необязательно замещенный одним или несколькими заместителями, выбранными из группы заместителей, которые определены в кратком описании настоящего изобретения. Примером фенила, необязательно замещенного одним-пятью заместителями, является 15 кольцо, показанное как U-1 в приложении 1, где, например,  $R^V$  представляет собой  $R^7$  или  $R^{7'}$ , определенные в кратком описании настоящего изобретения для  $Q^1$  или  $J^1$ , а  $r$  представляет собой целое число (от 0 до 4); или  $R^V$  представляет собой  $R^{10}$ , определенный в кратком описании настоящего изобретения для  $Q^2$ , и  $r$  представляет собой целое число 20 (от 0 до 5).

Как отмечено выше,  $Q^1$ ,  $J^1$  и  $Q^2$  могут представлять собой (среди прочего) 5- или 6-членное полностью ненасыщенное гетероциклическое кольцо, необязательно замещенное одним или несколькими заместителями, выбранными из группы заместителей, которые определены в кратком описании настоящего изобретения. Примеры 5- или 6-членного полностью ненасыщенного гетероциклического кольца, необязательно замещенного одним или несколькими заместителями, включают кольца 25 U-2 - U-61, показанные в приложении 1, где  $R^V$  представляет собой любой заместитель, определенный в кратком описании изобретения для  $Q^1$ ,  $J^1$  и  $Q^2$ , а  $r$  представляет собой 30 целое число от 0 до 4, ограниченное числом доступных положений в каждой группе U. Поскольку U-29, U-30, U-36, U-37, U-38, U-39, U-40, U-41, U-42 и U-43 имеют только одно доступное положение, для этих групп U  $r$  ограничено целыми числами 0 или 1, и при этом  $r$ , равный 0, означает, что группа U является незамещенной, а водород 35 присутствует в положении, указанном  $(R^V)_r$ .

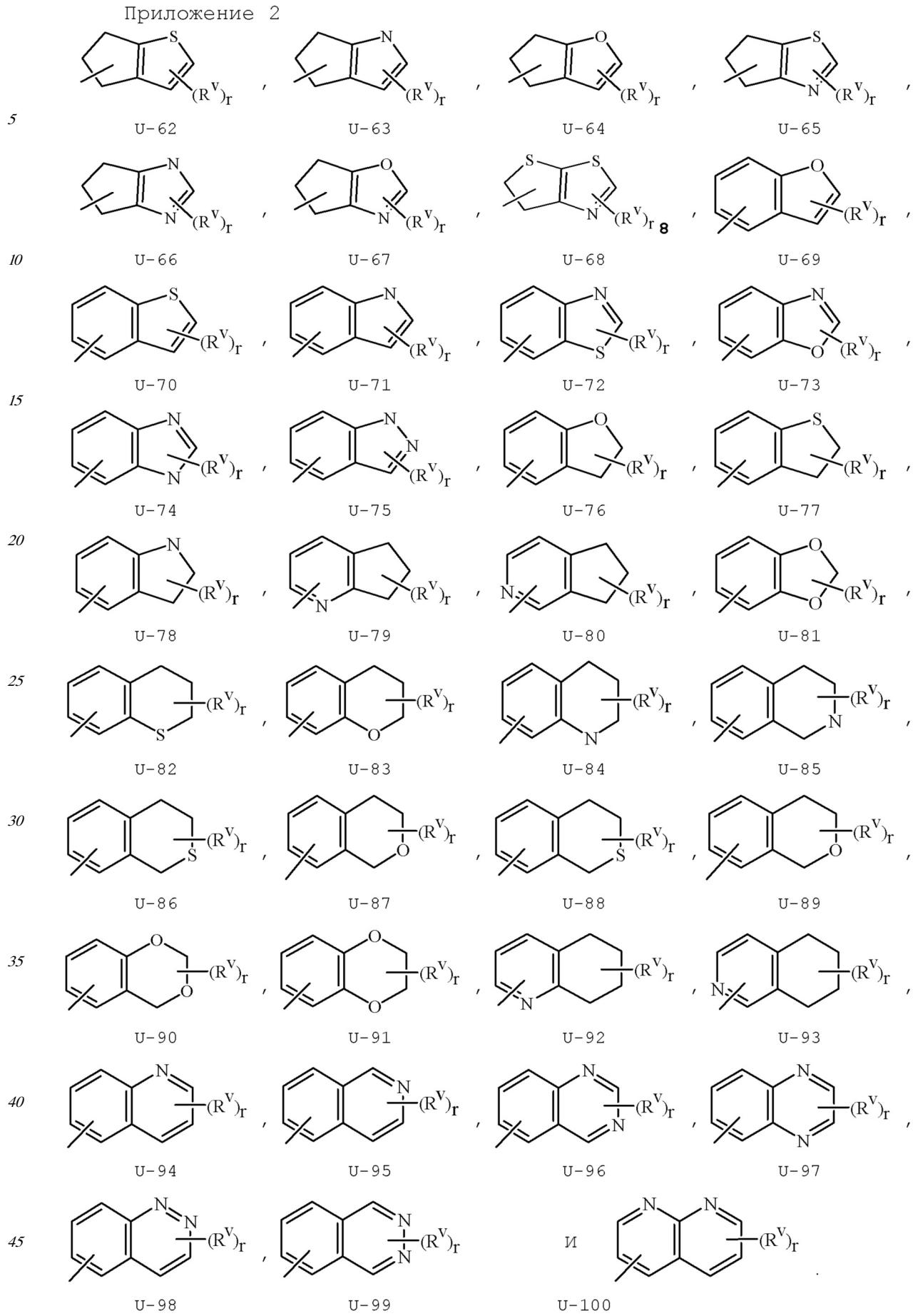
## Приложение 1





Как отмечено выше,  $Q^1$ ,  $J^1$  и  $Q^2$  могут представлять собой (среди прочего) 8-10-членную гетероароматическую бициклическую кольцевую систему, необязательно замещенную одним или несколькими заместителями, выбранными из группы заместителей, которые определены в кратком описании настоящего изобретения (т. е.  $R^7$ ,  $R^{7'}$  и  $R^{10}$ ). Примеры 8-10-членной гетероароматической бициклической кольцевой системы, необязательно замещенной одним или несколькими заместителями, включают кольца U-62 - U-100, показанные в приложении 2, где  $R^V$  представляет собой любой заместитель, который определен в кратком описании настоящего изобретения для  $Q^1$ ,  $J^1$  или  $Q^2$ , а  $r$ , как правило, представляет собой целое число от 0 до 4 или 5.

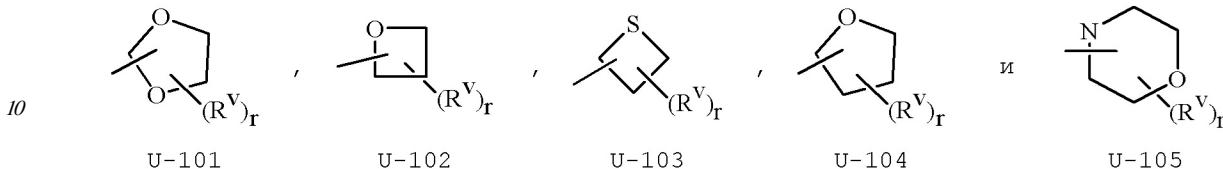
## Приложение 2



Некоторые примеры 4-6-членного насыщенного гетероциклического кольца,

необязательно замещенного одним или несколькими заместителями, включают без ограничения кольца U-101 - U-104, показанные в приложении 3, где  $R^V$  представляет собой любой заместитель, который определен в кратком описании настоящего изобретения для  $Q^1$  или  $Q^2$ , а  $r$ , как правило, представляет собой целое число от 0 до 4 или 5.

## Приложение 3



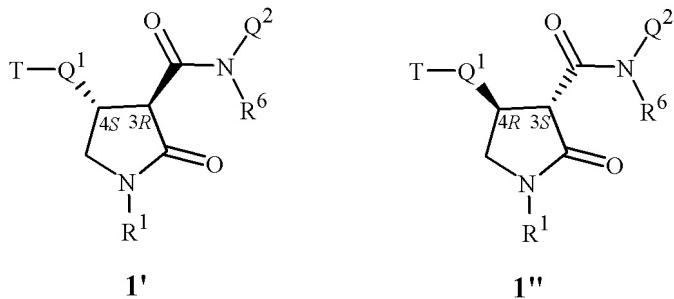
Хотя группы  $R^V$  показаны в структурах U-1 - U-104, следует отметить, что нет необходимости в их присутствии, поскольку они являются необязательными заместителями. Следует отметить, что если  $R^V$  представляет собой H при присоединении к атому, то это то же самое, как если бы указанный атом являлся незамещенным. Атомы азота, которые должны быть замещены для заполнения их валентности, являются замещенными H или  $R^V$ . Следует отметить, что если точка присоединения между  $(R^V)_r$  и группой U показана как плавающая, то  $(R^V)_r$  могут быть присоединены к любому доступному атому углерода или атому азота группы U. Следует отметить, что если точка присоединения в группе U показана как плавающая, то группа U может быть присоединена к остальной части соединения формулы 1 посредством любого доступного углерода или азота группы U путем замещения атома водорода. Предпочтительно, для наибольшей гербицидной активности группа U присоединена к остальной части соединения формулы 1 посредством доступного углерода или азота на полностью ненасыщенном кольце группы U. Следует отметить, что некоторые группы U могут быть замещены только менее 4 группами  $R^V$  (например, U-2 - U-5, U-7 - U-48 и U-52 - U-61).

30 Из уровня техники известен широкий ряд способов синтеза с возможностью получения ароматических и неароматических гетероциклических колец и кольцевых систем; для подробных обзоров см. издание в восьми томах *Comprehensive Heterocyclic Chemistry*, A. R. Katritzky and C. W. Rees editors-in-chief, Pergamon Press, Oxford, 1984 и издание в двенадцати томах *Comprehensive Heterocyclic Chemistry II*, A. R. Katritzky, C. W. Rees and E. F. V. Scriven editors-in-chief, Pergamon Press, Oxford, 1996.

Соединения по настоящему изобретению могут существовать в виде одного или нескольких стереоизомеров. Различные стереоизомеры включают энантиомеры, диастереомеры, атропоизомеры и геометрические изомеры. Стереоизомеры представляют собой изомеры идентичной структуры, но отличающиеся по расположению их атомов в пространстве, и включают энантиомеры, диастереомеры, цис-транс изомеры (также известные как геометрические изомеры) и атропоизомеры. Атропоизомеры являются результатом ограниченного вращения вокруг одинарных связей, где барьер вращения достаточно высок для обеспечения возможности разделения видов изомеров. Специалисту в данной области техники будет понятно, что один стереоизомер может быть более активным и/или может проявлять положительные эффекты при обогащении по сравнению с другим(другими) стереоизомером (стереоизомерами) или при отделении от другого(других) стереоизомера (стереоизомеров). Кроме того, специалисту в данной области техники известно, как

отделять, обогащать и/или избирательно получать указанные стереоизомеры. Соединения по настоящему изобретению могут присутствовать в виде смеси стереоизомеров, отдельных стереоизомеров или в виде оптически активной формы. В частности, если каждый из  $R^4$  и  $R^5$  представляет собой H, то заместители  $C(O)N(Q^2)(R^6)$  и  $Q^1$ , как правило, в большинстве случаев представлены в термодинамически 5 предпочтительной транс-конфигурации на пирролидиноновом кольце.

Например, фрагмент  $C(O)N(Q^2)(R^6)$  (связанный с углеродом в 3-положении 10 пирролидинонового кольца, где как  $Y^1$ , так и  $Y^2$  представляет собой кислород, и  $J^2$  представляет собой  $-CR^2R^3$ , и как  $R^2$ , так и  $R^3$  представляет собой H) и  $Q^1$  (связанный с углеродом в 4-положении пирролидинонового кольца) обычно встречаются в 15 транс-конфигурации. Эти два атома углерода (т. е. каждый в 3- и 4-положениях имеет центральное кольцо формулы 1) оба имеют хиральный центр. Две наиболее 20 распространенные пары энантиомеров изображены как соединение формулы 1' и соединение формулы 1'', где указаны хиральные центры (т. е. как 3R,4S или как 3S,4R). Специалисту в данной области техники будет понятно, что в некоторых вариантах 25 осуществления настоящего изобретения обозначение R или S определяется относительно других заместителей вокруг одного и того же углерода, и, поэтому, соединению по настоящему изобретению также может быть присвоено обозначение 3S,4S. Для исчерпывающего обсуждения всех аспектов стереоизомерии см. Ernest L. Eliel and Samuel H. Wilen, *Stereochemistry of Organic Compounds*, John Wiley & Sons, 1994.



30 Рисунки молекул, изображенные в данном документе, созданы с соблюдением стандартных правил создания изображений в стереохимии. Для того, чтобы показать стереоконфигурацию, связи, направленные вверх относительно плоскости рисунка и направленные к наблюдателю, изображены в виде сплошных клиньев, причем широкий конец клина соединен с атомом, направленным вверх относительно плоскости рисунка в направлении к наблюдателю. Связи, направленные вниз относительно плоскости рисунка и направленные от наблюдателя, изображены пунктирными клиньями, причем узкий конец клина соединен с атомом, находящимся дальше от наблюдателя. Линии 35 постоянной толщины показывают связи, противоположно или нейтрально направленные относительно связей, показанных в виде сплошных или пунктирных клиньев; при этом линии постоянной толщины также показывают связи в молекулах или частях молекул, в которых не предполагается указывать конкретную стереоконфигурацию.

40 Настоящее изобретение предусматривает рацемические смеси, например, равные количества энантиомеров формул 1' и 1''. Кроме того, настоящее изобретение включает соединения, обогащенные по сравнению с рацемической смесью энантиомером формулы 1. Также включены практически чистые энантиомеры соединений формулы 1, например, формулы 1' и формулы 1''.

45 После обогащения энантиомером (т. е. энантиообогащении) один энантиомер

присутствует в большем количестве, чем другой, и степень обогащения может быть определена выражением энантиомерного избытка ("е<sub>е</sub>"), который определяют как  $(2x-1) \cdot 100\%$ , где x является мольной долей преобладающего энантиомера в смеси (например, ее 20% соответствует соотношению энантиомеров 60:40). Соединения по настоящему

изобретению можно получать энантиомерно обогащенными (т. е.

энантиообогащенными) путем применения соответствующего энантиомерно обогащенного промежуточного соединения в ходе синтеза. В этих случаях энантиомерный избыток не измеряют в конечном продукте, но его считают "энантиомерно обогащенным" на основании эквивалентных известных из литературы химических преобразований.

Предпочтительно композиции по настоящему изобретению характеризуются энантиомерным избытком более активного изомера, составляющим по меньшей мере 50%; более предпочтительно энантиомерным избытком, составляющим по меньшей мере 75%; еще более предпочтительно энантиомерным избытком, составляющим по меньшей мере 90%; и наиболее предпочтительно энантиомерным избытком, составляющим по меньшей мере 94%. Особый интерес представляют энантиомерно чистые варианты осуществления более активного изомера.

Соединения формулы 1 могут содержать дополнительные хиральные центры.

Например, заместители и другие составляющие молекулы, такие как R<sup>2</sup> и R<sup>3</sup>, могут сами по себе содержать хиральные центры. Настоящее изобретение предусматривает рацемические смеси, а также обогащенные и, по сути, чистые стереоконфигурации при таких дополнительных хиральных центрах.

Соединения по настоящему изобретению могут существовать в виде одного или нескольких конформационных изомеров в связи с ограниченным вращением вокруг амидной связи (например, C(O)N(Q<sup>2</sup>)(R<sup>6</sup>)) в формуле 1. Настоящее изобретение предусматривает смеси конформационных изомеров. Кроме того, настоящее изобретение включает соединения, которые обогащены одним конформером по отношению к другим.

Соединения формулы 1, как правило, существуют в более чем одной форме, и формула 1, следовательно, включает все кристаллические и некристаллические формы соединений, в которых они представлены. Некристаллические формы включают варианты осуществления, которые представляют собой твердые вещества, такие как воски и смолы, а также варианты осуществления, которые представляют собой жидкости, такие как растворы и расплавы. Кристаллические формы включают варианты осуществления, которые представляют собой, по сути, один кристаллический тип, и варианты осуществления, которые представляют собой смесь полиморфов (т. е. различных кристаллических типов). Выражение "полиморф" относится к определенной кристаллической форме химического соединения, которое может кристаллизоваться в различные кристаллические формы, причем данные формы имеют разные расположения и/или конформации молекул в кристаллической решетке. Хотя полиморфы могут иметь одинаковый химический состав, они также могут отличаться по составу в связи с присутствием или отсутствием совместно кристаллизованной воды или других молекул, которые могут быть слабо или сильно связаны в решетке. Полиморфы могут отличаться такими химическими, физическими и биологическими свойствами, как форма кристалла, плотность, твердость, цвет, химическая стабильность, температура плавления, гигроскопичность, способность к сус펜дированию, скорость растворения и биологическая доступность. Специалисту в данной области техники будет понятно, что полиморф соединения формулы 1 может проявлять положительные эффекты

(например, возможность применения для получения полезных составов, улучшенная биологическая эффективность) по отношению к другому полиморфу или смеси полиморфов того же соединения формулы 1. Получение и выделение определенного полиморфа соединения формулы 1 можно осуществлять с помощью способов, известных

5 специалистам в данной области техники, включая, например, кристаллизацию с применением выбранных растворителей и температур. Для исчерпывающего обсуждения полиморфизма см. R. Hilfiker, Ed., *Polymorphism in the Pharmaceutical Industry*, Wiley-VCH, Weinheim, 2006.

Специалисту в данной области техники будет понятно, что не все содержащие азот

10 гетероциклы могут образовывать *N*-оксиды, поскольку азоту нужна доступная неподеленная пара для окисления до оксида; специалисту в данной области техники будут известны такие содержащие азот гетероциклы, которые могут образовывать *N*-оксиды. Специалисту в данной области техники также будет известно, что третичные амины могут образовывать *N*-оксиды. Способы синтеза для получения *N*-оксидов

15 гетероциклов и третичных аминов хорошо известны специалистам в данной области техники, в том числе окисление гетероциклов и третичных аминов пероксикилотами, такими как перуксусная и *мета*-хлорпербензойная кислота (МСРВА), пероксидом водорода, гидропероксидами алкилов, такими как гидропероксид *трет*-бутила, перборатом натрия и диоксиранами, такими как диметилдиоксиран. Эти способы

20 получения *N*-оксидов были подробно описаны и рассмотрены в литературе, см., например: T. L. Gilchrist in *Comprehensive Organic Synthesis*, vol. 7, pp 748-750, S. V. Ley, Ed., Pergamon Press; M. Tisler and B. Stanovnik in *Comprehensive Heterocyclic Chemistry*, vol. 3, pp 18-20, A. J. Boulton and A. McKillop, Eds., Pergamon Press; M. R. Grimmett and B. R. T. Keene in *Advances in Heterocyclic Chemistry*, vol. 43, pp 149-161, A. R. Katritzky, Ed., Academic Press; M. Tisler and B. Stanovnik in *Advances in Heterocyclic Chemistry*, vol. 9, pp 285-291, A. R. Katritzky and A. J. Boulton, Eds., Academic Press; G. W. H. Cheeseman and E. S. G. Werstiuk in *Advances in Heterocyclic Chemistry*, vol. 22, pp 390-392, A. R. Katritzky and A. J. Boulton, Eds., Academic Press.

Специалисту в данной области техники известно, что поскольку в окружающей среде 30 и в физиологических условиях соли химических соединений находятся в равновесии с их соответствующими несолевыми формами, то соли обладают такой же биологической применимостью, что и несолевые формы. Таким образом, широкий спектр солей соединения формулы 1 является пригодным для контроля нежелательной растительности (т. е. является подходящим с точки зрения сельского хозяйства). Соли соединения

35 формулы 1 включают соли присоединения кислоты с неорганическими или органическими кислотами, такими как бромистоводородная, хлористоводородная, азотная, фосфорная, серная, уксусная, масляная, фумаровая, молочная, малеиновая, малоновая, щавелевая, пропионовая, салициловая, винная, 4-толуолсульфоновая или валериановая кислоты. Если соединение формулы 1 содержит кислотный фрагмент,

40 такой как карбоновая кислота или фенол, то соли также включают соли, образованные органическими или неорганическими основаниями, такими как пиридин, триэтиламин или аммиак, или амиды, гидриды, гидроксиды или карбонаты натрия, калия, лития, кальция, магния или бария. Соответственно, настоящее изобретение предусматривает соединения, выбранные из соединений формулы 1, их *N*-оксидов и подходящих с точки зрения сельского хозяйства солей.

Варианты осуществления настоящего изобретения, описанные в кратком описании изобретения, включают следующие (где соединение формулы 1, как применяется в следующих вариантах осуществления, включает его *N*-оксиды и соли).

5 Вариант осуществления 1. Соединение формулы 1, где, если  $Q^1$  представляет собой 5-6-членное гетероароматическое кольцо или 8-10-членную гетероароматическую бициклическую кольцевую систему, то каждое кольцо или кольцевая система

10 5 необязательно замещены не более 4 заместителями, независимо выбранными из  $R^7$  при членах кольца, представляющих собой атом углерода, и выбранными из  $R^9$  при членах кольца, представляющих собой атом азота.

15 Вариант осуществления 2. Соединение согласно варианту осуществления 1, где  $Q^1$  не является замещенным  $R^7$  или  $R^9$ .

20 Вариант осуществления 3. Соединение формулы 1, где  $Q^1$  представляет собой фенильное кольцо или нафталинильную кольцевую систему, причем каждое кольцо или кольцевая система необязательно замещены 1-4 заместителями, независимо выбранными из  $R^7$ .

25 Вариант осуществления 4. Соединение согласно варианту осуществления 3, где  $Q^1$  представляет собой фенильное кольцо, необязательно замещенное 1-2 заместителями, независимо выбранными из  $R^7$ .

30 Вариант осуществления 5. Соединение согласно варианту осуществления 4, где  $Q^1$  представляет собой фенильное кольцо, замещенное 1 заместителем, выбранным из  $R^7$ .

35 Вариант осуществления 6. Соединение согласно варианту осуществления 4, где  $Q^1$  представляет собой фенильное кольцо, незамещенное  $R^7$ .

40 Вариант осуществления 7. Соединение формулы 1 или согласно любому из варианта осуществления 1 - варианта осуществления 6, где, если  $Q^2$  представляет собой 5-6-членное гетероароматическое кольцо или 8-10-членную гетероароматическую бициклическую кольцевую систему, то каждое кольцо или кольцевая система необязательно замещены не более 5 заместителями, независимо выбранными из  $R^{10}$  при членах кольца, представляющих собой атом углерода, и выбранными из  $R^{11}$  при членах кольца, представляющих собой атом азота.

45 Вариант осуществления 8. Соединение формулы 1 или согласно любому из варианта осуществления 1 - варианта осуществления 6, где  $Q^2$  представляет собой фенильное кольцо, необязательно замещенное 1-5 заместителями, независимо выбранными из  $R^{10}$ .

50 Вариант осуществления 9. Соединение согласно варианту осуществления 8, где  $Q^2$  представляет собой фенильное кольцо, необязательно замещенное 1-3 заместителями, независимо выбранными из  $R^{10}$ .

55 Вариант осуществления 10. Соединение согласно варианту осуществления 9, где  $Q^2$  представляет собой фенильное кольцо, необязательно замещенное 1-2 заместителями, независимо выбранными из  $R^{10}$ .

60 Вариант осуществления 11. Соединение формулы 1 или согласно любому из варианта осуществления 1 - варианта осуществления 10, где  $Q^2$  представляет собой фенильное кольцо, имеющее по меньшей мере один заместитель, выбранный из  $R^{10}$ , в орто-положении (и необязательно другие заместители).

65 Вариант осуществления 12. Соединение формулы 1 или согласно любому из варианта

осуществления 1 - варианта осуществления 9, где, если  $Q^2$  представляет собой фенильное кольцо, замещенное по меньшей мере двумя заместителями, выбранными из  $R^{10}$ , то по меньшей мере один заместитель находится в орто-положении, и по меньшей мере один заместитель находится в пара-положении фенильного кольца.

5 Вариант осуществления 13. Соединение формулы 1 или согласно любому из варианта осуществления 1 - варианта осуществления 9, где  $Q^2$  представляет собой фенильное кольцо, замещенное тремя заместителями, выбранными из  $R^{10}$ , и три заместителя находятся в орто-, мета- и пара-положениях фенильного кольца.

10 Вариант осуществления 14. Соединение формулы 1 или согласно любому из варианта осуществления 1 - варианта осуществления 13, где  $T$  представляет собой  $J^1$ -A-.

Вариант осуществления 15. Соединение согласно варианту осуществления 14, где  $A$  представляет собой насыщенную, частично ненасыщенную или полностью ненасыщенную цепь, содержащую 1-3 атома, выбранных из не более 3 атомов углерода, не более 1 атома O, не более 1 атома S и не более 2 атомов N, причем цепь необязательно замещена не более 2 заместителями, независимо выбранными из  $R^{15}$  при атомах углерода и  $R^{16}$  при атомах азота.

20 Вариант осуществления 16. Соединение согласно варианту осуществления 15, где  $A$  представляет собой  $-CH_2-$ ,  $-CH_2O-$ ,  $-CH_2NH-$ ,  $-CH=CH-$ ,  $-C\equiv C-$ ,  $-NH-$ ,  $-O-$ ,  $-S-$ ,  $-SO-$  или  $-SO_2-$ .

Вариант осуществления 17. Соединение согласно варианту осуществления 16, где  $A$  представляет собой  $-CH_2-$ ,  $-CH_2O-$ ,  $-CH_2NH-$ ,  $-CH=CH-$ ,  $-C\equiv C-$ ,  $-NH-$  или  $-O-$ .

25 Вариант осуществления 18. Соединение согласно варианту осуществления 17, где  $A$  представляет собой  $-CH_2O-$  или  $-O-$ .

Вариант осуществления 19. Соединение формулы 1 или согласно любому из варианта осуществления 1 - варианта осуществления 18, где  $J^1$  представляет собой фенильное кольцо или нафталинильную кольцевую систему, причем каждое кольцо или кольцевая система необязательно замещены не более 5 заместителями, независимо выбранными из  $R^7$ ; или 4-6-членное гетероциклическое кольцо или 8-10-членную гетероароматическую бициклическую кольцевую систему, причем каждое кольцо или кольцевая система содержат члены кольца, выбранные из атомов углерода и 1-4 гетероатомов, независимо выбранных из не более 2 атомов O, не более 2 атомов S и не более 4 атомов N, причем не более 3 членов кольца, представляющих собой атом углерода, независимо выбраны из  $C(=O)$  и  $C(=S)$ , а члены кольца, представляющие собой атом серы, независимо выбраны из  $S(=O)_u(=NR^8)_v$ , причем каждое кольцо или кольцевая система необязательно замещены не более 5 заместителями, независимо выбранными из  $R^7$  при членах кольца,

40 представляющих собой атом углерода, и выбранными из  $R^9$  при членах кольца, представляющих собой атом азота; или  $C_4-C_{10}$ циклоалкилалкокси,

$C_4-C_{10}$ циклоалкилалкил,  $C_2-C_8$ алкенилокси,  $C_2-C_8$ галогеналкенилокси,

45  $C_2-C_8$ алкоксиалкокси,  $C_2-C_8$ алкилтиоалкил,  $C_2-C_8$ алкилсульфинилалкил,

$C_2-C_8$ алкилсульфонилалкил,  $C_1-C_8$ алкилсульфонилокси,

$C_1-C_8$ галогеналкилсульфонилокси,  $C_1-C_8$ алкилтио,  $C_1-C_8$ галогеналкитио,

$C_3-C_8$ циклоалкилтио,  $C_1-C_8$ алкилсульфинил,  $C_1-C_8$ галогеналкилсульфинил,

С<sub>1</sub>-С<sub>8</sub>алкилсульфонил, С<sub>1</sub>-С<sub>8</sub>галогеналкилсульфонил, С<sub>2</sub>-С<sub>8</sub>алкинил,  
 С<sub>2</sub>-С<sub>8</sub>галогеналкинил, С<sub>2</sub>-С<sub>8</sub>алкоксиалкил, С<sub>2</sub>-С<sub>8</sub>галогеналкоксиалкил,  
 С<sub>3</sub>-С<sub>8</sub>галогеналкоксиалкокси, С<sub>1</sub>-С<sub>8</sub>галогеналкил, С<sub>3</sub>-С<sub>8</sub>галогенциклоалкил,  
 5 С<sub>2</sub>-С<sub>8</sub>алкилкарбонилокси или С<sub>2</sub>-С<sub>8</sub>галогеналкилкарбонилокси.

Вариант осуществления 20. Соединение согласно варианту осуществления 19, где J<sup>1</sup> представляет собой фенильное кольцо или нафтилильную кольцевую систему, причем каждое кольцо или кольцевая система, необязательно замещены не более 4 заместителями, независимо выбранными из R<sup>7</sup>.

10 Вариант осуществления 21. Соединение согласно варианту осуществления 20, где J<sup>1</sup> представляет собой фенильное кольцо, необязательно замещенное не более 3 заместителями, независимо выбранными из R<sup>7</sup>.

15 Вариант осуществления 22. Соединение согласно варианту осуществления 21, где J<sup>1</sup> представляет собой фенильное кольцо, необязательно замещенное 1 заместителем, независимо выбранным из R<sup>7</sup>.

20 Вариант осуществления 23. Соединение согласно варианту осуществления 22, где J<sup>1</sup> представляет собой фенильное кольцо, незамещенное R<sup>7</sup>.

25 Вариант осуществления 24. Соединение согласно варианту осуществления 19, где J<sup>1</sup> представляет собой 4-6-членное гетероциклическое кольцо или 8-10-членную гетероароматическую бициклическую кольцевую систему, причем каждое кольцо или кольцевая система содержат члены кольца, выбранные из атомов углерода и 1-4 гетероатомов, независимо выбранных из не более 2 атомов O, не более 2 атомов S и не более 4 атомов N, причем не более 3 членов кольца, представляющих собой атом углерода, независимо выбраны из C(=O) и C(=S), а члены кольца, представляющие собой атом серы, независимо выбраны из S(=O)<sub>u</sub>(=NR<sup>8</sup>)<sub>v</sub>, причем каждое кольцо или кольцевая система необязательно замещены не более 5 заместителями, независимо выбранными из R<sup>7</sup> при членах кольца, представляющих собой атом углерода, и 30 выбранными из R<sup>9</sup> при членах кольца, представляющих собой атом азота.

35 Вариант осуществления 25. Соединение согласно варианту осуществления 24, где J<sup>1</sup> представляет собой 4-6-членное гетероциклическое кольцо, содержащее члены кольца, выбранные из атомов углерода и 1-3 гетероатомов, независимо выбранных из не более 2 атомов O, не более 2 атомов S и не более 3 атомов N, причем не более 2 членов кольца, представляющих собой атом углерода, независимо выбраны из C(=O) и C(=S), а члены кольца, представляющие собой атом серы, независимо выбраны из S(=O)<sub>u</sub>(=NR<sup>8</sup>)<sub>v</sub>, причем каждое кольцо или кольцевая система необязательно замещены не более 3 заместителями, независимо выбранными из R<sup>7</sup> при членах кольца, представляющих собой атом углерода, и выбранными из R<sup>9</sup> при членах кольца, представляющих собой атом азота.

45 Вариант осуществления 26. Соединение согласно варианту осуществления 25, где J<sup>1</sup> представляет собой 5-6-членное гетероароматическое кольцо, необязательно замещенное 1 заместителем, выбранным из R<sup>7</sup> при членах кольца, представляющих собой атом углерода.

Вариант осуществления 27. Соединение согласно варианту осуществления 26, где  $J^1$  представляет собой незамещенное пиридиновое кольцо.

Вариант осуществления 28. Соединение согласно варианту осуществления 19, где  $J^1$  представляет собой  $C_4$ - $C_{10}$ циклоалкилалкокси,  $C_4$ - $C_{10}$ циклоалкилалкил,

$C_2$ - $C_8$ алкенилокси,  $C_2$ - $C_8$ галогеналкенилокси,  $C_2$ - $C_8$ алкоксиалкокси,  $C_2$ - $C_8$ алкилтиоалкил,

$C_2$ - $C_8$ алкилсульфинилалкил,  $C_2$ - $C_8$ алкилсульфонилалкил,  $C_1$ - $C_8$ алкилсульфонилокси,

$C_1$ - $C_8$ галогеналкисульфонилокси,  $C_1$ - $C_8$ алкилтио,  $C_1$ - $C_8$ галогеналкитио,

$C_3$ - $C_8$ циклоалкилтио,  $C_1$ - $C_8$ алкилсульфинил,  $C_1$ - $C_8$ галогеналкисульфинил,

$C_1$ - $C_8$ алкилсульфонил,  $C_1$ - $C_8$ галогеналкисульфонил,  $C_2$ - $C_8$ алкинил,

$C_2$ - $C_8$ галогеналкенинил,  $C_2$ - $C_8$ алкоксиалкил,  $C_2$ - $C_8$ галогеналкоксиалкил,

$C_3$ - $C_8$ галогеналкоксиалкокси,  $C_2$ - $C_8$ галогеналкоксигалогеналкил,  $C_1$ - $C_8$ галогеналкоксиалкил,

$C_3$ - $C_8$ галогенциклоалкил,  $C_2$ - $C_8$ алкилкарбонилокси или  $C_2$ - $C_8$ галогеналкокарбонилокси.

Вариант осуществления 29. Соединение формулы 1 или согласно любому из варианта осуществления 1 - варианта осуществления 13, где Т представляет собой  $R^{17}ON=CR^{17a}-$ ,  $(R^{18})_2C=NO-$ ,  $(R^{19})_2NN=CR^{17a}-$ ,  $(R^{18})_2C=NNR^{20a}-$ ,  $R^{20}N=CR^{17a}-$ ,  $(R^{18})_2C=N-$ ,  $R^{23}ON=$

$CR^{17a}C(R^{23b})_2-$  или  $(R^{18})_2C=NOC(R^{24a})_2-$ , при этом свободная связь, направленная вправо, указывает на точку соединения с  $Q^1$ .

Вариант осуществления 30. Соединение согласно варианту осуществления 29, где каждый  $R^{17}$  независимо представляет собой Н,  $C_1$ - $C_6$ алкил,  $C_3$ - $C_8$ циклоалкил,

$C_4$ - $C_8$ циклоалкилалкил или  $C_1$ - $C_6$ галогеналкил.

Вариант осуществления 31. Соединение согласно варианту осуществления 29, где каждый  $R^{17a}$  независимо представляет собой Н,  $C_1$ - $C_6$ алкил,  $C_3$ - $C_8$ циклоалкил,  $C_4$ - $C_8$ циклоалкилалкил или  $C_1$ - $C_6$ галогеналкил.

Вариант осуществления 32. Соединение согласно варианту осуществления 29, где каждый  $R^{18}$  независимо представляет собой Н, гидрокси,  $C_1$ - $C_6$ алкил,  $C_3$ - $C_8$ циклоалкил,  $C_4$ - $C_8$ циклоалкилалкил или  $C_1$ - $C_6$ галогеналкил.

Вариант осуществления 33. Соединение согласно варианту осуществления 29, где каждый  $R^{19}$  независимо представляет собой Н,  $C_1$ - $C_6$ алкил,  $C_3$ - $C_8$ циклоалкил,  $C_4$ - $C_8$ циклоалкилалкил или  $C_1$ - $C_6$ галогеналкил.

Вариант осуществления 34. Соединение согласно варианту осуществления 29, где каждый  $R^{20}$  независимо представляет собой Н, гидрокси, амино,  $C_1$ - $C_6$ алкил,

$C_3$ - $C_8$ циклоалкил,  $C_4$ - $C_8$ циклоалкилалкил или  $C_1$ - $C_6$ галогеналкил.

Вариант осуществления 35. Соединение согласно варианту осуществления 29, где каждый  $R^{20a}$  независимо представляет собой Н,  $C_1$ - $C_6$ алкил,  $C_3$ - $C_8$ циклоалкил,  $C_4$ - $C_8$ циклоалкилалкил или  $C_1$ - $C_6$ галогеналкил.

Вариант осуществления 36. Соединение согласно варианту осуществления 29, где каждый  $R^{23b}$  независимо представляет собой Н, галоген, циано, гидрокси,  $C_1$ - $C_4$ алкил,  $C_3$ - $C_8$ циклоалкил,  $C_4$ - $C_8$ циклоалкилалкил или  $C_1$ - $C_4$ галогеналкил.

Вариант осуществления 37. Соединение согласно варианту осуществления 29, где каждый  $R^{24a}$  независимо представляет собой H,  $C_1$ - $C_4$ алкил,  $C_3$ - $C_8$ циклоалкил,  $C_4$ - $C_8$ циклоалкилалкил или  $C_1$ - $C_4$ галогеналкил.

5 Вариант осуществления 38. Соединение формулы 1 или согласно любому из варианта осуществления 1 - варианта осуществления 37, где  $J^2$  представляет собой  $-CR^2R^3-$ .

Вариант осуществления 39. Соединение формулы 1 или согласно любому из варианта осуществления 1 - варианта осуществления 37, где  $J^2$  представляет собой  $-CR^2R^3-CR^{2a}R^{3a}-$ .

10 Вариант осуществления 40. Соединение формулы 1 или согласно любому из варианта осуществления 1 - варианта осуществления 39, где  $R^1$  представляет собой H, гидрокси, амино,  $C_1$ - $C_6$ алкил,  $C_1$ - $C_6$ галогеналкил,  $C_2$ - $C_6$ алкенил,  $C_3$ - $C_6$ алкинил,  $C_2$ - $C_6$ цианоалкил,  $C_3$ - $C_6$ циклоалкил или  $C_4$ - $C_8$ циклоалкилалкил.

15 Вариант осуществления 41. Соединение согласно варианту осуществления 40, где  $R^1$  представляет собой H,  $C_1$ - $C_6$ алкил или  $C_1$ - $C_6$ галогеналкил.

Вариант осуществления 42. Соединение согласно варианту осуществления 41, где  $R^1$  представляет собой H, Me, Et или  $CHF_2$ .

20 Вариант осуществления 43. Соединение согласно варианту осуществления 42, где  $R^1$  представляет собой H, Me или Et.

Вариант осуществления 44. Соединение согласно варианту осуществления 43, где  $R^1$  представляет собой H.

25 Вариант осуществления 45. Соединение согласно варианту осуществления 43, где  $R^1$  представляет собой Me.

Вариант осуществления 46. Соединение формулы 1 или согласно любому из варианта осуществления 1 - варианта осуществления 45, где  $R^2$  представляет собой H или  $CH_3$ .

30 Вариант осуществления 47. Соединение согласно варианту осуществления 46, где  $R^2$  представляет собой H.

Вариант осуществления 48. Соединение формулы 1 или согласно любому из варианта осуществления 1 - варианта осуществления 47, где  $R^3$  представляет собой H или  $CH_3$ .

35 Вариант осуществления 49. Соединение согласно варианту осуществления 48, где  $R^3$  представляет собой H.

Вариант осуществления 50. Соединение формулы 1 или согласно любому из варианта осуществления 1 - варианта осуществления 49, где  $R^{2a}$  представляет собой H или  $CH_3$ .

40 Вариант осуществления 51. Соединение согласно варианту осуществления 50, где  $R^{2a}$  представляет собой H.

Вариант осуществления 52. Соединение формулы 1 или согласно любому из варианта осуществления 1 - варианта осуществления 51, где  $R^{3a}$  представляет собой H или  $CH_3$ .

45 Вариант осуществления 53. Соединение согласно варианту осуществления 52, где  $R^{3a}$  представляет собой H.

Вариант осуществления 54. Соединение формулы 1 или согласно любому из варианта осуществления 1 - варианта осуществления 53, где  $R^4$  представляет собой H или  $CH_3$ .

Вариант осуществления 55. Соединение согласно варианту осуществления 54, где  $R^4$  представляет собой Н.

Вариант осуществления 56. Соединение формулы 1 или согласно любому из варианта осуществления 1 - варианта осуществления 55, где  $R^5$  представляет собой Н или  $CH_3$ .

Вариант осуществления 57. Соединение согласно варианту осуществления 56, где  $R^5$  представляет собой Н.

Вариант осуществления 58. Соединение формулы 1 или согласно любому из варианта осуществления 1 - варианта осуществления 57, где  $R^6$  представляет собой Н или  $CH_3$ .

Вариант осуществления 59. Соединение согласно варианту осуществления 58, где  $R^6$  представляет собой Н.

Вариант осуществления 60. Соединение формулы 1 или согласно любому из варианта осуществления 1 - варианта осуществления 59, где каждый  $R^7$  независимо представляет собой галоген, циано, нитро,  $C_1$ - $C_4$ алкил,  $C_1$ - $C_4$ цианоалкил,  $C_1$ - $C_4$ цианоалкокси,  $C_1$ - $C_4$ галогеналкил,  $C_2$ - $C_4$ алкенил,  $C_2$ - $C_4$ галогеналкенил,  $C_2$ - $C_4$ алкинил,  $C_2$ - $C_4$ галогеналкинил,  $C_1$ - $C_4$ нитроалкил,  $C_2$ - $C_4$ нитроалкенил,  $C_2$ - $C_4$ алкоксиалкил,  $C_2$ - $C_4$ галогеналкоксиалкил,  $C_3$ - $C_4$ циклоалкил,  $C_3$ - $C_4$ галогенциклоалкил, 20 циклопропилметил, метилциклогексил,  $C_1$ - $C_4$ алкокси,  $C_1$ - $C_4$ галогеналкокси,  $C_2$ - $C_4$ алкенилокси,  $C_2$ - $C_4$ галогеналкенилокси,  $C_3$ - $C_4$ алкинилокси,  $C_3$ - $C_4$ галогеналкинилокси,  $C_3$ - $C_4$ циклоалкокси,  $C_1$ - $C_4$ алкилтио,  $C_1$ - $C_4$ галогеналкилтио,  $C_1$ - $C_4$ алкилсульфинил,  $C_1$ - $C_4$ галогеналкилсульфинил,  $C_1$ - $C_4$ алкилсульфонил, 25  $C_1$ - $C_4$ галогеналкилсульфонил, гидрокси, формил,  $C_2$ - $C_4$ алкилкарбонил,  $C_2$ - $C_4$ алкилкарбонилокси,  $C_1$ - $C_4$ алкилсульфонилокси,  $C_1$ - $C_4$ галогеналкилсульфонилокси, амино,  $C_1$ - $C_4$ алкиламино,  $C_2$ - $C_4$ диалкиламино, формиламино,  $C_2$ - $C_4$ алкилкарбониламино, - $SF_5$ , - $SCN$ ,  $C_3$ - $C_4$ триалкилсилил, триметилсилилметил или триметилсилилметокси.

30 Вариант осуществления 61. Соединение согласно варианту осуществления 60, где каждый  $R^7$  независимо представляет собой галоген, циано,  $C_1$ - $C_2$ алкил,  $C_1$ - $C_3$ галогеналкил или  $C_1$ - $C_3$ алкилсульфонил.

35 Вариант осуществления 62. Соединение согласно варианту осуществления 61, где каждый  $R^7$  независимо представляет собой галоген или  $C_1$ - $C_2$ галогеналкил.

Вариант осуществления 63. Соединение согласно варианту осуществления 62, где каждый  $R^7$  независимо представляет собой галоген или  $CF_3$ .

40 Вариант осуществления 64. Соединение согласно варианту осуществления 63, где каждый  $R^7$  независимо представляет собой F или  $CF_3$ .

Вариант осуществления 65. Соединение формулы 1 или согласно любому из варианта осуществления 1 - варианта осуществления 64, где каждый  $R^{10}$  независимо представляет собой галоген, циано, нитро,  $C_1$ - $C_2$ алкил,  $C_1$ - $C_3$ галогеналкил или  $C_1$ - $C_3$ алкилсульфонил.

45 Вариант осуществления 66. Соединение согласно варианту осуществления 65, где каждый  $R^{10}$  независимо представляет собой галоген или  $C_1$ - $C_2$ галогеналкил.

Вариант осуществления 67. Соединение согласно варианту осуществления 66, где

каждый  $R^{10}$  независимо представляет собой галоген или  $CF_3$ .

Вариант осуществления 68. Соединение согласно варианту осуществления 67, где каждый  $R^{10}$  независимо представляет собой F или  $CF_3$ .

5 Вариант осуществления 69. Соединение согласно варианту осуществления 68, где каждый  $R^{10}$  независимо представляет собой F.

10 Вариант осуществления 70. Соединение формулы 1 или согласно любому из варианта осуществления 1 - варианта осуществления 69, где каждый  $R^7$  независимо представляет собой галоген, циано, нитро,  $C_1$ - $C_8$ алкил или  $C_1$ - $C_8$ галогеналкил.

Вариант осуществления 71. Соединение согласно варианту осуществления 70, где каждый  $R^7$  независимо представляет собой галоген.

15 Вариант осуществления 72. Соединение формулы 1 или согласно любому из варианта осуществления 1 - варианта осуществления 71, где  $Y^1$  представляет собой O.

Вариант осуществления 73. Соединение формулы 1 или согласно любому из варианта осуществления 1 - варианта осуществления 72, где  $Y^2$  представляет собой O.

20 Вариант осуществления 74. Соединение формулы 1 или согласно любому из варианта осуществления 1 - варианта осуществления 73, где как  $Y^1$ , так и  $Y^2$  представляет собой O.

Вариант осуществления 75. Соединение формулы 1 или согласно любому из варианта осуществления 1 - варианта осуществления 74, где каждый из  $R^9$ ,  $R^{9'}$  и  $R^{11}$  независимо представляет собой  $C_1$ - $C_3$ алкил или  $C_3$ - $C_6$ циклоалкил.

25 Вариант осуществления 76. Соединение формулы 1, где T присоединен в 2- или 3- положении  $Q^1$ .

Вариант осуществления 77. Соединение формулы 1, где T присоединен в 3- положении  $Q^1$ .

30 Вариант осуществления 78. Соединение формулы 1, где T представляет собой  $R^{17}ON=CR^{17a}-$ ,  $(R^{18})_2C=NO-$  или  $(R^{19})_2NN=CR^{17a}-$ , при этом свободная связь, направленная вправо, указывает на точку соединения с  $Q^1$ .

35 Вариант осуществления 79. Соединение согласно варианту осуществления 77, где T представляет собой  $R^{17}ON=CR^{17a}-$  или  $(R^{19})_2NN=CR^{17a}-$ , при этом свободная связь, направленная вправо, указывает на точку соединения с  $Q^1$ .

40 Вариант осуществления 80. Соединение формулы 1, где  $J^1$  представляет собой фенильное кольцо или нафталинильную кольцевую систему, причем каждое кольцо или кольцевая система необязательно замещены не более 5 заместителями, независимо выбранными из  $R^7$ ; или 4-6-членное гетероциклическое кольцо или 8-10-членную гетероароматическую бициклическую кольцевую систему, причем каждое кольцо или кольцевая система содержат члены кольца, выбранные из атомов углерода и 1-4 гетероатомов, независимо выбранных из не более 2 атомов O, не более 2 атомов S и не более 4 атомов N, причем не более 3 членов кольца, представляющих собой атом углерода, независимо выбраны из  $C(=O)$  и  $C(=S)$ , а члены кольца, представляющие собой атом серы, независимо выбраны из  $S(=O)_u(=NR^8)_v$ , причем каждое кольцо или

кольцевая система необязательно замещены не более 5 заместителями, независимо выбранными из  $R^7$  при членах кольца, представляющих собой атом углерода, и выбранными из  $R^9$  при членах кольца, представляющих собой атом азота.

5 Вариант осуществления 81. Соединение формулы 1, где  $J^1$  представляет собой  $C_4-C_{10}$ циклоалкилалкокси,  $C_4-C_{10}$ циклоалкилалкил,  $C_2-C_8$ алкенилокси,  $C_2-C_8$ галогеналкенилокси,  $C_2-C_8$ алкоксиалкокси,  $C_2-C_8$ алкилтиоалкил,  $C_2-C_8$ алкилсульфинилалкил,  $C_2-C_8$ алкилсульфонилалкил,  $C_1-C_8$ алкилсульфонилокси,  $C_1-C_8$ алкилтио,  $C_1-C_8$ галогеналкилтио,  $C_3-C_8$ циклоалкилтио,  $C_1-C_8$ алкилсульфинил,  $C_1-C_8$ галогеналкисульфинил,  $C_1-C_8$ алкилсульфонил,  $C_1-C_8$ галогеналкисульфонил,  $C_2-C_8$ алкинил,  $C_2-C_8$ галогеналкинил,  $C_2-C_8$ алкоксиалкил,  $C_2-C_8$ галогеналкоксиалкил,  $C_3-C_8$ галогеналкоксиалкокси,  $C_2-C_8$ галогеналкоксигалогеналкил,  $C_1-C_8$ галогеналкил,  $C_3-C_8$ галогенциклоалкил,  $C_2-C_8$ алкилкарбонилокси или  $C_2-C_8$ галогеналкилкарбонилокси.

20 Вариант осуществления 82. Соединение согласно варианту осуществления 80, где  $J^1$  представляет собой  $C_4-C_{10}$ циклоалкилалкокси,  $C_2-C_8$ алкенилокси,  $C_2-C_8$ галогеналкенилокси,  $C_2-C_8$ алкоксиалкокси,  $C_2-C_8$ алкилсульфонилалкил,  $C_1-C_8$ алкилсульфонилокси,  $C_1-C_8$ галогеналкисульфонилокси,  $C_1-C_8$ алкилтио,  $C_1-C_8$ галогеналкилтио,  $C_3-C_8$ циклоалкилтио,  $C_1-C_8$ алкилсульфинил,  $C_1-C_8$ галогеналкисульфинил,  $C_1-C_8$ алкилсульфонил,  $C_1-C_8$ галогеналкисульфонил,  $C_2-C_8$ алкинил,  $C_3-C_8$ галогеналкоксиалкокси,  $C_2-C_8$ алкилкарбонилокси или  $C_2-C_8$ галогеналкилкарбонилокси.

25 Вариант осуществления 83. Соединение согласно варианту осуществления 81, где  $J^1$  представляет собой  $C_4-C_{10}$ циклоалкилалкил,  $C_2-C_8$ алкилтиоалкил,  $C_2-C_8$ алкилсульфинилалкил,  $C_2-C_8$ алкилсульфонилалкил,  $C_2-C_8$ алкинил,  $C_2-C_8$ галогеналкинил,  $C_2-C_8$ алкоксиалкил,  $C_2-C_8$ галогеналкоксиалкил,  $C_1-C_8$ галогеналкил или  $C_3-C_8$ галогенциклоалкил.

30 Вариант осуществления 84. Соединение согласно варианту осуществления 83, где  $J^1$  представляет собой  $C_2-C_8$ алкилтиоалкил,  $C_2-C_8$ алкилсульфинилалкил,  $C_2-C_8$ алкилсульфонилалкил,  $C_2-C_8$ алкилсульфонил или  $C_2-C_8$ галогеналкоксиалкил.

35 Вариант осуществления 85. Соединение формулы 1 или согласно варианту осуществления 15, где А представляет собой насыщенную, частично ненасыщенную или полностью ненасыщенную цепь, содержащую 2-3 атома, выбранных из не более 3 атомов углерода, не более 1 атома О, не более 1 атома S и не более 1 атома N, причем цепь необязательно замещена не более 2 заместителями, независимо выбранными из  $R^{15}$  при атомах углерода и  $R^{16}$  при атомах азота.

40 Вариант осуществления 86. Соединение согласно варианту осуществления 85, где А представляет собой насыщенную, частично ненасыщенную или полностью ненасыщенную цепь, содержащую 2-3 атома, выбранных из не более 3 атомов углерода, не более 1 атома О и не более 1 атома N, причем цепь необязательно замещена не более 2 заместителями, независимо выбранными из  $R^{15}$  при атомах углерода и  $R^{16}$  при атомах азота.

Вариант осуществления 87. Соединение согласно варианту осуществления 86, где А представляет собой цепь, содержащую 2-3 атома, выбранных из не более 2 атомов углерода, не более 1 атома О и не более 1 атома N, причем цепь необязательно замещена не более 2 заместителями, независимо выбранными из R<sup>15</sup> при атомах углерода и R<sup>16</sup> при атомах азота.

5 Вариант осуществления 88. Соединение формулы 1, где А представляет собой -CH<sub>2</sub>-,-CH<sub>2</sub>O-, -OCH<sub>2</sub>-,-CH<sub>2</sub>NH-, -CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>-,-CH=CH-, -C≡C-, -NH-, -O-, -S-, -SO- или -SO<sub>2</sub>-.

10 Вариант осуществления 89. Соединение формулы 1, где А представляет собой -CH<sub>2</sub>-,-CH<sub>2</sub>O-, -OCH<sub>2</sub>- или -O-, -SO-, или -SO<sub>2</sub>-.

Вариант осуществления 90. Соединение формулы 1, где А представляет собой -CH<sub>2</sub>O-, -OCH<sub>2</sub>-,-CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>-,-CH=CH- или -C≡C-.

15 Вариант осуществления 91. Соединение формулы 1 или согласно любому из вариантов осуществления 16-19 или 88-90, где свободная связь, направленная вправо, указывает на точку соединения А с Q<sup>1</sup>, а свободная связь, направленная влево, указывает на точку соединения А с J<sup>1</sup>.

20 Вариант осуществления 92. Соединение формулы 1, где, если J<sup>2</sup> представляет собой -CR<sup>2</sup>R<sup>3</sup>-<sub>1</sub>, а J<sup>1</sup> представляет собой фенильное кольцо, необязательно замещенное не более 5 заместителями, независимо выбранными из R<sup>7</sup>, то R<sup>7</sup> является отличным от галогена, гидроксила, циано, нитро, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>алкила, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>галогеналкила, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>алкенила, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>алкинила, CHO, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>алкилкарбонила, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>галогеналкилкарбонила, -C(=O)OH, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>алкоксикарбонила, C<sub>4</sub>-C<sub>10</sub>циклоалкоксикарбонила, 25 C<sub>5</sub>-C<sub>12</sub>циклоалкилалкоксикарбонила, -C(=O)NH<sub>2</sub>, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>алкиламинокарбонила, C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub>диалкиламинокарбонила, гидрокси, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>алкокси, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>галогеналкокси, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>алкилкарбонилокси, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>алкилтио, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>галогеналкилтио, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>алкилсульфирила, 30 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>галогеналкилсульфирила, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>алкиламино, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>диалкиламино, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>алкилкарбониламино, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>алкилсульфониламино или C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub>триалкилсилила.

35 Вариант осуществления 93. Соединение формулы 1, где, если J<sup>2</sup> представляет собой -CR<sup>2</sup>R<sup>3</sup>-CR<sup>2a</sup>R<sup>3a</sup>-<sub>1</sub>, а J<sup>1</sup> представляет собой пиридинильное кольцо (т. е. 6-членное гетероциклическое кольцо, необязательно замещенное не более 5 заместителями, независимо выбранными из R<sup>7</sup> при членах кольца, представляющих собой атом углерода), то R<sup>7</sup> является отличным от галогена, гидроксила, циано, нитро, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>алкила, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>галогеналкила, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>алкенила, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>алкинила, CHO, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>алкилкарбонила, 40 C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>галогеналкилкарбонила, -C(=O)OH, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>алкоксикарбонила, C<sub>4</sub>-C<sub>10</sub>циклоалкоксикарбонила, C<sub>5</sub>-C<sub>12</sub>циклоалкилалкоксикарбонила, -C(=O)NH<sub>2</sub>, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>алкиламинокарбонила, C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub>диалкиламинокарбонила, гидрокси, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>алкокси, 45 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>галогеналкокси, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>алкилкарбонилокси, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>алкилтио, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>галогеналкилтио, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>алкилсульфирила, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>галогеналкилсульфирила, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>алкиламино, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>диалкиламино, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>алкилкарбониламино, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>алкилсульфониламино или C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub>триалкилсилила.

5 Вариант осуществления 94. Соединение формулы 1, где  $Q^1$  представляет собой 5-6-членное гетероароматическое кольцо или 8-10-членную гетероароматическую бициклическую кольцевую систему, причем каждое кольцо или кольцевая система необязательно замещены не более 4 заместителями, независимо выбранными из  $R^7$  при членах кольца, представляющих собой атом углерода, и выбранными из  $R^9$  при членах кольца, представляющих собой атом азота.

10 Вариант осуществления 95. Соединение формулы 1, где  $Q^1$  представляет собой фенильное кольцо, необязательно замещенное 1-4 заместителями, независимо выбранными из  $R^7$ ; или 5-6-членное гетероароматическое кольцо, содержащее члены кольца, выбранные из атомов углерода и 1-4 гетероатомов, независимо выбранных из не более 2 атомов O, не более 2 атомов S и не более 4 атомов N, необязательно замещенное не более 4 заместителями, независимо выбранными из  $R^7$  при членах кольца, 15 представляющих собой атом углерода, и выбранными из  $R^9$  при членах кольца, представляющих собой атом азота.

20 Вариант осуществления 96. Соединение формулы 1 или согласно варианту осуществления 95, где  $Q^1$  представляет собой фенильное кольцо, необязательно замещенное не более 4 заместителями, независимо выбранными из  $R^7$ .

25 Вариант осуществления 97. Соединение формулы 1, где  $Q^2$  представляет собой фенильное кольцо, необязательно замещенное не более 5 заместителями, независимо выбранными из  $R^{10}$ ; или 5-6-членное гетероароматическое кольцо, содержащее члены кольца, выбранные из атомов углерода и 1-4 гетероатомов, независимо выбранных из не более 2 атомов O, не более 2 атомов S и не более 4 атомов N, необязательно замещенное не более 5 заместителями, независимо выбранными из  $R^{10}$  при членах кольца, представляющих собой атом углерода, и выбранными из  $R^{11}$  при членах кольца, представляющих собой атом азота.

30 Вариант осуществления 98. Соединение формулы 1 или варианта осуществления 97, где  $Q^2$  представляет собой фенильное кольцо, необязательно замещенное не более 4 заместителями, независимо выбранными из  $R^{10}$ .

35 Вариант осуществления 99. Соединение формулы 1, где  $J^1$  представляет собой фенильное кольцо, необязательно замещенное не более 5 заместителями, независимо выбранными из  $R^7$ ; или 4-6-членное гетероциклическое кольцо, содержащее члены кольца, выбранные из атомов углерода и 1-4 гетероатомов, независимо выбранных из не более 2 атомов O, не более 2 атомов S и не более 4 атомов N, необязательно замещенное не более 5 заместителями, независимо выбранными из  $R^7$  при членах кольца, представляющих собой атом углерода, и выбранными из  $R^9$  при членах кольца, представляющих собой атом азота.

40 Вариант осуществления 100. Соединение формулы 1 или согласно варианту осуществления 99, где  $J^1$  представляет собой фенильное кольцо, необязательно замещенное не более 4 заместителями, независимо выбранными из  $R^7$ ; или 6-членное гетероциклическое кольцо, содержащее члены кольца, выбранные из атомов углерода и 1-3 гетероатомов, независимо выбранных из не более 3 атомов N, необязательно

замещенное не более 4 заместителями, независимо выбранными из  $R^7$  при членах кольца, представляющих собой атом углерода, и выбранными из  $R^9$  при членах кольца, представляющих собой атом азота.

5 Вариант осуществления 101. Соединение формулы 1, где  $R^7$  независимо представляет собой галоген,  $CH_3$ ,  $CH_2CH_3$  или  $CF_3$ .

Вариант осуществления 102. Соединение формулы 1, где  $R^{10}$  независимо представляет собой галоген,  $CH_3$ ,  $CH_2CH_3$  или  $CF_3$ .

10 Вариант осуществления 103. Соединение формулы 1, где каждый  $R^{10}$  независимо представляет собой циано или  $CH_3$ .

Вариант осуществления 104. Соединение формулы 1, где каждый  $R^{16}$  независимо представляет собой  $H$ .

15 Вариант осуществления 105. Соединение формулы 1, где каждый  $R^{16}$  является отличным от  $H$ .

Варианты осуществления настоящего изобретения, включая вышеуказанные варианты осуществления 1-105, а также любые другие варианты осуществления, описанные в данном документе, могут быть объединены любым способом, и описание переменных

20 в вариантах осуществления подходит не только для соединений формулы 1, но также для исходных соединений и промежуточных соединений, пригодных для получения соединений формулы 1. Кроме того, варианты осуществления настоящего изобретения, в том числе вышеизложенные варианты осуществления 1-105, а также любые другие варианты осуществления, описанные в данном документе, и любая их комбинация

25 подходят для композиций и способов по настоящему изобретению.

Далее проиллюстрированы комбинации вариантов осуществления 1-105.

Вариант осуществления А. Соединение формулы 1, где

30  $Q^1$  представляет собой фенильное кольцо, замещенное не более 2 заместителями, выбранными из  $R^7$ ;

$Q^2$  представляет собой фенильное кольцо, замещенное 1-3 заместителями, независимо выбранными из  $R^{10}$ ; и

35 А представляет собой  $-CH_2-$ ,  $-CH_2O-$ ,  $-CH_2NH-$ ,  $-CH=CH-$ ,  $-C\equiv C-$ ,  $-NH-$ ,  $-O-$ ,  $-S-$ ,  $-SO-$  или  $-SO_2-$ .

Вариант осуществления В. Соединение согласно варианту осуществления А, где

$J^1$  представляет собой фенильное кольцо, необязательно замещенное 1 заместителем, независимо выбранным из  $R^7$ ;

40  $J^2$  представляет собой  $-CR^2R^3-$ ;

как  $Y^1$ , так и  $Y^2$  представляет собой  $O$ ;

$R^1$  представляет собой  $H$ ,  $Me$  или  $Et$ ;

$R^4$  представляет собой  $H$ ;

45  $R^5$  представляет собой  $H$ ;

$R^6$  представляет собой  $H$ ;

каждый  $R^7$  независимо представляет собой галоген или  $CF_3$ ;

каждый  $R^7$  независимо представляет собой галоген, циано, нитро,  $C_1$ - $C_8$ алкил или  $C_1$ - $C_8$ галогеналкил; и

каждый  $R^{10}$  независимо представляет собой галоген или  $CF_3$ .

<sup>5</sup> Вариант осуществления С. Соединение согласно варианту осуществления А, где  $J^1$  представляет собой 5-6-членное гетероароматическое кольцо, необязательно замещенное 1 заместителем, выбранным из  $R^7$  при члене кольца, представляющем собой атом углерода;

<sup>10</sup>  $J^2$  представляет собой  $-CR^2R^3-$ ;

как  $Y^1$ , так и  $Y^2$  представляет собой О;

$R^1$  представляет собой Н, Ме или Et;

<sup>15</sup>  $R^4$  представляет собой Н;

$R^5$  представляет собой Н;

$R^6$  представляет собой Н;

каждый  $R^7$  независимо представляет собой галоген или  $CF_3$ ;

<sup>20</sup>  $J^2$  представляет собой 5-6-членное гетероароматическое кольцо, необязательно замещенное 1 заместителем, выбранным из  $R^7$  при члене кольца, представляющем собой атом углерода;

каждый  $R^{10}$  независимо представляет собой галоген или  $CF_3$ .

Вариант осуществления D. Соединение согласно варианту осуществления В, где <sup>25</sup>  $Q^1$  представляет собой фенильное кольцо, незамещенное  $R^7$ ;

$Q^2$  представляет собой фенильное кольцо, замещенное по меньшей мере двумя заместителями, выбранными из  $R^{10}$ , причем по меньшей мере один заместитель находится в орто-положении, и по меньшей мере один заместитель находится в пара-положении фенильного кольца;

А представляет собой  $-CH_2-$ ,  $-CH_2O-$ ,  $-CH_2NH-$ ,  $-CH=CH-$ ,  $-C\equiv C-$ ,  $-NH-$  или О;

$J^1$  представляет собой фенильное кольцо, незамещенное  $R^7$ ;

$R^2$  представляет собой Н; и

<sup>35</sup>  $R^3$  представляет собой Н.

Вариант осуществления Е. Соединение согласно варианту осуществления D, где А представляет собой  $-CH_2O-$  или  $-O-$ .

Вариант осуществления F. Соединение согласно варианту осуществления С, где

<sup>40</sup>  $Q^1$  представляет собой фенильное кольцо, незамещенное  $R^7$ ;

$Q^2$  представляет собой фенильное кольцо, замещенное по меньшей мере двумя заместителями, выбранными из  $R^{10}$ , причем по меньшей мере один заместитель находится в орто-положении, и по меньшей мере один заместитель находится в пара-положении фенильного кольца;

<sup>45</sup> А представляет собой  $CH_2$ ,  $-CH_2O-$ ,  $-CH_2NH-$ ,  $-CH=CH-$ ,  $-C\equiv C-$ ,  $-NH-$  или О;

$J^1$  представляет собой 5-6-членное гетероароматическое кольцо, необязательно замещенное не более 1 заместителем, выбранным из  $R^7$  при члене кольца,

представляющим собой атом углерода;

$R^2$  представляет собой H; и

$R^3$  представляет собой H.

5 Вариант осуществления G. Соединение согласно варианту осуществления F, где

$J^1$  представляет собой незамещенное пиридиновое кольцо;

$Q^2$  представляет собой фенильное кольцо, замещенное тремя заместителями,

выбранными из  $R^{10}$ , и три заместителя находятся в орто-, мета- и пара-положениях  
10 (фенильного кольца); и

А представляет собой  $-CH_2O-$  или  $-O-$ .

Вариант осуществления H. Соединение формулы 1, где

$Q^1$  представляет собой фенильное кольцо, необязательно замещенное 1-4

15 заместителями, независимо выбранными из  $R^7$ ; или 5-6-членное гетероароматическое кольцо, содержащее члены кольца, выбранные из атомов углерода и 1-4 гетероатомов, независимо выбранных из не более 2 атомов O, не более 2 атомов S и не более 4 атомов N, необязательно замещенное не более 4 заместителями, независимо выбранными из  $R^7$  при членах кольца, представляющих собой атом углерода, и выбранными из  $R^9$  при 20 членах кольца, представляющих собой атом азота;

$Q^2$  представляет собой фенильное кольцо, необязательно замещенное не более 5 заместителями, независимо выбранными из  $R^{10}$ ; или 5-6-членное гетероароматическое кольцо, содержащее члены кольца, выбранные из атомов углерода и 1-4 гетероатомов, независимо выбранных из не более 2 атомов O, не более 2 атомов S и не более 4 атомов N, необязательно замещенное не более 5 заместителями, независимо выбранными из 25  $R^{10}$  при членах кольца, представляющих собой атом углерода, и выбранными из  $R^{11}$  при членах кольца, представляющих собой атом азота;

$J^1$  представляет собой фенильное кольцо, необязательно замещенное не более 5

30 заместителями, независимо выбранными из  $R^7$ ; или 4-6-членное гетероциклическое кольцо, содержащее члены кольца, выбранные из атомов углерода и 1-4 гетероатомов, независимо выбранных из не более 2 атомов O, не более 2 атомов S и не более 4 атомов N, необязательно замещенное не более 5 заместителями, независимо выбранными из 35  $R^7$  при членах кольца, представляющих собой атом углерода, и выбранными из  $R^9$  при членах кольца, представляющих собой атом азота;

$R^1$  представляет собой H, гидрокси, амино,  $C_1-C_6$ алкил,  $C_1-C_6$ галогеналкил,

$C_2-C_6$ алкенил,  $C_3-C_6$ алкинил,  $C_2-C_6$ цианоалкил,  $C_3-C_6$ циклоалкил или

40  $C_4-C_8$ циклоалкилалкил; и

А представляет собой насыщенную, частично ненасыщенную или полностью ненасыщенную цепь, содержащую 2-3 атома, выбранных из не более 3 атомов углерода, не более 1 атома O, не более 1 атома S и не более 1 атома N, причем цепь необязательно замещена не более 2 заместителями, независимо выбранными из  $R^{15}$  при атомах углерода 45 и  $R^{16}$  при атомах азота.

Вариант осуществления I. Соединение формулы 1 или варианта осуществления H, где

$Q^1$  представляет собой фенильное кольцо или нафталинильную кольцевую систему, причем каждое кольцо или кольцевая система необязательно замещены 1-4 заместителями, независимо выбранными из  $R^7$ ;

5  $Q^2$  представляет собой фенильное кольцо, необязательно замещенное 1-5 заместителями, независимо выбранными из  $R^{10}$ ; и

$J^1$  представляет собой фенильное кольцо или нафталинильную кольцевую систему, причем каждое кольцо или кольцевая система необязательно замещены не более 4 заместителями, независимо выбранными из  $R^7$ .

Вариант осуществления J. Соединение согласно варианту осуществления I, где А представляет собой  $-CH_2-$ ,  $-CH_2O-$ ,  $-CH_2NH-$ ,  $-CH=CH-$ ,  $-C\equiv C-$ ,  $-NH-$ ,  $-O-$ ,  $-S-$ ,  $-SO-$  или  $-SO_2-$ ;

15 каждый  $R^7$  независимо представляет собой галоген, циано,  $C_1-C_2$ алкил,  $C_1-C_3$ галогеналкил или  $C_1-C_3$ алкилсульфонил;

каждый  $R^{10}$  независимо представляет собой галоген, циано, нитро,  $C_1-C_2$ алкил,  $C_1-C_3$ галогеналкил или  $C_1-C_3$ алкилсульфонил;

20 каждый  $R^7$  независимо представляет собой галоген, циано, нитро,  $C_1-C_8$ алкил или  $C_1-C_8$ галогеналкил;

как  $Y^1$ , так и  $Y^2$  представляет собой О.

Вариант осуществления K. Соединение формулы 1 или согласно варианту 25 осуществления H, где

$Q^1$  представляет собой фенильное кольцо или нафталинильную кольцевую систему, причем каждое кольцо или кольцевая система необязательно замещены 1-4 заместителями, независимо выбранными из  $R^7$ ;

30  $Q^2$  представляет собой фенильное кольцо, необязательно замещенное 1-5 заместителями, независимо выбранными из  $R^{10}$ ; и

$J^1$  представляет собой 4-6-членное гетероциклическое кольцо, содержащее члены кольца, выбранные из атомов углерода и 1-3 гетероатомов, независимо выбранных из не более 2 атомов О, не более 2 атомов S и не более 3 атомов N, причем не более 2 членов кольца, представляющих собой атом углерода, независимо выбраны из  $C(=O)$  и  $C(=S)$ , а члены кольца, представляющие собой атом серы, независимо выбраны из  $S(=O)_u(=NR^8)_v$ , причем каждое кольцо или кольцевая система необязательно замещены не более 3 заместителями, независимо выбранными из  $R^7$  при членах кольца, представляющих собой атом углерода, и выбранными из  $R^9$  при членах кольца, представляющих собой атом азота.

Вариант осуществления L. Соединение согласно варианту осуществления K, где А представляет собой  $-CH_2-$ ,  $-CH_2O-$ ,  $-CH_2NH-$ ,  $-CH=CH-$ ,  $-C\equiv C-$ ,  $-NH-$ ,  $-O-$ ,  $-S-$ ,  $-SO-$  или  $-SO_2-$ ;

каждый  $R^7$  независимо представляет собой галоген, циано,  $C_1-C_2$ алкил,  $C_1-C_3$ галогеналкил или  $C_1-C_3$ алкилсульфонил;

каждый  $R^{10}$  независимо представляет собой галоген, циано, нитро,  $C_1$ - $C_2$ алкил,  $C_1$ - $C_3$ галогеналкил или  $C_1$ - $C_3$ алкилсульфонил;

каждый  $R^7$  независимо представляет собой галоген, циано, нитро,  $C_1$ - $C_8$ алкил или  $C_1$ - $C_8$ галогеналкил; и

как  $Y^1$ , так и  $Y^2$  представляет собой О.

Вариант осуществления М. Соединение формулы 1 или согласно варианту осуществления Н, где

$Q^1$  представляет собой 5-6-членное гетероароматическое кольцо или 8-10-членную гетероароматическую бициклическую кольцевую систему, причем каждое кольцо или кольцевая система необязательно замещены не более 4 заместителями, независимо выбранными из  $R^7$  при членах кольца, представляющих собой атом углерода, и

$Q^2$  выбранными из  $R^9$  при членах кольца, представляющих собой атом азота;

$Q^2$  представляет собой фенильное кольцо, необязательно замещенное 1-5 заместителями, независимо выбранными из  $R^{10}$ ; и

$J^1$  представляет собой 4-6-членное гетероциклическое кольцо, содержащее члены

кольца, выбранные из атомов углерода и 1-3 гетероатомов, независимо выбранных из не более 2 атомов О, не более 2 атомов S и не более 3 атомов N, причем не более 2 членов кольца, представляющих собой атом углерода, независимо выбраны из  $C(=O)$  и  $C(=S)$ , а члены кольца, представляющие собой атом серы, независимо выбраны из  $S(=O)_u(=NR^8)_v$ , причем каждое кольцо или кольцевая система необязательно замещены не более 3 заместителями, независимо выбранными из  $R^7$  при членах кольца, представляющих собой атом углерода, и выбранными из  $R^9$  при членах кольца, представляющих собой атом азота.

Вариант осуществления Н. Соединение согласно варианту осуществления М, где

$A$  представляет собой  $-CH_2-$ ,  $-CH_2O-$ ,  $-CH_2NH-$ ,  $-CH=CH-$ ,  $-C\equiv C-$ ,  $-NH-$ ,  $-O-$ ,  $-S-$ ,  $-SO-$  или  $-SO_2-$ ;

каждый  $R^7$  независимо представляет собой галоген, циано,  $C_1$ - $C_2$ алкил,  $C_1$ - $C_3$ галогеналкил или  $C_1$ - $C_3$ алкилсульфонил;

каждый  $R^{10}$  независимо представляет собой галоген, циано, нитро,  $C_1$ - $C_2$ алкил,  $C_1$ - $C_3$ галогеналкил или  $C_1$ - $C_3$ алкилсульфонил;

каждый  $R^7$  независимо представляет собой галоген, циано, нитро,  $C_1$ - $C_8$ алкил или  $C_1$ - $C_8$ галогеналкил; и

как  $Y^1$ , так и  $Y^2$  представляет собой О.

Вариант осуществления О. Соединение формулы 1 или согласно варианту осуществления Н, где

$Q^1$  представляет собой 5-6-членное гетероароматическое кольцо или 8-10-членную гетероароматическую бициклическую кольцевую систему, причем каждое кольцо или кольцевая система необязательно замещены не более 4 заместителями, независимо выбранными из  $R^7$  при членах кольца, представляющих собой атом углерода, и

выбранными из R<sup>9</sup> при членах кольца, представляющих собой атом азота;

Q<sup>2</sup> представляет собой фенильное кольцо, необязательно замещенное 1-5 заместителями, независимо выбранными из R<sup>10</sup>; и

J<sup>1</sup> представляет собой фенильное кольцо или нафталинильную кольцевую систему, причем каждое кольцо или кольцевая система необязательно замещены не более 4 заместителями, независимо выбранными из R<sup>7</sup>.

Вариант осуществления Р. Соединение согласно варианту осуществления О, где

10 А представляет собой -CH<sub>2</sub>-, -CH<sub>2</sub>O-, -CH<sub>2</sub>NH-, -CH=CH-, -C≡C-, -NH-, -O-, -S-, -SO- или -SO<sub>2</sub>-;

каждый R<sup>7</sup> независимо представляет собой галоген, циано, C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>алкил,

C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>галогеналкил или C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>алкилсульфонил;

15 каждый R<sup>10</sup> независимо представляет собой галоген, циано, нитро, C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>алкил, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>галогеналкил или C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>алкилсульфонил;

каждый R<sup>7</sup> независимо представляет собой галоген, циано, нитро, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>алкил или C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>галогеналкил; и

20 как Y<sup>1</sup>, так и Y<sup>2</sup> представляет собой О.

Конкретные варианты осуществления включают соединения формулы 1, выбранные из группы, состоящей из:

N-(2,4-дифторфенил)-2-оксо-4-[3-(феноксиметил)фенил]-3-пирролидинкарбоксамида

25 и

2-оксо-4-[3-(2-пиридинилокси)фенил]-N-(2,3,4-трифторфенил)-3-пирролидинкарбоксамида.

Настоящее изобретение также относится к способу контроля нежелательной растительности, предусматривающему внесение в месторасположение растительности 30 гербицидно эффективных количеств соединений по настоящему изобретению (например, в виде композиции, описанной в данном документе). Примечательными в качестве вариантов осуществления, относящихся к способам применения, являются варианты осуществления, включающие соединения согласно описанным выше вариантам осуществления. Соединения по настоящему изобретению являются особенно полезными 35 для селективного контроля сорняков сельскохозяйственных культур, таких как пшеница, ячмень, maize, соя, подсолнечник, хлопчатник, масличный рапс и рис, и особенно сельскохозяйственных культур, таких как сахарный тростник, цитрусовые, плодовые и орехоплодные культуры.

Также заслуживают внимания в качестве вариантов осуществления гербицидные 40 композиции по настоящему изобретению, содержащие соединения согласно описанным выше вариантам осуществления.

Настоящее изобретение также включает гербицидную смесь, содержащую (a) соединение, выбранное из соединения формулы 1, его N-оксидов и солей, и (b) по меньшей мере один дополнительный активный ингредиент, выбранный из (b1) 45 ингибиторов фотосистемы II, (b2) ингибиторов синтазы ацетогидроксикислот (AHAS), (b3) ингибиторов ацетил-СоА-карбоксилазы (АССазы), (b4) миметиков ауксина, (b5) ингибиторов 5-енол-пируваткинмат-3-фосфат (EPSP) синтазы, (b6) диверторов электронов фотосистемы I, (b7) ингибиторов протопорфириноген-оксидазы (PPO), (b8)

ингибиторов глутамин-синтетазы (GS), (b9) ингибиторов элонгазы жирных кислот с очень длинной цепью (VLCFA), (b10) ингибиторов транспорта ауксина, (b11) ингибиторов фитоен-десатуразы (PDS), (b12) ингибиторов 4-гидроксифенил-пируватдиоксигеназы (HPPD), (b13) ингибиторов гомогентизат-соленезил-трансферазы (HST), (b14) ингибиторов биосинтеза целлюлозы, (b15) других гербицидов, в том числе средств, прерывающих митоз, органических мышьяковистых соединений, асулама, бромобутида, цинметилина, кумилуриона, дазомета, дифензоквата, димрона, этобензанида, флуренола, фосамина, фосамин-аммония, гидантоцидина, метама, метилдимрона, олеиновой кислоты, оксазикломуфона, пеларгоновой кислоты и 10 пирибутикарба, и (b16) антидотов гербицидов; и солей соединений (b1)-(b16).

"Ингибиторы фотосистемы II" (b1) представляют собой химические соединения, которые связываются с белком D-1 в области связывания  $Q_B$  и, следовательно, блокируют транспорт электронов от  $Q_A$  к  $Q_B$  в тилакоидных мембранах хлоропластов.

15 Электроны, перенос которых в фотосистеме II заблокирован, транспортируются посредством ряда реакций с образованием токсичных соединений, которые разрушают клеточные мембранны и вызывают набухание хлоропластов, просачивание через мембрану и, в конечном итоге, полное разрушение клетки. Область связывания  $Q_B$

20 имеет три различных сайта связывания: сайт связывания A связывает триазины, такие как атразин, триазиноны, такие как гексазинон, и урацилы, такие как бромацил, сайт связывания B связывает фенилмочевины, такие как диурон, и сайт связывания C связывает бензотиадиазолы, такие как бентазон, нитрилы, такие как бромоксилил, и фенилпиридазины, такие как пиридат. Примеры ингибиторов фотосистемы II включают аметрин, амикарбазон, атразин, бентазон, бромацил, бромофеноксим, бромоксилил,

25 хлорбромурон, хлоридазон, хлоротолуруон, хлороксурон, кумилуруон, цианазин, даймурон, десмединам, десметрин, димефурон, диметаметрин, диурон, этидимурон, фенурон, флуометурон, гексазинон, иоксинил, изопротурон, изоурон, ленацил, линурон, метамитрон, метабензтиазурон, метобромурон, метоксурон, метрибузин, монолинурон, небурон, пентанохлор, фенмединам, прометон, прометрин, пропанил, пропазин, 30 пиридафол, пиридат, сидурон, симазин, симетрин, тебутиурон, тербацил, тербуметон, тербутилазин, тербутирин и триэтазин.

"Ингибиторы AHAS" (b2) представляют собой химические соединения, которые ингибируют синтазу ацетогидроксикислот (AHAS), также известную как ацетолактат-синтаза (ALS), и, следовательно, уничтожают растения посредством ингибирования

35 продуцирования разветвленных алифатических аминокислот, таких как валин, лейцин и изолейцин, которые требуются для синтеза белка и клеточного роста. Примеры ингибиторов AHAS включают амидосульфурон, азимсульфурон, бенсульфурон-метил, биспирбак-натрий, клорансулам-метил, хлоримурон-этил, хлорсульфурон, цинкосульфурон, циклосульфамурон, диклосулам, этаметсульфурон-метил,

40 этоксисульфурон, флазасульфурон, флорасулам, флукарбазон-натрий, флуметсулем, флуорисульфурон-метил, флуорисульфурон-натрий, форамсульфурон, галосульфурон-метил, имазаметабенз-метил, имазамокс, имазапик, имазапир, имазаквин, имазетапир, имазосульфурон, йодосульфурон-метил (в том числе натриевую соль), иофенсульфурон (2-йод-*N*-[(4-метокси-6-метил-1,3,5-триазин-2-ил)амино]карбонил]бензолсульфонамид), 45 мезосульфурон-метил, метазосульфурон (3-хлор-4-(5,6-дигидро-5-метил-1,4,2-диоксазин-3-ил)-*N*-[(4,6-диметокси-2-пиридинил)амино]карбонил]-1-метил-1*H*-пиразол-5-сульфонамид), метосулам, метсульфурон-метил, никосульфурон, оксасульфурон, пеноксулам, примисульфурон-метил, пропоксикарбазон-натрий, пропирисульфурон

(2-хлор-*N*-[(4,6-диметокси-2-пиrimидинил)амино]карбонил]-6-пропилимидазо [1,2-*b*]пиридазин-3-сульфонамид), просульфурон, пиразосульфурон-этил, пирибензоксим, пирифталид, пириминобак-метил, пиритиобак-натрий, римсульфурон, сульфометурон-метил, сульфосульфурон, тиенкарбазон, тифенсульфурон-метил, триафамон (*N*-[2-[(4,6-диметокси-1,3,5-триазин-2-ил)карбонил]-6-фторфенил]-1,1-дифтор-*N*-метилметансульфонамид), триасульфурон, трибенурон-метил, трифлоксисульфурон (в том числе натриевую соль), трифлусульфурон-метил и триtosульфурон.

"Ингибиторы АССазы" (b3) представляют собой химические соединения, которые

- 10 ингибируют фермент ацетил-СоА-карбоксилазу, которая отвечает за катализ на ранней стадии при синтезе липидов и жирных кислот у растений. Липиды представляют собой основные компоненты клеточных мембран, и без них невозможно образование новых клеток. Ингибирирование ацетил-СоА-карбоксилазы и последующий дефицит образования липидов приводит к потере целостности клеточной мембраны, особенно в участках 15 активного роста, таких как меристемы. В конечном счете рост побега и ризомы прекращается, и меристемы побега и почки ризомы начинают отмирать. Примеры ингибиторов АССазы включают аллоксидим, бутроксидим, клетодим, клодинафоп, циклоксидим, цигалофоп, диклофоп, феноксапроп, флуазифоп, галоксифоп, пиноксаден, профоксидим, пропаквизафоп, квизалофоп, сетоксидим, тепралоксидим и траллоксидим, 20 в том числе разделенные формы, такие как феноксапроп-Р, флуазифоп-Р, галоксифоп-Р и квизалофоп-Р и сложноэфирные формы, такие как клодинафоп-пропаргил, цигалофоп-бутил, диклофоп-метил и феноксапроп-Р-этил.

Ауксин представляет собой растительный гормон, который регулирует рост многих растительных тканей. "Миметики ауксина" (b4) представляют собой химические

- 25 соединения, имитирующие растительный гормон роста ауксин, таким образом вызывая неконтролируемый и неорганизованный рост, приводящий к гибели чувствительных видов растений. Примеры миметиков ауксина включают аминоциклогирахлор (6-амино-5-хлор-2-циклогиропропил-4-пиридинкарбоновую кислоту) и его метиловые и этиловые сложные эфиры, и его натриевые и калиевые соли, аминопириалид, беназолин-этил, 30 хлорамбен, клацифос, кломепроп, клопириалид, дикамбу, 2,4-Д, 2,4-ДБ, дихлорпроп, флуороксипир, галоксифен (4-амино-3-хлор-6-(4-хлор-2-фтор-3-метоксифенил)-2-пиридинкарбоновую кислоту), галоксифен-метил (метил-4-амино-3-хлор-6-(4-хлор-2-фтор-3-метоксифенил)-2-пиридинкарбоксилат), МСРА, МСРВ, мекопроп, пиклорам, квинклорак, квинмерак, 2,3,6-ТВА, триклопир и метил-4-амино-3-хлор-6-(4-хлор-2-фтор-3-метоксифенил)-5-фтор-2-пиридинкарбоксилат.

"Ингибиторы EPSP синтазы" (b5) представляют собой химические соединения, которые ингибируют фермент, 5-енол-пирувилшикимат-3-фосфат-синтазу, которая вовлечена в синтез ароматических аминокислот, таких как тирозин, триптофан и фенилаланин. Гербициды-ингибиторы EPSP легко абсорбируются листовой растений и

- 40 переносятся по флоэме к точкам роста. Глифосат представляет собой относительно неселективный послевсходовый гербицид, который принадлежит к этой группе. Глифосат включает сложные эфиры и соли, такие как аммониевая, изопропиламмониевая, калиевая, натриевая (в том числе натриевая сесквисоль) и тримезиевая (альтернативно называемая сульфосатом).

- 45 "Диверторы электронов фотосистемы I" (b6) представляют собой химические соединения, которые принимают электроны от фотосистемы I и после нескольких циклов образуют гидроксильные радикалы. Эти радикалы являются чрезвычайно реакционноспособными и легко разрушают ненасыщенные липиды, в том числе жирные

кислоты мембранны и хлорофилл. Это нарушает целостность клеточной мембранны так, что клетки и органеллы "протекают", что приводит к быстрому увяданию и засыханию листьев и, в конечном итоге, к гибели растения. Примеры этих ингибиторов фотосинтеза второго типа включают дикват и паракват.

- 5 "Ингибиторы РРО" (b7) представляют собой химические соединения, которые ингибируют фермент протопорфириногеноксидазу, что быстро приводит к образованию у растений чрезвычайно реакционноспособных соединений, которые разрушают клеточные мембранны, вызывая вытекание жидких компонентов клеток. Примеры ингибиторов РРО включают ацифлуорфен-натрий, азафенидин, бензфендин, бифенокс, 10 бутафенацил, карфентразон, карфентразон-этил, хлометоксилен, цинидон-этил, флуазолат, флуфенпир-этил, флумиклорак-пентил, флумиоксазин, флуорогликофен-этил, флутиацет-метил, фомесафен, галосафен, лактофен, оксадиаргил, оксадиазон, оксифлуорфен, пентоксазон, профлуазол, пираклонил, пирафлуорфен-этил, сафлуфенацил, 15 сульфентразон, тидаизимин, трифлудимозаксин (дигидро-1,5-диметил-6-тиоксо-3-[2,2,7-трифторметил]-1(2Н)-пиридинил]-4-фторфенил]тио]-1-оксопропил]-β-аланинат).

- 15 "Ингибиторы GS" (b8) представляют собой химические соединения, которые ингибируют активность фермента глутамин-синтетазы, который растения используют для превращения аммиака в глутамин. Следовательно, аммиак накапливается, а уровни глутамина снижаются. Повреждение растения, вероятно, происходит вследствие суммарных эффектов токсичности аммиака и недостатка аминокислот, необходимых для других метаболических процессов. Ингибиторы GS включают глюфосинат и его сложные эфиры и соли, такие как глюфосинат аммония и другие производные 25 фосфинотрицина, глюфосинат-Р ((2S)-2-амино-4-(гидроксиметилфосфинил)бутановую кислоту) и биланафос.

- 25 "Ингибиторы элонгазы VLCFA" (b9) представляют собой гербициды с широким спектром химических структур, которые ингибируют элонгазу. Элонгаза представляет собой один из ферментов, расположенных в хлоропластах или рядом с ними, которые вовлечены в биосинтез VLCFA. У растений жирные кислоты с очень длинной цепью являются главными составляющими гидрофобных полимеров, которые предотвращают высыхание поверхности листьев и обеспечивают стабильность пыльцы. Такие гербициды включают ацетохлор, алахлор, анилофос, бутахлор, кафенстрол, диметахлор, диметенамид, дифенамид, феноксасульфон (3-[[2,5-дихлор-4-этоксифенил]метил]сульфонил]-4,5-дигидро-5,5-диметилизоксазол), фентразамид, флуфенацет, инданофан, мефенацет, метазахлор, метолахлор, напроанилид, напропамид, напропамид-М (2R)-N,N-диэтил-2-(1-нафтилилоксий)пропанамид), петоксамид, пиперофос, претилахлор, пропахлор, пропизохлор, пиroxасульфон и тенилхлор, в том числе разделенные формы, такие как S-метолахлор, и хлорацетамиды, и оксиацетамиды.

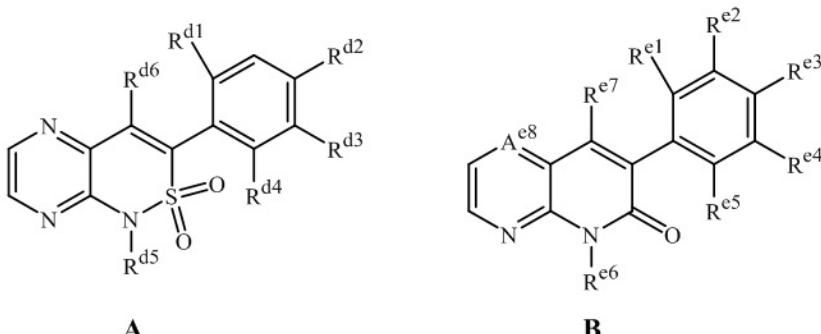
- 40 "Ингибиторы транспорта ауксина" (b10) представляют собой химические вещества, которые ингибируют транспорт ауксина у растений, как например, путем связывания с белком-переносчиком ауксина. Примеры ингибиторов транспорта ауксина включают дифлуорензопир, напталам (также известный как N-(1-нафтил)фталамовая кислота и 2-[(1-нафтилиламино)карбонил]бензойная кислота).

- 45 "Ингибиторы PDS" (b11) представляют собой химические соединения, которые ингибируют путь биосинтеза каротиноидов на стадии фитоен-десатуразы. Примеры ингибиторов PDS включают бефлубутамид, дифлуореникан, флуридон, флуорхлоридон, флуртамон, норфлурзон и николинафен.

"Ингибиторы HPPD" (b12) представляют собой химические вещества, которые ингибируют биосинтез при синтезе 4-гидроксифенилпируватдиоксигеназы. Примеры ингибиторов HPPD включают бензобицилон, бензофенап, бициклогирион (4-гидрокси-3-[[2-[(2-метоксизетокси)метил]-6-(трифторметил)-3-пиридинил]карбонил]бицикло[3.2.1]окт-3-ен-2-он), фенквинотрион (2-[[8-хлор-3,4-дигидро-4-(4-метоксифенил)-3-оксо-2-хиноксалинил]карбонил]-1,3-циклогександион), изоксахлортол, изоксафлутол, мезотрион, пирасульфотол, пиразолинат, пиразоксифен, сулькотрион, тефурилтрион, темботрион, толпиралат (1-[[1-этил-4-[3-(2-метоксизетокси)-2-метил-4-(метилсульфонил)бензоил]-1Н-пиразол-5-ил]окси]этилметилкарбонат), топрамезон, 5-хлор-3-[(2-гидрокси-6-оксо-1-циклогексен-1-ил)карбонил]-1-(4-метоксифенил)-2(1H)-хиноксалинон, 4-(2,6-диэтил-4-метилфенил)-5-гидрокси-2,6-диметил-3(2H)-пиридазинон, 4-(4-фторфенил)-6-[(2-гидрокси-6-оксо-1-циклогексен-1-ил)карбонил]-2-метил-1,2,4-триазин-3,5(2H,4H)-дион, 5-[(2-гидрокси-6-оксо-1-циклогексен-1-ил)карбонил]-2-(3-метоксифенил)-3-(3-метоксипропил)-4(3H)-пиридинон, 2-метил-N-(4-метил-1,2,5-оксадиазол-3-ил)-3-(метилсульфинил)-4-(трифторметил)бензамид и 2-метил-3-(метилсульфонил)-N-(1-метил-1Н-тетразол-5-ил)-4-(трифторметил)бензамид.

"Ингибиторы HST" (b13) нарушают способность растения к превращению гомогентизата в 2-метил-6-соланил-1,4-бензохинон, тем самым нарушая биосинтез каротиноидов. Примеры ингибиторов HST включают галоксидин, пирихлор, циклопириморат (6-хлор-3-(2-циклогексил-6-метилфенокси)-4-пиридазинил-4-морфолинкарбоксилат), 3-(2-хлор-3,6-дифторфенил)-4-гидрокси-1-метил-1,5-нафтиридин-2(1H)-он, 7-(3,5-дихлор-4-пиридинил)-5-(2,2-дифторэтил)-8-гидроксипиридо[2,3-b]пиразин-6(5H)-он и 4-(2,6-диэтил-4-метилфенил)-5-гидрокси-2,6-диметил-3(2H)-пиридазинон.

Ингибиторы HST также включают соединения формул А и В:



где R<sup>d1</sup> представляет собой H, Cl или CF<sub>3</sub>; R<sup>d2</sup> представляет собой H, Cl или Br; R<sup>d3</sup> представляет собой H или Cl; R<sup>d4</sup> представляет собой H, Cl или CF<sub>3</sub>; R<sup>d5</sup> представляет собой CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub> или CH<sub>2</sub>CHF<sub>2</sub>; и R<sup>d6</sup> представляет собой OH или -OC(=O)-i-Pr; и R<sup>e1</sup> представляет собой H, F, Cl, CH<sub>3</sub> или CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>; R<sup>e2</sup> представляет собой H или CF<sub>3</sub>; R<sup>e3</sup> представляет собой H, CH<sub>3</sub> или CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>; R<sup>e4</sup> представляет собой H, F или Br; R<sup>e5</sup> представляет собой Cl, CH<sub>3</sub>, CF<sub>3</sub>, OCF<sub>3</sub> или CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>; R<sup>e6</sup> представляет собой H, CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>CHF<sub>2</sub> или C≡CH; R<sup>e7</sup> представляет собой OH, -OC(=O)Et, -OC(=O)-i-Pr или -OC(=O)-t-Bu; и A<sup>e8</sup> представляет собой N или CH.

"Ингибиторы биосинтеза целлюлозы" (b14) ингибируют биосинтез целлюлозы у определенных растений. Они являются наиболее эффективными при использовании

перед прорастанием или после прорастания на молодые или быстрорастущие растения. Примеры ингибиторов биосинтеза целлюлозы включают хлортиамид, дихлобенил, флупоксам, индазифлам ( $N^2$ -[(1*R*,2*S*)-2,3-дигидро-2,6-диметил-1*H*-инден-1-ил]-6-(1-фторэтил)-1,3,5-триазин-2,4-диамин), изоксабен и триазифлам.

"Другие гербициды" (b15) включают гербициды, которые действуют посредством ряда различных способов действия, как например, средства, прерывающие митоз (например, флампроп-М-метил и флампроп-М-изопропил), органические мышьяковистые соединения (например, DSMA и MSMA), ингибиторы 7,8-дигидроптероат-синтазы, ингибиторы синтеза изопреноидов в хлоропластах и ингибиторы биосинтеза клеточной стенки. Другие гербициды включают такие гербициды с неизвестными способами действия, или не попадающие под конкретную категорию, перечисленную в (b1)-(b14), или действующие посредством комбинации вышеперечисленных способов действия. Примеры других гербицидов включают аклонифен, асулат, амитрол, бромобутид, цинметилин, кломазон, кумилурон, даймурон, дифензокват, этобензанид, флуометурон, флуренол, фосамин, фосамин-аммоний, дазомет, димрон, ипфенкарбазон (1-(2,4-дихлорфенил)-*N*-(2,4-дифторфенил)-1,5-дигидро-*N*-(1-метилэтил)-5-оксо-4*H*-1,2,4-триазол-4-карбоксамид), метам, метилдимрон, олеиновую кислоту, оксазикломефон, пеларгоновую кислоту, пирибутикарб и 5-[[2,6-дифторфенил)метокси]метил]-4,5-дигидро-5-метил-3-(3-метил-2-тиенил)изоксазол.

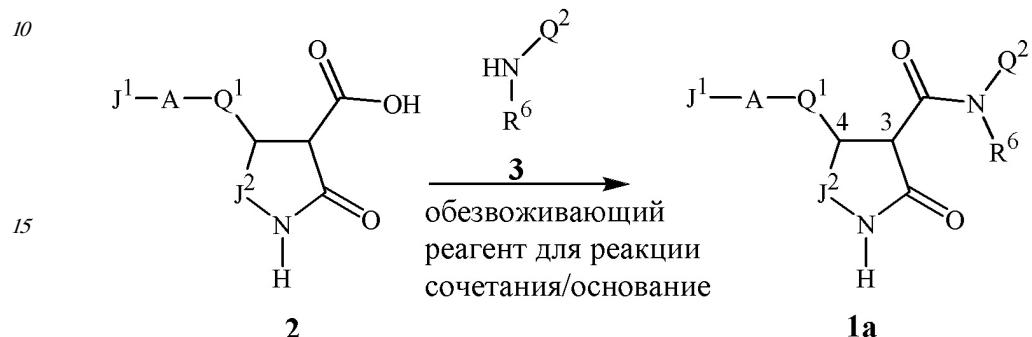
"Антидоты гербицидов" (b16) представляют собой вещества, добавляемые в гербицидные составы для устранения или снижения фитотоксичных эффектов гербицида в отношении определенных сельскохозяйственных культур. Эти соединения защищают сельскохозяйственные культуры от повреждения гербицидами, но, как правило, не препятствуют контролю гербицидом нежелательной растительности. Примеры антидотов гербицидов включают без ограничения беноксакор, клоквинтосет-мексил, кумилурон, циометринил, ципросульфамид, даймурон, дихлормид, дициклонон, диэтолат, димепиперат, фенхлоразол-этил, фенклорим, флуразол, флуксофеним, фурилазол, изоксадифен-этил, мефенпир-диэтил, мефенат, метоксифенон, нафталиновый ангидрид, оксабетринил, *N*-(аминокарбонил)-2-метилбензолсульфонамид и *N*-(аминокарбонил)-2-фторбензолсульфонамид, 1-бром-4-[(хлорметил)сульфонил]бензол, 2-(дихлорметил)-2-метил-1,3-диоксолан (MG 191), 4-(дихлорацетил)-1-окса-4-азоспиро[4.5]декан (MON 4660), 2,2-дихлор-1-(2,2,5-триметил-3-оксазолидинил)этанон и 2-метокси-*N*-[[4-[(метиламино)карбонил]амино]фенил]сульфонил]бензамид.

Соединения формулы 1 можно получать посредством основных способов, известных в области синтетической органической химии. Один или несколько из следующих способов и вариантов, которые описаны на схемах 1-18, можно применять для получения соединений формулы 1. Определения  $R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^3$ ,  $R^4$ ,  $R^5$ ,  $R^6$ ,  $Q^1$ ,  $Q^2$ ,  $J^1$ ,  $J^2$ ,  $T$ ,  $Y^1$  и  $Y^2$  в соединениях формул 1-19 ниже являются такими, как определено выше в кратком описании изобретения, если не указано иное.

Как показано на схеме 1, соединения формулы 1а (т. е. формулы 1, где  $T$  представляет собой  $-A-J^1$ ,  $R^1$ ,  $R^4$  и  $R^5$  представляют собой  $H$ , а  $Y^1$  и  $Y^2$  представляют собой  $O$ ) можно получить путем проведения реакции кислот формулы 2 с аминами формулы 3 в присутствии обезвоживающего реагента для реакции сочетания, такого как пропилфосфоновый ангидрид, дициклогексилкарбодиимид, *N*-(3-диметиламинопропил)-*N*-этилкарбодиимид, *N,N*-карбонилдиimidазол, 2-хлор-1,3-диметилимидазолия хлорид или 2-хлор-1-метилпиридиния йодид. Реагенты на полимерной подложке, такие как циклогексилкарбодиимид на полимерной подложке,

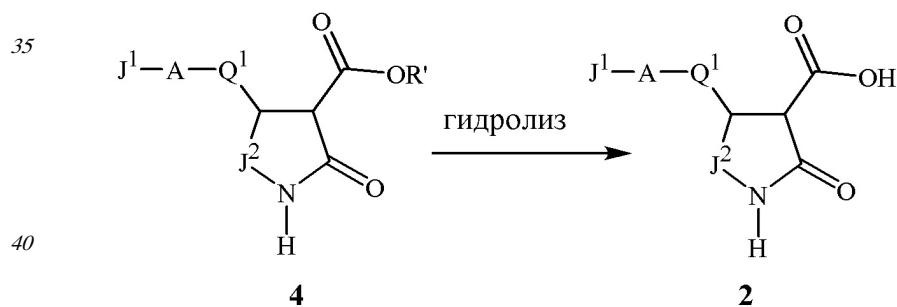
также являются подходящими. Данные реакции, как правило, проводят при значениях температуры в диапазоне 0-60°C, в растворителе, таком как дихлорметан, ацетонитрил, *N,N*-диметилформамид или этилацетат, в присутствии основания, такого как триэтиламин, *N,N*-диизопропиламин или 1,8-диазабицикло[5.4.0]ундец-7-ен. См. *Organic Process Research & Development* 2009, 13, 900-906 для условий сочетания, использующих пропилфосфоновый ангидрид. Способ согласно схеме 1, в котором применяют пропилфосфоновый ангидрид, проиллюстрирован стадией F примера синтеза 2.

Схема 1



Как показано на схеме 2, соединения формулы 2 можно получить путем гидролиза 20 сложных эфиров формулы 4 с помощью способов, хорошо известных специалистам в данной области техники. Гидролиз проводят с помощью водного раствора основания или водного раствора кислоты, как правило, в присутствии сорастворителя. Подходящие для проведения реакции основания включают без ограничения гидроксиды, такие как гидроксид натрия и калия, и карбонаты, такие как карбонат натрия и калия. Подходящие 25 для проведения реакции кислоты включают без ограничения неорганические кислоты, такие как хлористоводородная кислота, бромистоводородная кислота и серная кислота, и органические кислоты, такие как уксусная кислота и трифторуксусная кислота. Широкий спектр сорастворителей, являющихся подходящими для проведения реакции, 30 включает без ограничения метанол, этанол и тетрагидрофуран. Реакцию проводят при значениях температуры в диапазоне от -20°C до температуры кипения растворителя и, как правило, от 0 до 100°C. Способ согласно схеме 2 проиллюстрирован стадией Е примера синтеза 2.

Схема 2



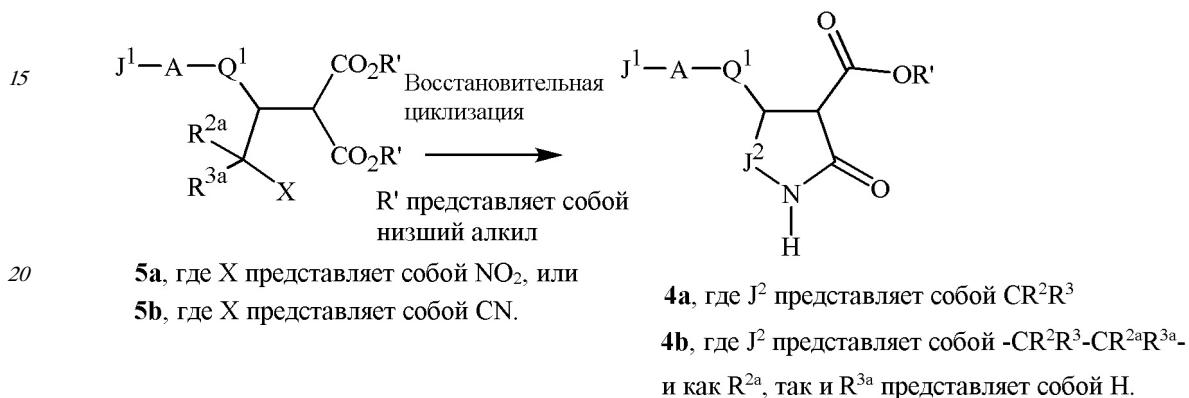
$\text{R}'$  представляет собой низший алкил

Как показано на схеме 3, соединение формулы 4a или 4b можно получить путем 45 восстановления соединения формулы 5a и 5b, соответственно, и последующей *in situ* циклизации полученного в результате промежуточного амина. Из литературы известен широкий спектр способов восстановления алифатической нитро- или нитрильной группы в соединениях формулы 5a или 5b. Способы, хорошо известные специалистам

в данной области техники, включают катализическую гидрогенизацию в присутствии палладиевого катализатора на углеродном носителе или никеля Ренея, металлического железа или цинка в кислотной среде (см., например, *Berichte der Deutschen Chemischen Gesellschaft* 1904, 37, 3520-3525) и алюмогидрида лития. Восстановления алифатической

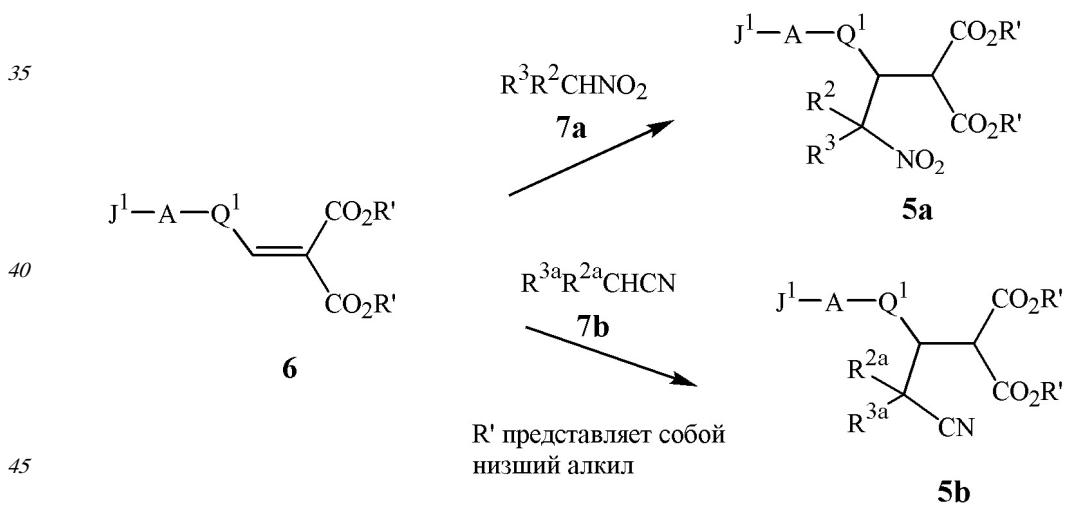
- 5 нитрогруппы также можно достичь с помощью йодида самария(II) в присутствии источника протонов, такого как метанол (см., например, *Tetrahedron Letters* 1991, 32(14), 1699-1702). В качестве альтернативы, можно использовать борогидрид натрия в присутствии никелевого катализатора, такого как ацетат никеля(II) или хлорид никеля(II) (см., например, *Tetrahedron Letters* 1985, 26(52), 6413-6416). Способ согласно схеме 3, 10 в котором применяют борогидрид натрия в присутствии хлорида никеля(II), проиллюстрирован стадией D примера синтеза 1.

Схема 3



25 Как показано на схеме 4, соединение формулы **5a** или **5b** можно получить путем проведения реакции сложных диэфиров формулы **6** с нитроалканами формулы **7a** или с нитрилами формулы **7b**, как правило, в присутствии основания. Подходящие для проведения реакции основания включают низшие алкооксиды щелочных металлов, такие как метоксид натрия в метаноле или этоксид натрия в этаноле. Соединения формулы **6** можно легко получить с помощью способов, известных специалистам в данной области 30 техники, например, путем конденсации Кневенагеля альдегидов и малонатов (см., например, G. Jones, *Organic Reactions* Volume 15, John Wiley and Sons, 1967).

Схема 4

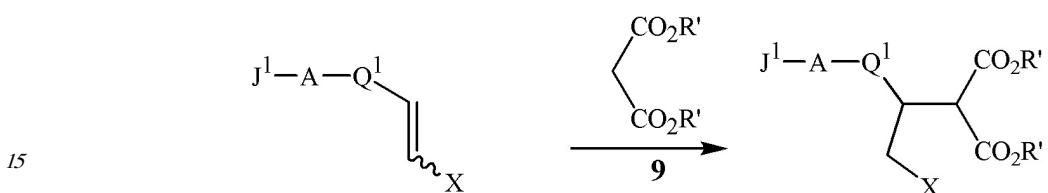


Соединения формул **5c** или **5d** (т. е. формул **5a** или **5b**, где  $\text{R}^2$  и  $\text{R}^3$  представляют собой  $\text{H}$ ) можно получить путем проведения реакции соединений формул **8a** или **8b** с

малонатами формулы 9 в присутствии основания, как показано на схеме 5. Подходящие для данной реакции основания включают без ограничения низшие алcoxиды щелочного металла, такие как метоксид натрия в метаноле или этоксид натрия в этаноле, или основания, такие как бис(триметилсил)амид лития, бис(триметилсил)амид натрия 5 и дизопропиламид лития в растворителях, таких как тетрагидрофуран. Как правило, реакцию проводят в диапазоне от -78°C до 23°C. См. *Synthesis* 2005, 2239-2245 для условий с целью осуществления данного преобразования. Условия для осуществления данного преобразования в нагреваемой с обратным холодильником воде в отсутствие катализатора были изложены в *Synthetic Communications* 2013, 43, 744-748.

10

Схема 5



15

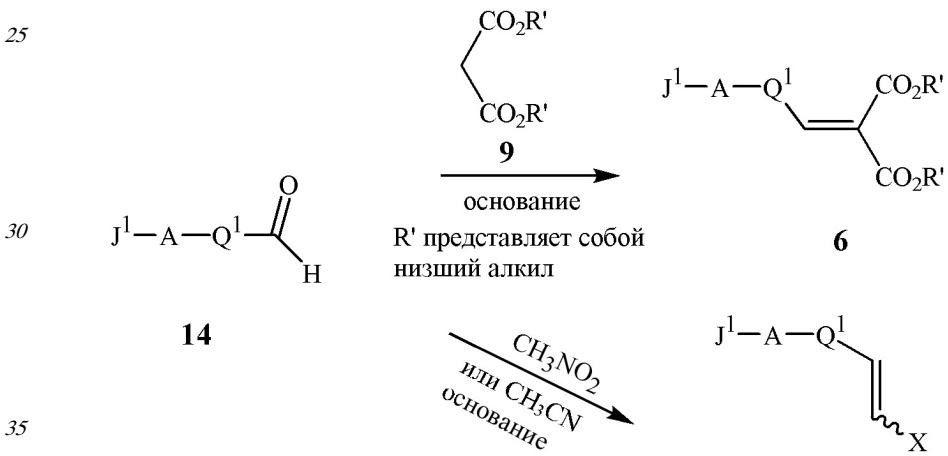
8a, где X представляет собой  $\text{NO}_2$ , и R' представляет собой низший алкил 5c, где X представляет собой  $\text{NO}_2$ , и 8b, где X представляет собой  $\text{CN}$ . 5d, где X представляет собой  $\text{CN}$ .

20

Соединения формулы 6 можно легко получить путем конденсации Кневенагеля

альдегидов формулы 14 и малонатов 9, как показано на схеме 6. Также, как показано на схеме 6, соединения формул 8a и 8b можно получить путем конденсации Кневенагеля альдегидов формулы 14 и нитрометана.

Схема 6



25

30

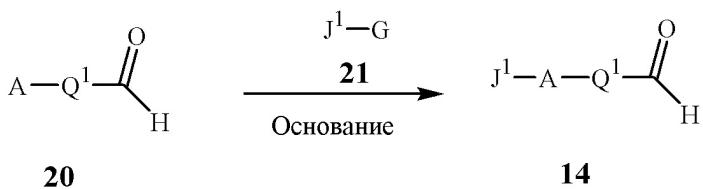
35

8a, где X представляет собой  $\text{NO}_2$ , и 8b, где X представляет собой  $\text{CN}$ .

Как показано на схеме 7, альдегиды формулы 14 можно получить путем проведения реакции альдегидов формулы 20 с соответствующими электрофилами формулы 21 в присутствии основания с металлическим катализатором или без такового. В формуле 21 G обозначает уходящую группу, т. е. нуклеофуг. В зависимости от выбора  $J^1$  подходящие для проведения реакции электрофилы могут включать арил- или алкилгалогениды, такие как хлориды, бромиды и йодиды, алкилсульфонаты, ангидриды кислот, такие как трет-бутоксикарбонилангидрид и уксусный ангидрид, и галогеналкилсиланы, такие как хлортриметилсилан. Подходящие для проведения реакции основания включают неорганические основания, такие как гидроксиды, алcoxиды, карбонаты и фосфаты щелочного или щелочноземельного металла

(например, лития, натрия, калия и цезия), и органические основания, такие как триэтиламин, *N,N*-дизопропилэтиламин и 1,8-диазабицикло[5.4.0]ундец-7-ен. Подходящие катализаторы включают палладий, никель, родий или медь с лигандом или без, таким как фосфины или N-гетероциклические карбены. Широкий спектр растворителей, являющихся подходящими для проведения реакции, включают, например, без ограничения тетрагидрофуран, дихлорметан, *N,N*-диметилформамид, *N,N*-диметилацетамид, *N*-метилпирролидинон, ацетонитрил, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>спирты и ацетон, а также смеси этих растворителей. Данную реакцию проводят при значениях температурах в диапазоне от -20 до 200°C и, как правило, от 0 до 50°C. Например, если A представляет собой -CH<sub>2</sub>OH, см. *Organic and Biomolecular Chemistry* 2013, 11, 3046-3056. Альдегиды формулы 20 являются коммерчески доступными или их легко получить из коммерчески доступного вещества специалистом в данной области техники.

Схема 7

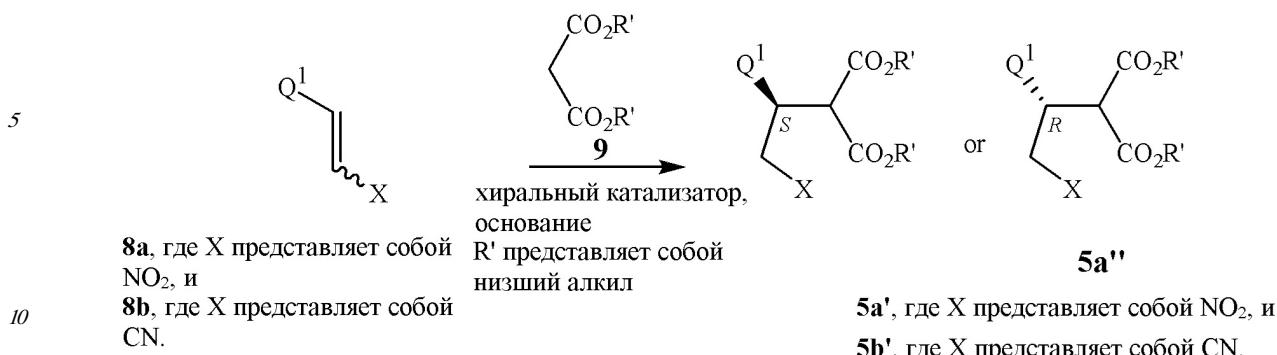


А имеет концевые -OH, -SH или NH.

Если А содержит 1-3 атома С, то специалист в данной области техники может получить соединение формулы 14 с использованием стандартных способов катализируемого переходными металлами кросс-сочетания. Для типичной процедуры катализируемого палладием сочетания Хека см.: *Bioorg. Chem.* 2010, 38, 139-143. Для примера процедуры катализируемой палладием реакции арилгалогенида и триалкилвисмута см.: *Synlett* 2010, 19, 2936-2940. Для катализируемых палладием реакций типа Сузуки см.: *J. Med. Chem.* 2000, 43, 3076, и *J. Med. Chem.* 2012, 43, 1831-1843.

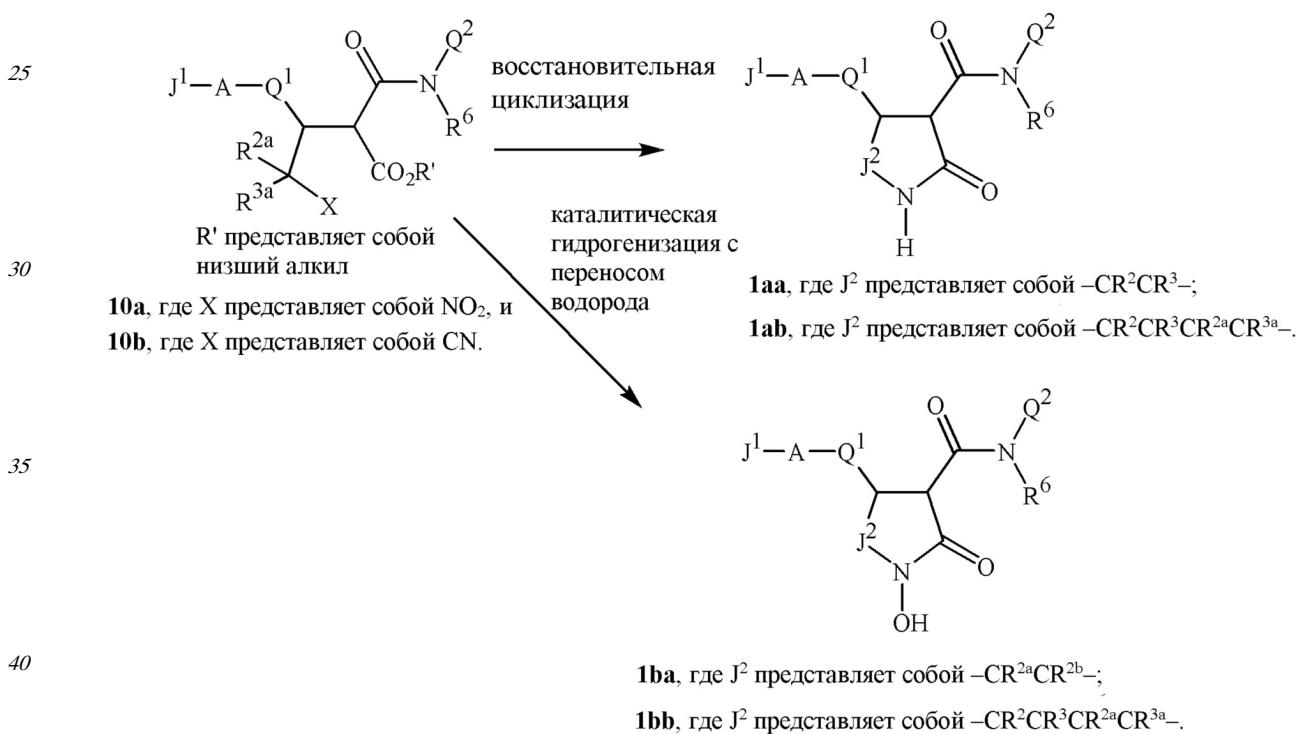
Соединения формул **5a'** и **5a''** можно получить стереоселективно путем проведения реакции нитроалканов формулы **8a** с малонатами формулы **9** в присутствии хирального катализатора и необязательно в присутствии подходящего основания, как показано на схеме 7А. Подходящие катализаторы включают без ограничения Ni(II) с вицинальными диаминовыми лигандами, такими как Ni(II) бис[(*R,R*)-*N,N'*-дibenзилциклогексан-1,2-диамин]дибромид, Ni(II) бис[(*S,S*)-*N,N'*-дibenзилциклогексан-1,2-диамин]дибромид или бромид никеля(II) с диаминами хирального 1,1'-би(тетрагидроизохинолин) типа. Подходящие для данной реакции органические основания включают без ограничения пиперидин, морфолин, триэтиламин, 4-метилморфолин или *N,N*-дизопропилэтанамин. Данное преобразование можно осуществлять в чистом виде или в растворителях, таких как тетрагидрофуран, толуол или дихлорметан. Как правило, реакцию проводят в диапазоне от -78°C до 80°C с использованием 0-1 эквивалента катализатора и необязательно 0-1 эквивалента основания. Условия для осуществления данного преобразования были изложены в *J. Am. Chem. Soc.* 2005, 9958-9959, или в *Eur. J. Org. Chem.* 2011, 5441-5446 для условий. Нитроалканы формулы **8a** можно легко получить из альдегидов и нитрометана с помощью способов, известных специалистам в данной области техники.

Схема 7А



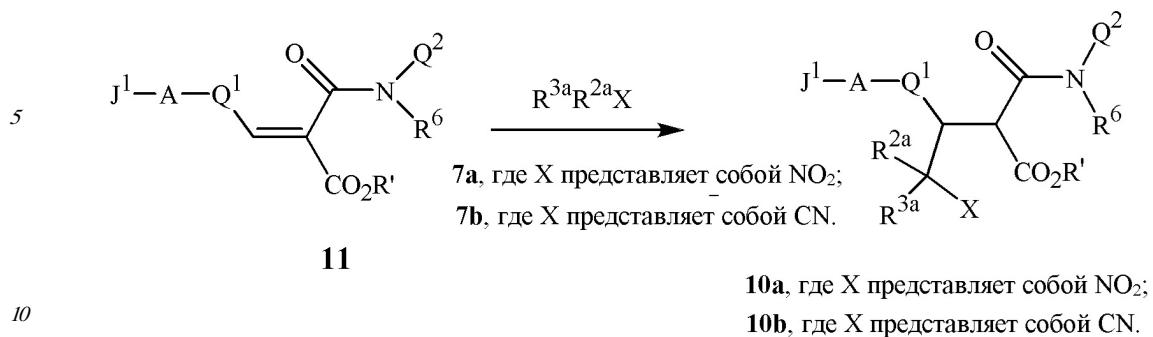
Как показано на схеме 8, соединения формулы 1aa и 1ab также можно получить путем восстановительной циклизации соединений формулы 10a и 10b аналогично способу согласно схеме 3. Как также показано на схеме 8, соединения формулы 1ba и 1bb (т. е. 25 формулы 1, где  $\text{R}^1$  представляет собой  $\text{OH}$ ,  $\text{R}^4$  и  $\text{R}^5$  представляют собой  $\text{H}$ , а  $\text{Y}^1$  и  $\text{Y}^2$  представляют собой  $\text{O}$ ) можно получить из соединений формулы 10b путем катализической гидрогенизации с переносом водорода с формиатом аммония в присутствии палладиевого катализатора на углеродном носителе и последующей *in situ* циклизации промежуточного гидроксиламина. См. *J. Med. Chem.* 1993, 36, 1041-1047 для условий катализической гидрогенизации/циклизации с переносом водорода с целью получения *N*-гидроксипирролидинонов.

Схема 8



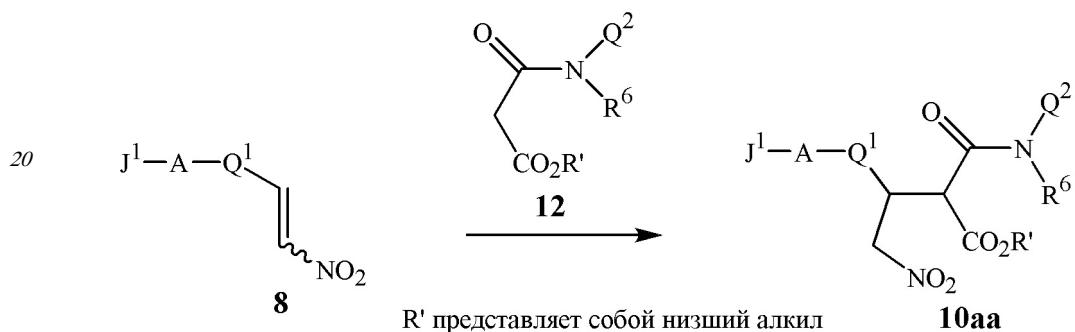
Как показано на схеме 9, соединения формулы 10a и 10b можно получить путем проведения реакции соединений формулы 11 с соединением формулы 7a или с 45 соединением формулы 7b в растворителе, в присутствии основания, аналогично способу, описанному на схеме 4.

Схема 9



Как показано на схеме 10, соединения формулы 10aa (т. е. формулы 10a, где  $\text{R}^{2a}$  и  $\text{R}^{3a}$  представляют собой  $\text{H}$ ) можно получить, аналогично способу согласно схеме 5, путем проведения реакции нитроалкенов формулы 8 с малонатами формулы 12.

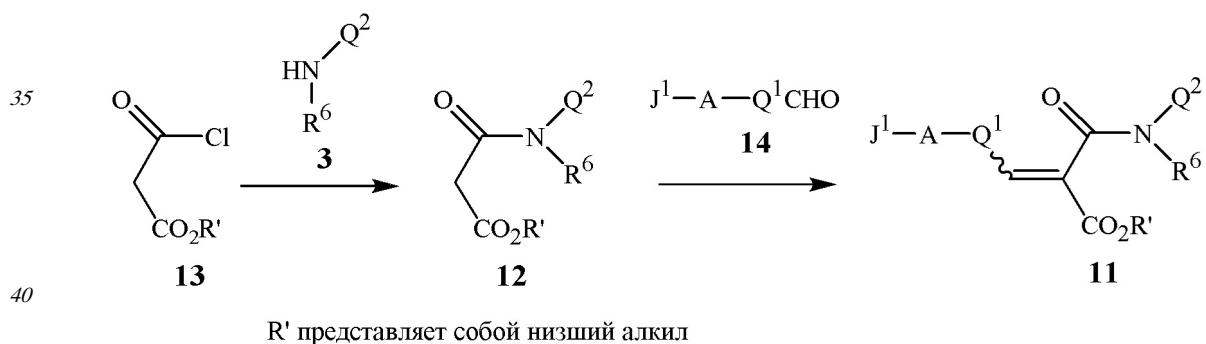
15 Схема 10



25 Как показано на схеме 11, соединения формулы 11 можно получить путем проведения реакции амида малоновой кислоты формулы 12 с альдегидами формулы 14 с помощью способов, известных специалистам в данной области техники. Как также показано на схеме 11, амиды малоновой кислоты формулы 12 можно легко получить из

30 малонилхлоридов низшего алкила формулы 13, таких как метилмалонилхлорид и амины формулы 3, с помощью способов, известных специалистам в данной области техники.

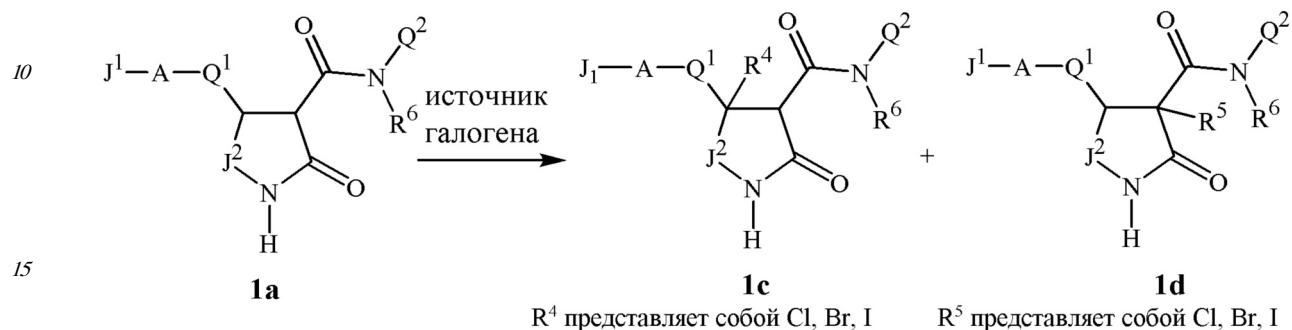
Схема 11



Как показано на схеме 12, смеси соединений формулы 1c (т. е. формулы 1, где  $\text{R}^1$  и  $\text{R}^5$  представляют собой  $\text{H}$ ,  $\text{R}^4$  представляет собой галоген, а  $\text{Y}^1$  и  $\text{Y}^2$  представляют собой  $\text{O}$ ) и формулы 1d (т. е. формулы 1, где  $\text{R}^1$  и  $\text{R}^4$  представляют собой  $\text{H}$ ,  $\text{R}^5$  представляет собой галоген, а  $\text{Y}^1$  и  $\text{Y}^2$  представляют собой  $\text{O}$ ) можно получить путем проведения реакции соединений формулы 1a с источником галогена в растворителе, в присутствии или отсутствие инициатора. Разделения региоизомеров, полученных в данной реакции,

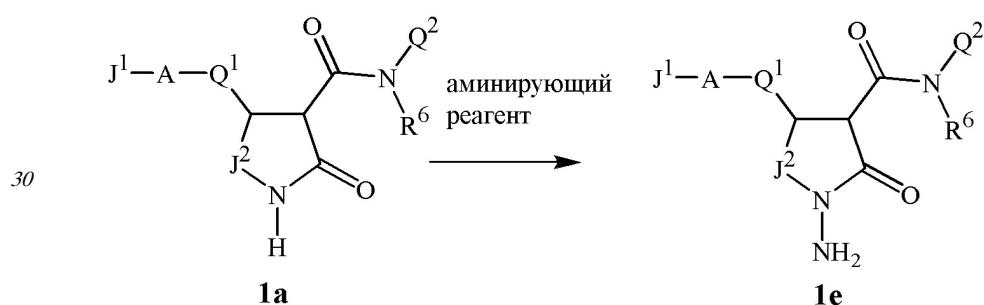
можно достичь с помощью стандартных способов, таких как хроматография или фракционная кристаллизация. Подходящие источники галогена для данной реакции включают бром, хлор, *N*-хлорсукининимид, *N*-бромсукининимид и *N*-йодсукининимид. Подходящие инициаторы для данной реакции включают 2,2'-азобisisизобутиронитрил (AIBN) и пероксид бензоила. Как правило, реакцию проводят в растворителях, таких как дихлорметан в диапазоне от 0°C до температуры кипения растворителя.

### Схема 12



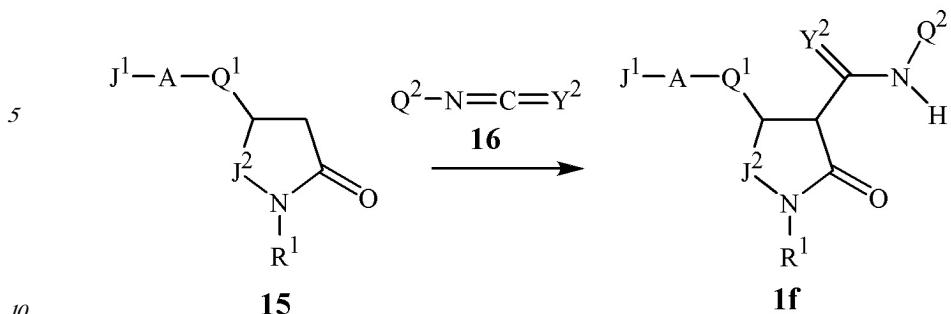
As shown in Scheme 13, compounds of Formula 1e (i.e. Formula 1 wherein R<sup>1</sup> is NH<sub>2</sub>, R<sup>4</sup> and R<sup>5</sup> represent H, and Y<sup>1</sup> and Y<sup>2</sup> represent O) can be obtained<sup>20</sup> by the reaction of the formula 1a with an amine reagent, such as O-(diphenylphosphoryl)hydroxylamine and hydroxylaminoo-SO<sub>3</sub>H. For procedures, conditions and reagents see *Bioorg. & Med. Chem. Lett.* 2009, 19, 5924-5926, and *J. of Org. Chem.* 2002, 67, 6236-6239.

### Схема 13



35 Как показано на схеме 14, соединения формулы 1f (т. е. формулы 1, где  $R^4$ ,  $R^5$  и  $R^6$  представляют собой H, а  $Y^1$  и  $Y^2$  представляют собой O) можно получить путем проведения реакции соединений формулы 15 с изоцианатами (т. е. формулы 16, где  $Y^2$  представляет собой O) или изотиоцианатами (т. е. формулы 16, где  $Y^2$  представляет собой S) в присутствии основания. Примеры основания, которое можно использовать 40 для способа по настоящему изобретению, включают такие, перечисленные для способа согласно схеме 4. Температуру реакции можно выбрать из диапазона от  $-78^{\circ}\text{C}$  до температуры кипения используемого инертного растворителя. Как правило, реакцию проводят при значениях температуры в диапазоне от  $-78^{\circ}\text{C}$  до  $100^{\circ}\text{C}$  в растворителях, таких как толуол.

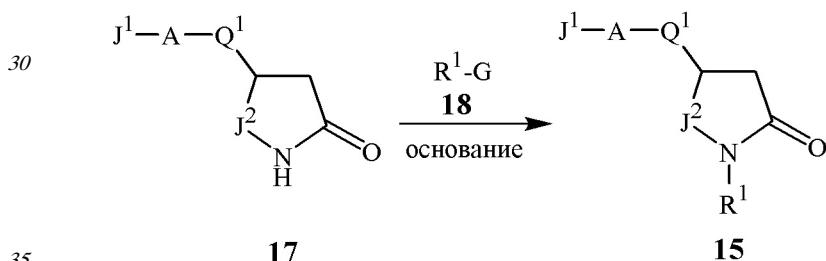
Схема 14



Как показано на схеме 15, соединения формулы 15 можно получить путем проведения реакции соединений формулы 17 с соответствующими электрофилами формулы 18 в присутствии основания. В формуле 18 G обозначает уходящую группу, т. е. нуклеофуг.

В зависимости от выбора  $R^1$  подходящие для проведения реакции электрофилы могут включать алкилгалогениды, такие как хлориды, бромиды и иодиды, алкилсульфонаты, кислотные ангидриды, такие как *трет*-бутоксикарбонилангидрид и уксусный ангидрид, и галогеналкилсиланы, такие как хлортриметилсилан. Подходящие для проведения реакции основания включают неорганические основания, такие как гидроксиды, алкооксиды, карбонаты и фосфаты щелочного или щелочноземельного металла (например, лития, натрия, калия и цезия), и органические основания, такие как триэтиламин, *N,N*-дизопропилэтиламин и 1,8-диазабицикло[5.4.0]ундец-7-ен. Широкий спектр растворителей, являющихся подходящими для проведения реакции, включают, например, без ограничения тетрагидрофуран, дихлорметан, *N,N*-диметилформамид, *N,N*-диметилацетамид, *N*-метилпирролидинон, ацетонитрил,  $C_2$ - $C_6$ спирты и ацетон, а также смеси этих растворителей. Данную реакцию проводят при значениях температуры в диапазоне от -20 до 200°C и, как правило, от 0 до 50°C.

Схема 15

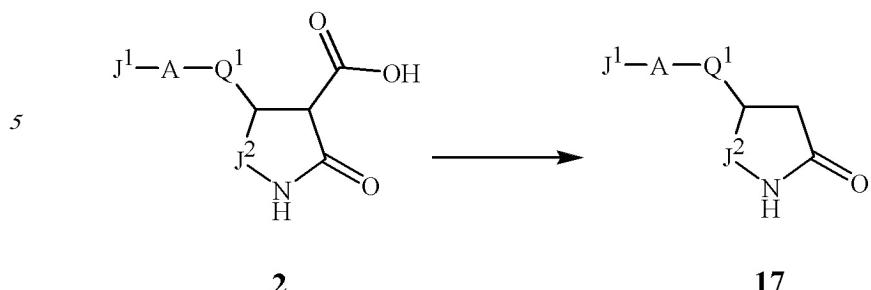


Как показано на схеме 16, соединения формулы 17 можно получить путем декарбоксилирования кислот формулы 2 с помощью способов, хорошо известных специалистам в данной области техники. Декарбоксилирование проводят путем нагревания соединений формулы 2 в растворителе, как правило, в присутствии кислоты.

Подходящие кислоты для реакции включают без ограничения *p*-толуолсульфокислоту. Широкий спектр сорасторителей, являющихся подходящими для реакции, включает без ограничения толуол, изопропанолацетат и изобутилметилкетон. Реакцию проводят при значениях температуры в диапазоне от -20°C до температуры кипения растворителя и, как правило, от 0 до 150°C.

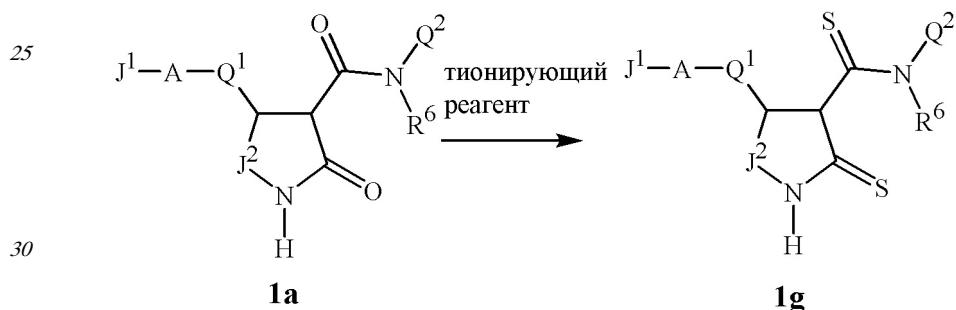
45

### Схема 16



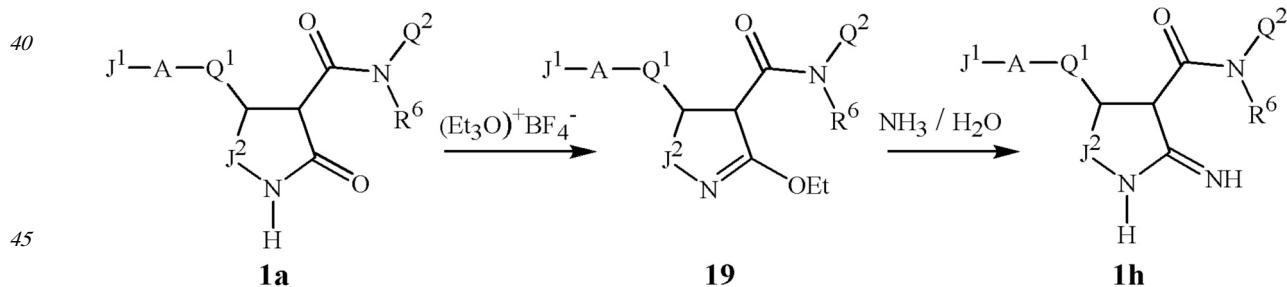
Как показано на схеме 17, соединения формулы 1g (т. е. формулы 1, где R<sup>1</sup> представляет собой H, R<sup>4</sup> и R<sup>5</sup> представляют собой H, а Y<sup>1</sup> и Y<sup>2</sup> представляют собой S) можно получить путем проведения реакции соединений формулы 1a по меньшей мере с двумя эквивалентами тионирирующего реагента, такого как реагент Лавессона, тетрафосфорный декасульфид или дифосфорный пентасульфид в растворителе, таком как тетрагидрофуран или толуол. Как правило, реакцию проводят при значениях температуры в диапазоне от 0 до 115°C. Специалист в данной области техники понимает, что использование менее двух эквивалентов тионирирующего реагента может обеспечить смеси, содержащие продукты формулы 1, где Y<sup>1</sup> представляет собой O и Y<sup>2</sup> представляет собой S, или Y<sup>1</sup> представляет собой S и Y<sup>2</sup> представляет собой O, которые можно разделить традиционными способами, такими как хроматография и кристаллизация.

Схема 17



Как показано на схеме 18, соединения формулы 1h (т. е. формулы 1, где  $R^1, R^4, R^5$  представляют собой H,  $Y^2$  представляет собой O, и  $Y^1$  представляет собой NH) можно 35 получить путем алкилирования соединений формулы 1a триэтилоксония тетрафторборатом (реагентом Meerweina) с последующей обработкой полученного в результате иминоэфира формулы 19 водным аммиаком.

### Схема 18



Специалисту в данной области техники будет понятно, что различные функциональные группы можно превращать в другие группы с получением различных

соединений формулы 1. В качестве надежного источника, в котором просто и ясно проиллюстрировано взаимное превращение функциональных групп, см. Larock, R. C., *Comprehensive Organic Transformations: A Guide to Functional Group Preparations*, 2nd Ed., Wiley-VCH, New York, 1999. Например, промежуточные соединения для получения

5 соединений формулы 1 могут содержать ароматические нитрогруппы, которые можно восстанавливать до аминогрупп и затем превращать посредством реакций, хорошо известных из уровня техники, таких как реакция Зандмейера, в различные галогениды с получением соединений формулы 1. Также во многих случаях вышеупомянутые реакции можно осуществлять в альтернативном порядке.

10 Следует понимать, что некоторые вышеописанные реагенты и условия реакции для получения соединений формулы 1 могут быть несовместимы с определенными функциональными группами промежуточных соединений. В таких случаях включение в синтез последовательностей для защиты/снятия защиты или взаимопревращений функциональных групп будет способствовать получению необходимых продуктов.

15 Применение и выбор защитных групп будут очевидны для специалиста в области химического синтеза (см., например, Greene, T. W.; Wuts, P. G. M. *Protective Groups in Organic Synthesis*, 2nd ed.; Wiley: New York, 1991). Специалисту в данной области техники будет понятно, что, в некоторых случаях, после введения данного реагента, как показано на любой отдельной схеме, может быть необходимо осуществление дополнительных 20 общепринятых стадий синтеза, не описанных подробно, для выполнения синтеза соединений формулы 1. Специалисту в данной области техники также будет понятно, что может быть необходимо осуществление комбинации стадий, проиллюстрированных на вышеуказанных схемах в порядке, отличном от предполагаемого конкретным порядком, представленным для получения соединений формулы 1.

25 Также специалисту в данной области техники будет понятно, что соединения формулы 1 и промежуточные соединения, описанные в данном документе, можно подвергнуть различным электрофильным, нуклеофильным, радикальным, металлоорганическим реакциям, реакциям окисления и восстановления с целью добавления заместителей или модификации существующих заместителей.

30 Без дополнительного уточнения предполагается, что специалист в данной области техники с применением предшествующего описания может использовать настоящее изобретение в наиболее полном его объеме. Следующие неограничивающие примеры иллюстрируют настоящее изобретение. Стадии в следующих примерах иллюстрируют процедуру для каждой стадии в суммарном синтетическом преобразовании, и исходное 35 вещество для каждой стадии не обязательно должно быть получено посредством конкретного подготовительного этапа, процедура которого описывается в других примерах или стадиях. Значения процентного содержания приведены по весу, за исключением смесей хроматографических растворителей или случаев, когда указано иное. Доли и значения процентного содержания для смесей хроматографических

40 растворителей приведены по объему, если не указано иное.  $^1\text{H}$  ЯМР спектры представлены в ppm в сторону слабого поля от тетраметилсилина в  $\text{CDCl}_3$  при 500 МГц, если не указано иное; "s" означает синглет, "d" означает дуплет, "t" означает триплет, "q" означает квартет, "m" означает мультиплет, "d" означает дуплет. Масс-спектры (MS) представлены в виде молекулярной массы исходного иона с наиболее высоким относительным содержанием изотопа ( $M+1$ ), образованного при добавлении  $\text{H}^+$  (молекулярная масса 1) к молекуле, или ( $M-1$ ), образованного при потере  $\text{H}^+$  (молекулярная масса 1) молекулой, наблюдавшегося при применении жидкостной хроматографии совместно с масс-спектрометрией (LCMS) с применением химической

ионизации при атмосферном давлении (AP+), где "amu" означает атомные единицы массы.

### ПРИМЕР СИНТЕЗА 1

Получение N-(2-фторфенил)-2-оксо-4-[3-(2-пиридинилокси)фенил]-3-

5 пирролидинкарбоксамида (соединения 34)

Стадия А. Получение 3-(2-пиридинилокси)бензальдегида

2-Фторпиридин (20,0 г, 164 ммоль) растворяли в 150 мл *N,N*-диметилформамида, а затем обрабатывали трет-бутоксидом калия (19,9 г, 177 ммоль). Реакционная смесь выделяла тепло до 57°C, а затем обеспечивали ее охлаждение до температуры 10 окружающей среды в течение 1 часа. Добавляли 3-гидроксибензальдегид (13,9 мл, 162 ммоль) и смесь нагревали до 120°C в течение ночи. Обеспечивали охлаждение реакционной смеси до температуры окружающей среды, а затем разделяли между этилацетатом и 1 н. водным раствором HCl. Органический слой промывали солевым раствором, высушивали над сульфатом магния и концентрировали с получением 15 коричневого остатка, который затем растирали с диэтиловым эфиром. Полученное в результате твердое вещество выделяли посредством фильтрации и высушивали на воздухе с получением 14,9 г указанного в заголовке соединения.

<sup>1</sup>H ЯМР (DMSO-*d*<sub>6</sub>) δ 10,01 (s, 1H), 8,17 (m, 1H), 7,91 (m, 1H), 7,78 (m, 1H), 7,66 (t, 1H), 7,63 (s, 1H), 7,50 (m, 1H), 7,16-7,20 (m, 1H), 7,13 (d, 1H).

20 Стадия В. Получение 2-[3-[(1E)-2-нитроэтенил]фенокси]пиридина

К раствору 3-(пирид-2-илокси)бензальдегида (также известного как 3-(2-пиридинилокси)бензальдегид, т. е. продукт со стадии А, 20,1 г, 101 ммоль) в 250 мл 1-хлорбутана добавляли нитрометан (6,54 мл, 121 ммоль), пиперидин (0,988 мл, 10,0 ммоль) и ледяную уксусную кислоту (0,577 мл, 10,0 ммоль). Затем смесь нагревали с обратным холодильником в течение 48 часов с азеотропным удалением воды. Обеспечивали охлаждение реакционной смеси до температуры окружающей среды. Реакционную смесь концентрировали на диатомитовом вспомогательном фильтрующем материале Celite®, а затем очищали с помощью жидкостной хроматографии среднего давления (0% - 15% этилацетат в смеси гексанов в качестве элюента) с получением 19,2 г указанного в заголовке соединения в виде желтого масла.

<sup>1</sup>H ЯМР δ 8,19 (m, 1H), 7,99 (d, 1H), 7,74 (m, 1H), 7,56 (m, 1H), 7,48 (t, 1H) 7,36 (m, 2H), 7,29 (m, 1H), 7,05 (m, 1H), 6,99 (d, 1H).

Стадия С. Получение 1,3-диэтил-2-[2-нитро-1-[3-(2-пиридинилокси)фенил]этил]

35 пропандиоата

2-[3-[(1E)-2-Нитроэтенил]фенокси]пиридин (т. е. продукт со стадии В, 19,4 г, 105 ммоль), диэтилмалонат (14,5 мл, 95,2 ммоль) и Ni(II) бис[*N,N'*-дibenзилциклогексан-1,2-диамин]дибромид (0,955 г, 1,19 ммоль) нагревали с обратным холодильником в дихлорметане в течение 48 часов. Реакционную смесь затем охлаждали до температуры окружающей среды, концентрировали на диатомитовом вспомогательном фильтрующем материале Celite® при пониженном давлении, а затем очищали с помощью жидкостной хроматографии среднего давления с элюированием 0% - 50% этилацетатом в смеси гексанов с получением 30,2 г указанного в заголовке соединения в виде бесцветного масла.

45 <sup>1</sup>H ЯМР (500 МГц, DMSO-*d*<sub>6</sub>) δ 8,15 (m, 1H) 7,86 (m, 1H) 7,34 (m, 1H) 7,15 (m, 3H) 7,03 (m, 1H) 6,96 (m, 1H) 4,99 (m, 2H) 4,17 (m, 2H) 4,09 (m, 1H) 4,03 (m, 1H) 3,89 (m, 2H) 1,18 (t, 3H) 0,92 (t, 3H).

Стадия D. Получение этил-2-оксо-4-[3-(2-пиридинилокси)фенил]-3-

пирролидинкарбоксилата

1,3-Диэтил-2-[2-нитро-1-[3-(2-пиридинилокси)фенил]этил]пропандиоат (т. е. продукт со стадии С, 30,1 г, 74,9 ммоль) растворяли в 500 мл этанола при температуре окружающей среды. Добавляли  $\text{NiCl}_2 \cdot 6\text{H}_2\text{O}$  (17,8 г, 74,9 ммоль) и смесь перемешивали до полного растворения. Реакционную массу затем охлаждали до 0°C в ледяной бане, а затем медленно добавляли борогидрид натрия (8,50 г, 225 ммоль) так, чтобы температура не превышала 5°C. По завершении добавления ледяную баню удаляли, а реакционную массу перемешивали при температуре окружающей среды в течение ночи. Затем этанол удаляли при пониженном давлении, добавляли 500 мл этилацетата и 1,25 л насыщенного раствора хлорида аммония и реакционную смесь перемешивали до следующего дня. Органический слой отделяли от водного слоя, а затем концентрировали на силикагеле при пониженном давлении, а затем очищали с помощью MPLC с элюированием 0% - 100% этилацетатом в смеси гексанов с получением 7,5 г указанного в заголовке соединения в виде желтого масла.

<sup>15</sup>  $^1\text{H}$  ЯМР  $\delta$  8,19 (m, 1H), 7,71 (m, 1H), 7,37 (m, 1H), 7,05 (m, 4H), 6,93 (m, 1H), 6,37 (bs, 1H), 4,24 (m, 2H), 4,13 (m, 1H), 3,82 (m, 1H), 3,55 (d, 1H), 3,45 (m, 1H), 1,27 (m, 3H).

Стадия Е. Получение N-(2-фторфенил)-2-оксо-4-[3-(2-пиридинилокси)фенил]-3-пирролидинкарбоксамида

<sup>20</sup> Этил-2-оксо-4-[3-(2-пиридинилокси)фенил]-3-пирролидинкарбоксилат (т. е. продукт со стадии D, 0,40 г, 1,2 ммоль) добавляли к 2-фторанилину (2,0 мл, 6,8 ммоль) и нагревали в реакторе СЕМ Microwave в течение 45 минут при 190°C. Реакционную смесь охлаждали до температуры окружающей среды, а затем разбавляли 200 мл дихлорметана. Данный раствор концентрировали при пониженном давлении на Celite®, а затем очищали с помощью MPLC (0% - 100% этилацетат в смеси гексанов в качестве элюента) с получением 0,23 г указанного в заголовке соединения, продукта согласно настоящему изобретению, в виде твердого вещества.

<sup>25</sup>  $^1\text{H}$  ЯМР  $\delta$  10,04 (s, 1H), 8,13 (m, 2H), 8,00 (m, 1H), 7,83 (m, 1H), 7,38 (m, 1H), 7,12 (m, 8H), 4,00 (m, 2H), 3,70 (t, 1H), 3,25 (t, 1H).

## <sup>30</sup> ПРИМЕР СИНТЕЗА 2

Получение N-(2,3-дифторфенил)-2-оксо-4-[3-[3-(трифторметил)-1Н-пиразол-1-ил]метил]фенил]-3-пирролидинкарбоксамида (соединения 25)

Стадия А. Получение 3-[3-(трифторметил)-1Н-пиразол-1-ил]метил]бензальдегида

<sup>35</sup> 3-(Трифторметил)пиразол (0,82 г, 6,0 ммоль), 3-(бромметил)бензальдегид (1,0 г, 5,0 ммоль) и карбонат калия (2,1 г, 15 ммоль) объединяли в 50 мл *N,N*-диметилформамида и нагревали до 80°C в течение 18 часов. Реакционную смесь охлаждали до температуры окружающей среды, а затем разделяли между этилацетатом и солевым раствором.

Органический слой высушивали над сульфатом магния и концентрировали при пониженном давлении с получением зеленого масла, которое абсорбировали на силикагеле, а затем очищали с помощью MPLC с элюированием 0% - 100% этилацетатом в смеси гексанов с получением 0,82 г указанного в заголовке соединения.

<sup>40</sup>  $^1\text{H}$  ЯМР  $\delta$  10,01 (s, 1H), 7,86 (m, 1H), 7,76 (s, 1H), 7,56 (m, 1H), 7,50 (m, 1H), 7,45 (m, 1H), 6,58 (d, 1H), 5,44 (s, 2H).

Стадия В. Получение 1-[3-[(1E)-2-нитроэтил]фенил]метил]-3-(трифторметил)-1Н-пиразола (т. е. 1-[3-[(1E)-2-нитроэтил]фенил]метил]-3-(трифторметил)-1Н-пиразола)

<sup>45</sup> К раствору 3-[3-(трифторметил)-1Н-пиразол-1-ил]метил]бензальдегида (т. е. продукта со стадии А, 16,5 г, 65 ммоль) в 100 мл 1-хлорбутана добавляли нитрометан (4,2 мл, 78 ммоль), пиперидин (0,64 мл, 6,5 ммоль) и ледяную уксусную кислоту (0,37 мл, 6,5 ммоль).

Затем смесь нагревали с обратным холодильником в течение 48 часов с азеотропным удалением воды. Обеспечивали охлаждение реакционной смеси до температуры окружающей среды. Реакционную смесь концентрировали на диатомитовом вспомогательном фильтрующем материале Celite®, а затем очищали с помощью MPLC с элюированием 0% - 15% этилацетатом в смеси гексанов с получением 11,2 г указанного в заголовке соединения в виде желтого твердого вещества.

<sup>1</sup>Н ЯМР (500 МГц, ХЛОРОФОРМ-*d*) δ 7,97 (d, 1H), 7,55 (m, 2H), 7,46 (m, 2H), 7,38 (m, 2H), 6,58 (d, 1H), 5,40 (s, 2H).

Стадия С. Получение 1,3-диэтил 2-[2-нитро-1-[3-[[3-(трифторметил)-1Н-пиразол-1-ил]метил]фенил]этил]пропандиоата

1-[[3-[(1*E*)-2-Нитроэтил]фенил]метил]-3-(трифторметил)-1Н-пиразол (т. е. 1-[[3-[(1*E*)-2-нитроэтил]фенил]метил]-3-(трифторметил)-1Н-пиразол, т. е. продукт со стадии В, 11 г, 38 ммоль), диэтилмалонат (6,9 мл, 45 ммоль) и бис[*N,N'*-дibenзилциклогексан-1,2-диамин]дибромид Ni(II) (0,46 г, 0,57 ммоль) перемешивали в дихлорметане в течение примерно 16 часов. Затем реакционную смесь охлаждали до температуры окружающей среды, концентрировали на диатомитовом вспомогательном фильтрующем материале Celite® при пониженном давлении, а затем очищали с помощью MPLC с элюированием 0% - 50% этилацетатом в смеси гексанов с получением 11 г указанного в заголовке соединения в виде желтого масла.

<sup>1</sup>Н ЯМР δ 7,34 (m, 2H), 7,23 (d, 1H), 7,15 (m, 2H), 6,54 (d, 1H), 5,32 (m, 2H), 4,88 (m, 2H), 4,21 (m, 3H), 3,98 (q, 2H), 3,78 (d, 1H), 1,25 (t, 3H), 1,01 (t, 3H).

Стадия D. Получение этил-2-оксо-4-[3-[[3-(трифторметил)-1Н-пиразол-1-ил]метил]фенил]-3-пирролидинкарбоксилата

1,3-Диэтил-2-[2-нитро-1-[3-[[3-(трифторметил)-1Н-пиразол-1-ил]метил]фенил]этил]пропандиоат (т. е. продукт со стадии С, 30,1 г, 74,9 ммоль) растворяли в 500 мл этанола при температуре окружающей среды. Добавляли  $\text{NiCl}_2 \cdot 6\text{H}_2\text{O}$  (17,8 г, 74,9 ммоль) и смесь перемешивали до полного растворения. Реакционную массу затем охлаждали до 0°C в ледяной бане, а затем медленно добавляли борогидрид натрия (8,50 г, 225 ммоль) так, чтобы температура не превышала 5°C. По завершении добавления ледяную баню удаляли, а реакционную массу перемешивали при температуре окружающей среды в течение 3 часов. Добавляли 300 мл этилацетата и 300 мл насыщенного раствора хлорида аммония и реакционную смесь перемешивали, пока органический слой не становился прозрачным, а водный слой голубым. Органический слой отделяли от водного слоя и водный слой снова экстрагировали этилацетатом. Объединенные органические слои промывали хлоридом аммония, высушивали над сульфатом магния, затем концентрировали на силикагеле при пониженном давлении, а затем очищали с помощью MPLC с элюированием 0% - 100% этилацетатом в смеси гексанов с получением 3,5 г указанного в заголовке соединения в виде желтого масла с некоторыми примесями, которое использовали без дополнительной очистки. MS (M-1)=380 amu.

Стадия Е. Получение 2-оксо-4-[3-[[3-(трифторметил)-1Н-пиразол-1-ил]метил]фенил]-3-пирролидинкарбоновой кислоты

Этил-2-оксо-4-[3-[[3-(трифторметил)-1Н-пиразол-1-ил]метил]фенил]-3-пирролидинкарбоксилат (т. е. продукт со стадии D, 3,78 г, 9,1 ммоль) растворяли в 65 мл этанола, а затем в течение 5 минут добавляли 1,4 мл 50% раствора натрия гидроксида. Затем реакционную смесь перемешивали в течение ночи при температуре окружающей среды. Смесь разбавляли водой до растворения белого осадка. Органический слой дважды экстрагировали с помощью 125 мл диэтилового эфира, а затем подкисляли до

рН 2 концентрированной хлористоводородной кислотой. Затем водный слой экстрагировали этилацетатом. Слой этилацетата промывали солевым раствором, высушивали над сульфатом магния и концентрировали при пониженном давлении с получением 1,9 г указанного в заголовке соединения в виде розового стеклообразного вещества.

<sup>5</sup> <sup>1</sup>Н ЯМР (DMSO-*d*<sub>6</sub>) δ 12,74 (bs, 1H), 8,09 (d, 2H), 7,33 (m, 3H), 7,12 (m, 1H), 6,74 (d, 1H), 5,41 (s, 2H), 3,83 (m, 2H), 3,51 (m, 2H).

Стадия F. Получение *N*-(2,3-дифторфенил)-2-оксо-4-[3-[[3-(трифторметил)-1Н-пиразол-1-ил]метил]фенил]-3-пирролидинкарбоксамида

<sup>10</sup> <sup>2</sup>-Оксо-4-[3-[[3-(трифторметил)-1Н-пиразол-1-ил]метил]фенил]-3-пирролидинкарбоновую кислоту (т. е. продукт со стадии E, 0,33 г, 0,92 ммоль), триэтиламин (0,38 мл, 0,28 ммоль) и 2,3-дифторанилин (0,14 г, 1,1 ммоль) растворяли в 25 мл дихлорметана и перемешивали при температуре окружающей среды в течение <sup>15</sup> 15 минут, а затем обрабатывали 50% пропилfosфоновым ангидридом (T3P®) в этилацетате (1,8 мл, 3,1 ммоль) и перемешивали в течение ночи. Реакционную смесь концентрировали при пониженном давлении, а затем очищали с помощью MPLC с элюированием 0% - 100% этилацетатом в смеси гексанов с получением 0,092 г указанного в заголовке соединения, продукта согласно настоящему изобретению, в виде твердого вещества.

<sup>20</sup> <sup>1</sup>Н ЯМР (DMSO-*d*<sub>6</sub>) δ 10,22 (s, 1H), 8,21 (s, 1H), 8,07 (d, 1H), 7,77 (m, 1H), 7,34 (m, 3H), 7,16 (m, 3H), 6,71 (d, 1H), 5,42 (s, 2H), 4,02 (m, 1H), 3,92 (m, 1H), 3,67 (t, 1H), 3,26 (t, 1H).

### ПРИМЕР СИНТЕЗА 3

Получение *N*-(2-фторфенил)-4-[3-[(метоксиимино)метил]фенил]-1-метил-2-оксо-3-пирролидинкарбоксамида (соединения 53)

Стадия A. Получение 1,3-диэтил-2-[(3-йодфенил)метилен]пропандиоата

К раствору 3-йодбензальдегида (10 г, 43 ммоль) в бензоле (100 мл) добавляли диэтилмалонат (8,3 г, 52 ммоль) и пиперидин (0,73 г, 8,6 ммоль) при 5°C. Реакционную смесь нагревали до температуры флегмы растворителя с помощью прибор Дина-Старка для удаления воды в течение 24 часов. Реакционную смесь выпаривали с получением неочищенного продукта, который очищали с помощью колоночной хроматографии на силикагеле с элюированием 5% - 20% градиентом этилацетата в петролейном эфире с получением указанного в заголовке продукта (17 г).

<sup>35</sup> <sup>1</sup>Н ЯМР (400 МГц) δ 7,80 (s, 1H), 7,60 (s, 1H), 7,40 (m, 1H), 7,30 (s, 1H), 7,10 (m, 1H), 4,35 (m, 4H), 1,77 (m, 6 H).

Стадия B. Получение 1,3-диэтил-2-[1-(3-йодфенил)-2-нитроэтил]пропандиоата

К раствору 1,3-диэтил-2-[(3-йодфенил)метилен]пропандиоата (т. е. соединения, полученного на стадии A, 17 г, 45 ммоль) в этаноле (170 мл) добавляли нитрометан (28 г, 450 ммоль) и 20% метоксид натрия в метаноле (0,25 г, 4,55 ммоль) при 5°C и <sup>40</sup> реакционную смесь перемешивали при температуре окружающей среды в течение 16 часов. Реакционную смесь выпаривали с получением указанного в заголовке неочищенного соединения (16 г), которое использовали без дополнительной очистки.

<sup>45</sup> <sup>1</sup>Н ЯМР (400 МГц) δ 7,60 (t, 2H), 7,20 (d, 1H), 7,10 (t, 1H), 4,95 (m, 2H), 4,20 (m, 3H), 4,00 (m, 2H), 3,75 (d, 1H), 1,20 (m, 6 H).

Стадия C. Получение этил-4-(3-йодфенил)-2-оксо-3-пирролидинкарбоксилата

К раствору 1,3-диэтил-2-[1-(3-йодфенил)-2-нитроэтил]пропандиоата (т. е. соединения, полученного на стадии B, 16 г, 36 ммоль) в этаноле (150 мл)/воде (32 мл) добавляли

порошок железа (10 г, 180 ммоль), хлорид аммония (1,0 г, 18 ммоль) и реакционную смесь нагревали при 110°C в течение 24 часов. Реакционную смесь фильтровали через диатомитовый вспомогательный фильтрующий материал Celite® и фильтрат концентрировали. К неочищенному остатку добавляли воду и смесь экстрагировали

5 (3 ×) этилацетатом. Объединенные органические слои промывали водой, солевым раствором, а затем высушивали над сульфатом натрия. Растворитель выпаривали с получением указанного в заголовке соединения в виде неочищенного промежуточного соединения (15 г). 500 мг образца неочищенного промежуточного соединения очищали с помощью препаративной тонкослойной хроматографии с получением 250 мг

10 указанного в заголовке соединения.

<sup>1</sup>H ЯМР (400 МГц) δ 7,60 (m, 2H), 7,20 (m, 1H), 7,10 (m, 1H), 6,10 (s, 1H), 4,20 (m, 2H), 4,00 (m, 1H), 3,63 (t, 1H), 3,40 (m, 1H), 3,30 (m, 1H), 1,23 (m, 3H).

Стадия D. Получение 4-(3-йодфенил)-2-оксо-3-пирролидинкарбоновой кислоты

15 К раствору этил-4-(3-йодфенил)-2-оксо-3-пирролидинкарбоксилата (т. е. соединения, полученного на стадии С, 9,0 г, 25 ммоль) в тетрагидрофуране (50 мл) и воде (10 мл) добавляли моногидрат гидроксида лития (1,6 г, 38 ммоль) при 0°C и реакционную смесь перемешивали при температуре окружающей среды в течение 4 часов. Реакционную смесь затем выпаривали и твердое вещество смешивали с водой. Водную смесь экстрагировали этилацетатом и органический слой удаляли. Водный слой подкисляли 20 концентрированной хлористоводородной кислотой при 0°C. Полученное в результате твердое вещество собирали посредством фильтрации и высушивали в вакууме с получением указанного в заголовке соединения (5 г) в виде грязно-белого твердого вещества.

25 <sup>1</sup>H ЯМР (400 МГц) δ 12,89 (s, 1H), 8,10 (s, 1H), 7,65 (d, 1H), 7,53 (d, 1H), 7,39 (d, 1H), 7,18 (t, 1H), 3,81 (m, 1H), 3,50 (m, 2H), 3,20 (m, 1H).

Стадия Е. Получение 4-(3-йодфенил)-1-метил-2-оксо-3-пирролидинкарбоновой кислоты

30 Трет-бутоксид калия (37 мл, 1 М раствор в тетрагидрофуране) охлаждали до 0°C. К данному раствору медленно добавляли 4-(3-йодфенил)-2-оксо-3-пирролидинкарбоновую кислоту (т. е. соединение, полученное на стадии D, 5,0 г, 15 ммоль) в тетрагидрофуране и перемешивали в течение 10 минут. Добавляли метилбромид (25% в ацетонитриле, 14 мл, 38 ммоль) и реакционную смесь перемешивали в течение 4 часов. Реакционную смесь разбавляли ацетонитрилом и подкисляли 1 н. водной хлористоводородной 35 кислотой при 0°C. Реакционную смесь затем экстрагировали (3 ×) этилацетатом, объединенные органические вещества промывали солевым раствором и высушивали над сульфатом натрия с получением неочищенного остатка, который промывали диэтиловым эфиром с получением указанного в заголовке соединения (2,3 г) в виде грязно-белого твердого вещества.

40 <sup>1</sup>H ЯМР (400 МГц) δ 12,77 (s, 1H), 7,74 (s, 1H), 7,65 (d, 1H), 7,38 (d, 1H), 7,15 (t, 1H), 3,81 (m, 2H), 3,62 (m, 1H), 3,45 (d, 1H), 2,80 (s, 3H).

Стадия F. Получение N-(2-фторфенил)-4-(3-йодфенил)-1-метил-2-оксо-3-пирролидинкарбоксамида

45 К раствору 4-(3-йодфенил)-1-метил-2-оксо-3-пирролидинкарбоновой кислоты (т. е. соединения, полученного на стадии Е, 0,5 г, 1,4 ммоль) и 2-фторанилина (0,15 мл, 1,6 ммоль) в N,N-диметилформамиде (10 мл) добавляли триэтиламин (0,6 мл, 4,3 ммоль) и перемешивали при температуре окружающей среды в течение 10 минут. Затем добавляли раствор пропилфосфонового ангидрида (T3P®) (50% в этилацетате, 1,7 мл, 2,89 ммоль)

при 0°C и перемешивали в течение 2 часов. Реакционную смесь затем разбавляли водой и экстрагировали этилацетатом. Объединенные органические слои промывали водой и солевым раствором, а затем высушивали над сульфатом натрия. Растворитель выпаривали с получением неочищенного остатка, который промывали диэтиловым эфиром/пентаном с получением указанного в заголовке соединения (0,4 г) в виде грязно-белого твердого вещества.

<sup>5</sup> <sup>1</sup>Н ЯМР (400 МГц) δ 10,08 (s, 1H), 8,00 (m, 1H), 7,75 (s, 1H), 7,63 (d, 1H), 7,37 (d, 1H), 7,35 (m, 1H), 7,15 (m, 3H), 3,95 (m, 2H), 3,77 (m, 1H), 3,41 (m, 1H), 2,80 (s, 3H).

<sup>10</sup> Стадия G. Получение *N*-(2-фторфенил)-4-(3-формилфенил)-1-метил-2-оксо-3-пирролидинкарбоксамида

<sup>15</sup> Раствор *N*-(2-фторфенил)-4-(3-йодфенил)-1-метил-2-оксо-3-пирролидинкарбоксамида (т. е. соединения, полученного на стадии F, 0,5 г, 1,1 ммоль) и тетракис(трифенилфосфин)палладия(0) (0,086 г, 0,075 ммоль) в *N,N*-диметилформамиде (5 мл) в сосуде высокого давления перемешивали в атмосфере газообразногоmonoоксида углерода (100 фунтов/кв. дюйм) в течение 30 минут. Давление понижали, добавляли трибутилсилан (0,83 мл) и реакционную смесь перемешивали в атмосфере газообразного monoоксида углерода (100 фунтов/кв. дюйм) при температуре окружающей среды в течение 48 часов.

<sup>20</sup> Реакционную смесь затем разбавляли водой и экстрагировали этилацетатом.

<sup>25</sup> Объединенные органические слои промывали водой и солевым раствором и высушивали над сульфатом натрия. Растворитель выпаривали с получением неочищенного остатка, который очищали с помощью колоночной хроматографии на силикагеле с элюированием 20% этилацетатом в петролейном эфире с получением указанного в заголовке соединения (0,27 г) в виде светло-коричневого твердого вещества.

<sup>30</sup> <sup>1</sup>Н ЯМР (400 МГц) δ 10,15 (s, 1H), 10,00 (s, 1H), 8,15 (t, 1H), 7,82 (m, 1H), 7,64 (m, 1H), 7,55 (m, 1H), 7,39 (m, 1H), 7,12 (m, 3H), 4,20 (m, 1H), 3,80 (t, 1H), 3,31 (d, 1H), 3,22 (m, 1H), 3,10 (s, 3H).

<sup>35</sup> Стадия H. Получение *N*-(2-фторфенил)-4-[3-[(метоксиимино)метил]фенил]-1-метил-2-оксо-3-пирролидинкарбоксамида

<sup>40</sup> К раствору *N*-(2-фторфенил)-4-(3-формилфенил)-1-метил-2-оксо-3-пирролидинкарбоксамида (т. е. соединения, полученного на стадии G, 0,15 г, 0,41 ммоль) и гидрохлорида метоксиламина (0,054 г, 0,64 ммоль) в тетрагидрофуране (10 мл) добавляли ацетат натрия (0,047 г, 0,57 ммоль) и перемешивали при температуре окружающей среды в течение 2 часов. Реакционную смесь затем разбавляли водой и экстрагировали этилацетатом. Объединенные органические слои промывали водой и солевым раствором и высушивали над сульфатом натрия. Растворитель выпаривали с получением неочищенного продукта, который очищали с помощью препаративной тонкослойной хроматографии на силикагеле в 40% этилацетате/петролейном эфире с получением (0,07 г) указанного в заголовке соединения, соединения по настоящему изобретению, в виде грязно-белого твердого вещества.

<sup>45</sup> <sup>1</sup>Н ЯМР (400 МГц) δ 9,85 (s, 1H), 8,25 (t, 1H), 8,10 (s, 1H), 7,55 (s, 1H), 7,45 (s, 1H), 7,25 (s, 2H), 6,99 (m, 3H), 4,25 (m, 1H), 4,10 (s, 3H), 3,75 (d, 1H), 3,50 (m, 1H), 3,33 (m, 1H), 3,00 (s, 3H).

#### ПРИМЕР СИНТЕЗА 4

<sup>50</sup> Получение (3*S,4S*)-4-[3-[(5-фтор-2-пиридинил)окси]фенил]-1-метил-2-оксо-*N*-(2,3,4-трифторфенил)-3-пирролидинкарбоксамида (соединения 87)

Стадия A. Получение 3-[(5-фтор-2-пиридинил)окси]бензальдегида

Раствор 3-гидроксибензальдегида (20 г, 164 ммоль) в *N,N*-диметилформамиде (150

мл) обрабатывали трет-бутоксидом калия (23,0 г, 205 ммоль) в течение периода 1 часа. Полученную в результате смесь перемешивали при 25°C в течение 1 часа, а затем обрабатывали 2,5-дифторпиридином (18,64 г, 162 ммоль). Полученную в результате реакционную смесь перемешивали при 120°C в течение 18 часов. Реакционную смесь 5 затем охлаждали и разделяли между этилацетатом и солевым раствором. Органическую фазу промывали солевым раствором, высушивали над MgSO<sub>4</sub> и концентрировали при пониженном давлении на диатомитовом вспомогательном фильтрующем материале Celite®. Очистка с помощью твердофазной хроматографии с элюированием с градиентом этилацетата в смеси гексанов (0-35%) обеспечивала 10,0 г указанного в заголовке 10 соединения в виде белого твердого вещества.

<sup>1</sup>H ЯМР (DMSO-*d*6) δ 10,00 (s, 1H), 8,18 (d, 1H), 7,88 (m, 1H), 7,78 (m, 1H), 7,66 (t, 1H), 7,62 (m, 1H), 7,50 (m, 1H), 7,23 (m, 1H).

Стадия В. Получение 5-фтор-2-[3-[(1E)-2-нитроэтил]фенокси]пиридина

Раствор 3-[(5-фтор-2-пиридинил)окси]бензальдегида (т. е. продукта, полученного на стадии А, 10 г, 46,0 ммоль) в 1-хлорбутане (250 мл) обрабатывали нитрометаном (3,36 г, 55,2 ммоль), а затем пиперидином (391 мг, 4,6 ммоль) и уксусной кислотой (276 мг, 4,6 ммоль). Полученную в результате реакционную массу перемешивали при нагревании с обратным холодильником с азеотропным удалением воды в течение 18 часов. Неочищенную реакционную смесь затем концентрировали при пониженном давлении и очищали с помощью хроматографии (0-25% этилацетат в смеси гексанов в качестве элюента) с получением 8,7 г желтого масла.

<sup>1</sup>H ЯМР δ 8,02 (d, 1H), 7,98 (d, 1H), 7,55 (d, 1H), 7,49 (m, 2H), 7,38 (d, 1H), 7,31 (m, 1H), 7,26 (m, 1H), 6,98 (m, 1H).

Стадия С. Получение 1,3-диметил-2-[(1S)-1-[3-[(5-фтор-2-пиридинил)окси]фенил]-2-нитроэтил]пропандиоата

Перемешанную смесь 5-фтор-2-[3-[(1E)-2-нитроэтил]фенокси]пиридина (т. е. продукта, полученного на стадии В, 8,67 г, 33,3 ммоль) и диметилмалоната (5,5 г, 41,7 ммоль) в толуоле (150 мл) обрабатывали бис[(*R,R*)-*N,N*-дibenзилциклогексан-1,2-диамин]бромидом Ni(II) (полученным, как описано в *J. Am. Chem. Soc.* 2005, 127, 9958-9959; 0,400 г, 0,499 ммоль). Реакционную массу перемешивали при 80°C в течение 18 часов. Полученную в результате смесь охлаждали до 25°C, фильтровали и концентрировали при пониженном давлении с получением 13,0 г масла янтарного цвета, которое использовали без дополнительной очистки на следующей стадии.

<sup>1</sup>H ЯМР δ 8,05 (d, 1H), 7,45 (m, 1H), 7,35 (t, 1H), 7,06 (m, 2H), 6,99 (m, 1H), 6,87 (m, 1H), 4,90 (m, 2H), 4,25 (m, 1H), 3,85 (d, 1H), 3,75 (s, 3H), 3,62 (s, 3H).

Стадия Д. Получение метил-(3*R*,4*S*)-4-[3-[(5-фтор-2-пиридинил)окси]фенил]-2-оксо-3-пирролидинкарбоксилата

Перемешанную смесь 1,3-диметил 2-[(1S)-1-[3-[(5-фтор-2-пиридинил)окси]фенил]-2-нитроэтил]пропандиоата (13,0 г, 33,1 ммоль), гексагидрата хлорида никеля(II) (7,88 г, 33,1 ммоль) и метанола (300 мл) охлаждали на ледяной бане и обрабатывали борогидридом натрия (т. е. продуктом, полученным на стадии С, 3,76 г, 99,3 ммоль) путем добавления в течение 60 минут 0,5 г порций. Полученную в результате смесь перемешивали при 25°C в течение 18 часов. Затем добавляли насыщенную этилендиаминетрауксусную кислоту, раствор динатриевой соли (800 мл) и этилацетат (500 мл) и смесь перемешивали в течение 18 часов, а затем фильтровали через подушку из диатомитового вспомогательного фильтрующего материала Celite® для удаления нерастворимых частиц. Слои фильтрата разделяли и водный слой экстрагировали

етилацетатом (2 × 500 мл). Объединенные органические экстракты промывали насыщенным раствором хлорида аммония (800 мл) и солевым раствором (1000 мл). Органический экстракт высушивали над  $MgSO_4$  и концентрировали при пониженном давлении с получением вязкого серого масла (8,99 г), которое использовали без дополнительной очистки.

<sup>5</sup>  $^1H$  ЯМРδ 8,02 (d, 1H), 7,45 (m, 1H), 7,37 (t, 1H), 7,09 (m, 1H), 7,02 (m, 2H), 6,94 (m, 2H), 4,13 (m, 1H), 3,82 (m, 1H), 3,78 (s, 3H), 3,58 (d, 1H), 3,42 (m, 1H).

Стадия E. Получение (3R,4S)-4-[3-[(5-фтор-2-пиридинил)окси]фенил]-2-оксо-3-пиrrолидинкарбоновой кислоты

<sup>10</sup> Смесь метил-(3R,4S)-4-[3-[(5-фтор-2-пиридинил)окси]фенил]-2-оксо-3-пиrrолидинкарбоксилата (т. е. продукта, полученного на стадии D, 8,49 г, 25,7 ммоль) и водного раствора гидроксида натрия (50 вес. %, 6,16 г, 77,2 ммоль) в метаноле (125 мл) перемешивали при 25°C в течение 18 часов. Затем реакционную смесь разбавляли водой (250 мл) и экстрагировали диэтиловым эфиром (2 × 150 мл). Эфирный экстракт удаляли и водную фазу подкисляли концентрированной хлористоводородной кислотой до pH 2. Подкисленную водную фазу экстрагировали этилацетатом (2 × 300 мл). Объединенные органические экстракты промывали солевым раствором, высушивали ( $MgSO_4$ ) и концентрировали при пониженном давлении с получением 5,5 г бежевого стеклообразного вещества, которое использовали на следующей стадии без дополнительной очистки.

<sup>15</sup>  $^1H$  ЯМР (DMSO- $d_6$ )δ 12,7 (s, 1H), 8,16 (d, 1H), 8,07 (s, 1H), 7,83 (m, 1H), 7,37 (m, 1H), 7,17 (m, 1H), 7,12 (m, 2H), 7,01 (m, 1H), 3,88 (m, 1H), 3,62 (m, 1H), 3,51 (d, 1H), 3,21 (t, 1H).

<sup>20</sup> Стадия F. Получение (3R,4S)-4-[3-[(5-фтор-2-пиридинил)окси]фенил]-1-метил-2-оксо-3-пиrrолидинкарбоновой кислоты

К раствору *трет*-бутоксида калия (4,75 г, 42,4 ммоль) в 42,4 мл тетрагидрофурана при 0°C добавляли раствор (3R,4S)-4-[3-[(5-фтор-2-пиридинил)окси]фенил]-2-оксо-3-пиrrолидинкарбоновой кислоты (т. е. продукта, полученного на стадии E, 5,5 г, 17,4 ммоль) в тетрагидрофуране (50 мл). Полученную в результате реакционную массу перемешивали в течение 15 минут при 0°C. Каплями добавляли йодметан (6,24 г, 44 ммоль) в 40 мл тетрагидрофурана в течение 20 минут. Обеспечивали нагревание полученной в результате смеси до 25°C и перемешивали в течение ночи. Реакционную массу концентрировали при пониженном давлении и разделяли между этиловым эфиром и водой. Органическую фазу удаляли, а водную подкисляли до pH 1 концентрированной хлористоводородной кислотой. Подкисленный водный слой экстрагировали этилацетатом. Органический экстракт высушивали ( $MgSO_4$ ) и концентрировали при пониженном давлении с получением 4,0 г желтого стеклообразного вещества, которое использовали без дополнительной очистки.

<sup>25</sup>  $^1H$  ЯМРδ 9,29 (s, 1H), 8,03 (d, 1H), 7,46 (m, 1H), 7,37 (m, 1H), 7,13 (m, 1H), 7,06 (m, 1H), 7,02 (m, 1H), 6,92 (m, 1H), 3,96 (m, 1H), 3,79 (m, 1H), 3,57 (d, 1H), 3,50 (m, 1H), 2,97 (d, 3H).

Стадия G. Получение (3S,4S)-4-[3-[(5-фтор-2-пиридинил)окси]фенил]-1-метил-2-оксо-*N*-(2,3,4-трифторфенил)-3-пиrrолидинкарбоксамида

К раствору (3R,4S)-4-[3-[(5-фтор-2-пиридинил)окси]фенил]-1-метил-2-оксо-3-пиrrолидинкарбоновой кислоты (т. е. продукта, полученного на стадии F, 500 мг, 1,51 ммоль) в 5,0 мл тетрагидрофурана при 25°C добавляли триэтиламин (632 мкл, 4,54 ммоль). Реакционную смесь перемешивали в течение 5 минут, а затем обрабатывали 2,3,4-трифторанилином (208 мкл, 1,97 ммоль). После перемешивания в течение еще 5

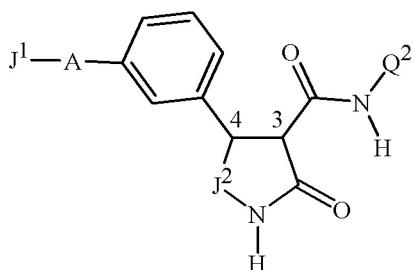
минут смесь обрабатывали пропилfosфоновым ангидридом (50% в этилацетате, 1,63 г, 2,57 ммоль). Полученную в результате смесь перемешивали в течение ночи при 25°C. Неочищенную смесь концентрировали при пониженном давлении и очищали с помощью хроматографии на силикагеле с элюированием 0-15% этилацетатом дихлорметане с получением 278 мг указанного в заголовке соединения, соединения по настоящему изобретению, в виде вязкого желтого масла.

<sup>1</sup>H ЯМРδ 9,86 (s, 1H), 8,02 (d, 1H), 7,93 (m, 1H), 7,45 (m, 1H), 7,39 (t, 1H), 7,19 (m, 1H), 7,12 (m, 1H), 7,03 (m, 1H), 6,93 (m, 1H), 6,90 (m, 1H), 4,11 (m, 1H), 3,80 (m, 1H), 3,62 (d, 1H), 3,50 (m, 1H), 2,99 (d, 3H).

<sup>10</sup> С помощью процедур, описанных в данном документе, совместно со способами, известными из уровня техники, можно получить следующие соединения из таблиц 1-6120. Далее приведены сокращения, применяемые в следующих таблицах: *t* означает третичный, *s* означает вторичный, *n* означает нормальный, *i* означает изо, *c* означает цикло, *Me* означает метил, *Et* означает этил, *Pr* означает пропил, *Bi* означает бутил, *i-Pr* означает изопропил, *c-Pr* циклопропил, *t-Bu* означает третичный бутил, *c-Bu* означает циклобутил, *Ph* означает фенил, *OMe* означает метокси, *OEt* означает этокси, *SMe* означает метилтио, *NHMe* означает метиламино, *CN* означает циано, *NO<sub>2</sub>* означает нитро, *TMS* означает триметилсилил, *SOMe* означает метилсульфинил, *C<sub>2</sub>F<sub>5</sub>* означает *CF<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>* и *SO<sub>2</sub>Me* означает метилсульфонил.

<sup>15</sup> <sup>20</sup>

Таблица 1



<sup>30</sup> <sup>J<sup>2</sup></sup> представляет собой -CH<sub>2</sub>-; <sup>A</sup> представляет собой -CH<sub>2</sub>-; <sup>Q<sup>2</sup></sup> представляет собой Ph (2-F); и <sup>J<sup>1</sup></sup> представляет собой

<sup>35</sup>

<sup>40</sup>

<sup>45</sup>

	J <sup>1</sup>	J <sup>1</sup>	J <sup>1</sup>
5	Ph(3-Cl)	Ph(2,3,4-три-F)	4-пиридинил(3-Me)
	Ph(3-F)	Ph(3,4,5-три-F)	4-пиридинил(2-F)
	Ph(3-Br)	2-пиридинил	4-пиридинил(2-CF <sub>3</sub> )
	Ph(3-Me)	2-пиридинил(6-F)	4-пиридинил(2-Me)
	Ph(3-CF <sub>3</sub> )	2-пиридинил(6-CF <sub>3</sub> )	2-тиенил
	Ph(3-OCF <sub>3</sub> )	2-пиридинил(6-Me)	2-тиенил(4-CF <sub>3</sub> )
	Ph(3-OCF <sub>2</sub> H)	2-пиридинил(5-F)	2-тиенил(5-CF <sub>3</sub> )
	Ph(3-OMe)	2-пиридинил(5-CF <sub>3</sub> )	3-тиенил
	Ph(3-OCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H)	2-пиридинил(5-Me)	3-тиенил(4-CF <sub>3</sub> )
	Ph(2-Cl)	2-пиридинил(4-F)	3-тиенил(5-CF <sub>3</sub> )
15	Ph(2-F)	2-пиридинил(4-CF <sub>3</sub> )	2-фуранил
	Ph(2-Br)	2-пиридинил(4-Me)	2-фуранил(4-CF <sub>3</sub> )
	Ph(2-Me)	2-пиридинил(3-F)	2-фуранил(5-CF <sub>3</sub> )
	Ph(2-CF <sub>3</sub> )	2-пиридинил(3-CF <sub>3</sub> )	3-фуранил
	Ph(2-OCF <sub>3</sub> )	2-пиридинил(3-Me)	3-фуранил(4-CF <sub>3</sub> )
20	Ph(2-OCF <sub>2</sub> H)	3-пиридинил	3-фуранил(5-CF <sub>3</sub> )
	Ph(2-OMe)	3-пиридинил(6-F)	пиразол-1-ил
	Ph(2-OCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H)	3-пиридинил(6-CF <sub>3</sub> )	пиразол-1-ил(4-CF <sub>3</sub> )
	Ph(4-Cl)	3-пиридинил(6-Me)	имидазол-1-ил
	Ph(4-F)	3-пиридинил(5-F)	имидазол-1-ил(4-CF <sub>3</sub> )
25	Ph(4-Br)	3-пиридинил(5-CF <sub>3</sub> )	имидазол-1-ил(2-CF <sub>3</sub> )
	Ph(4-Me)	3-пиридинил(5-Me)	имидазол-2-ил(1-Me)
	Ph(4-CF <sub>3</sub> )	3-пиридинил(4-F)	имидазол-4-ил(1-Me)
	Ph(4-OCF <sub>3</sub> )	3-пиридинил(4-CF <sub>3</sub> )	имидазол-4-ил(2-Me)
	Ph(4-OCF <sub>2</sub> H)	3-пиридинил(4-Me)	пиразол-4-ил(1-Me)
30	Ph(4-OMe)	3-пиридинил(2-F)	триазол-4-ил(1-Me)
	Ph(4-OCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H)	3-пиридинил(2-CF <sub>3</sub> )	триазол-4-ил(2-Me)
	Ph(2,3-ди-F)	3-пиридинил(2-Me)	триазол-2-ил(4-Me)
	Ph(2,4-ди-F)	4-пиридинил	триазол-1-ил(4-Me)
	Ph(2,5-ди-F)	4-пиридинил(6-F)	пиразин-2-ил
35	Ph(2,6-ди-F)	4-пиридинил(6-CF <sub>3</sub> )	пиразин-2-ил(5-CF <sub>3</sub> )
	Ph(3,4-ди-F)	4-пиридинил(6-Me)	пиримидин-2-ил
	Ph(3,5-ди-F)	4-пиридинил(5-F)	пиримидин-2-ил(5-CF <sub>3</sub> )
	Ph(3-Me,4-F)	4-пиридинил(5-CF <sub>3</sub> )	пиримидин-5-ил
	Ph(3-F,4-Me)	4-пиридинил(5-Me)	пиримидин-5-ил(2-CF <sub>3</sub> )
40	Ph(3-CF <sub>3</sub> ,4-F)	4-пиридинил(3-F)	1,3,5-триазин-2-ил
	Ph(3-F,4-CF <sub>3</sub> )	4-пиридинил(3-CF <sub>3</sub> )	тиазол-2-ил
45			

	J <sup>1</sup>	J <sup>1</sup>	J <sup>1</sup>
	тиазол-2-ил(5-CF <sub>3</sub> )	2-нафтил	3-фторпроп-2-инил
5	тиазол-5-ил	бензофуран-2-ил	3-хлорпроп-2-инил
	тиазол-5-ил(2-CF <sub>3</sub> )	бензотиофен-2-ил	5-пропоксипентил
	оксазол-2-ил	1,3-бензоксазол-2-ил	2-этоксиэтил
	оксазол-2-ил(5-CF <sub>3</sub> )	1,3-бензтиазол-2-ил	5-(1,1,2,2-
10	оксазол-5-ил	7-хинолил	тетрафторэтокси)пентил
	оксазол-5-ил(2-CF <sub>3</sub> )	индазол-1-ил	2-(1,1,2,2-
	изотиазол-5-ил	бензимидазол-1-ил	тетрафторэтокси)этил
	изотиазол-5-ил(3-CF <sub>3</sub> )	индол-1-ил	5-
	изотиазол-3-ил	пирроло[2,3-с]пиридин-1-	(трифторметокси)пентил
15	изотиазол-3-ил(5-CF <sub>3</sub> )	ил	2-(трифторметокси)этил
	изоксазол-5-ил	циклогексилметокси	
	изоксазол-5-ил(3-CF <sub>3</sub> )	2-циклогексилэтокси	
	изоксазол-3-ил	4-циклогексилбутокси	
20	изоксазол-3-ил(5-CF <sub>3</sub> )	циклогексилметил	
	тетразол-1-ил	4-циклогексилбутил	
	тетразол-1-ил(5-Me)	окт-7-енокси	
	тетразол-5-ил(1-Me)	[(E)-бут-2-енокси]	
25	1,2,4-триазол-1-ил	2,2-дифторвинилокси	
	1,3,4-оксадиазол-2-ил	3,3-дихлораллилокси	
	1,3,4-тиадиазол-2-ил	2-метоксиэтокси	
	1,2,4-оксадиазол-3-ил	3-пропоксипропокси	
	1,2,4-тиадиазол-3-ил	2-метилтиоэтил	
30	тетрагидропиран-2-ил	2-метилсульфинилэтил	
	тетрагидропиран-3-ил	2-метилсульфонилэтил	
	тетрагидрофуран-2-ил	2-CF <sub>3</sub> SO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> O	
	тетрагидрофуран-3-ил	метилсульфанил	
35	оксетан-2-ил	трифторметилтио	
	оксетан-3-ил	циклогексилтио	
	оксиран-2-ил	метилсульфинил	
	1,3-диоксолан-4-ил	трифторметилсульфинил	
40	2,2-дифтор-1,3-диоксолан-4-ил	циклогексилсульфинил	
	1,3-дитиолан-4-ил	метилсульфонил	
	1,4-диоксолан-2-ил	трифторметилсульфонил	
	1,4-дитиолан-2-ил	циклогексилсульфонил	
45	1-нафтил	проп-2-инил	
		бут-2-инил	

$J^1$	$J^1$	$J^1$
4-(1,1,2,2,- тетрафторэтокси)бутокси	2(трифторметокси)этокси трифторметил	2,2- диметилпропаноилокси
2-(1,1,2,2,- тетрафторэтокси)этокси 4-(трифторметокси) бутокси	3,3,3-трифтормопропил 2-фторциклогексил 4,4-дифторциклогексил ацетокси	3-метилбутаноилокси 2,2,2-трифторацетилокси 4,4,4- трифторметилокси

Таблица 2-360

Таблица 2 составлена таким же образом, за исключением того, что заголовок строки  $J^2$  представляет собой  $-\text{CH}_2-$ ; А представляет собой  $-\text{CH}_2-$ ;  $Q^2$  представляет собой  $\text{Ph}$  (2-F); и  $J^1$  представляет собой "заменен на заголовок строки, приведенный в таблице 2 ниже (т. е. " $J^2$  представляет собой  $-\text{CH}_2-$ ; А представляет собой  $-\text{CH}_2-$ ;  $Q^2$  представляет собой  $\text{Ph}(2,3\text{-ди-F})$ ; и  $J^1$  представляет собой"). Таким образом, первая запись в таблице 2 представляет собой соединение формулы 1, где  $J^2$  представляет собой  $-\text{CH}_2-$ ; А представляет собой  $-\text{CH}_2-$ ;  $Q^2$  представляет собой  $\text{Ph}(2,3\text{-ди-F})$ ; и  $J^1$  представляет собой  $\text{Ph}(3\text{-Cl})$  (т. е. 3-хлорфенил). Таблицы 3-360 составлены подобным образом.

Таблица	Заголовок строки
2	$J^2$ представляет собой $-\text{CH}_2-$ ; А представляет собой $-\text{CH}_2-$ ; $Q^2$ представляет собой $\text{Ph}(2,3\text{-ди-F})$ ; и $J^1$ представляет собой
3	$J^2$ представляет собой $-\text{CH}_2-$ ; А представляет собой $-\text{CH}_2-$ ; $Q^2$ представляет собой $\text{Ph}(2,4\text{-ди-F})$ ; и $J^1$ представляет собой
4	$J^2$ представляет собой $-\text{CH}_2-$ ; А представляет собой $-\text{CH}_2-$ ; $Q^2$ представляет собой $\text{Ph}(2,3,4\text{-три-F})$ ; и $J^1$ представляет собой
5	$J^2$ представляет собой $-\text{CH}_2-$ ; А представляет собой $-\text{CH}_2-$ ; $Q^2$ представляет собой $\text{Ph}(2\text{-CF}_3)$ ; и $J^1$ представляет собой
6	$J^2$ представляет собой $-\text{CH}_2-$ ; А представляет собой $-\text{CH}_2-$ ; $Q^2$ представляет собой $\text{Ph}(2\text{-Me})$ ; и $J^1$ представляет собой
7	$J^2$ представляет собой $-\text{CH}_2-$ ; А представляет собой $-\text{CH}_2-$ ; $Q^2$ представляет собой $\text{Ph}(2\text{-NO}_2)$ ; и $J^1$ представляет собой
8	$J^2$ представляет собой $-\text{CH}_2-$ ; А представляет собой $-\text{CH}_2-$ ; $Q^2$ представляет собой $\text{Ph}(2\text{-Cl})$ ; и $J^1$ представляет собой
9	$J^2$ представляет собой $-\text{CH}_2-$ ; А представляет собой $-\text{CH}_2-$ ; $Q^2$ представляет собой $\text{Ph}(2\text{-SO}_2\text{Me})$ ; и $J^1$ представляет собой
10	$J^2$ представляет собой $-\text{CH}_2-$ ; А представляет собой $-\text{CH}_2-$ ; $Q^2$ представляет собой $\text{Ph}(2\text{-F},3\text{-Cl})$ ; и $J^1$ представляет собой
11	$J^2$ представляет собой $-\text{CH}_2-$ ; А представляет собой $-\text{CH}_2\text{CH}_2-$ ; $Q^2$ представляет собой $\text{Ph}(2\text{-F})$ ; и $J^1$ представляет собой
12	$J^2$ представляет собой $-\text{CH}_2-$ ; А представляет собой $-\text{CH}_2\text{CH}_2-$ ; $Q^2$ представляет собой $\text{Ph}(2,3\text{-ди-F})$ ; и $J^1$ представляет собой
13	$J^2$ представляет собой $-\text{CH}_2-$ ; А представляет собой $-\text{CH}_2\text{CH}_2-$ ; $Q^2$ представляет собой $\text{Ph}(2,4\text{-ди-F})$ ; и $J^1$ представляет собой
14	$J^2$ представляет собой $-\text{CH}_2-$ ; А представляет собой $-\text{CH}_2\text{CH}_2-$ ; $Q^2$ представляет собой $\text{Ph}(2,3,4\text{-три-F})$ ; и $J^1$ представляет собой
15	$J^2$ представляет собой $-\text{CH}_2-$ ; А представляет собой $-\text{CH}_2\text{CH}_2-$ ; $Q^2$ представляет собой $\text{Ph}(2\text{-CF}_3)$ ; и $J^1$ представляет собой
16	$J^2$ представляет собой $-\text{CH}_2-$ ; А представляет собой $-\text{CH}_2\text{CH}_2-$ ; $Q^2$ представляет собой $\text{Ph}(2\text{-Me})$ ; и $J^1$ представляет собой





















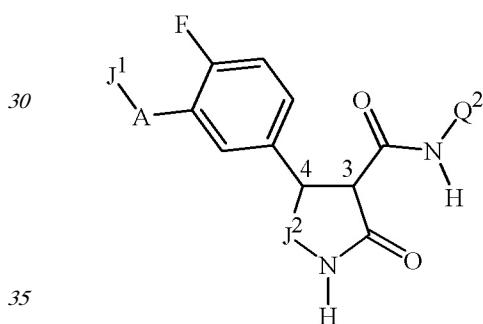




	348	$J^2$ представляет собой $-\text{CH}_2\text{CH}_2-$ ; A представляет собой $-\text{HNN=CH}-$ ; $Q^2$ представляет собой $\text{Ph}(2\text{-Cl})$ ; и $J^1$ представляет собой
5	349	$J^2$ представляет собой $-\text{CH}_2\text{CH}_2-$ ; A представляет собой $-\text{HNN=CH}-$ ; $Q^2$ представляет собой $\text{Ph}(2\text{-SO}_2\text{Me})$ ; и $J^1$ представляет собой
	350	$J^2$ представляет собой $-\text{CH}_2\text{CH}_2-$ ; A представляет собой $-\text{HNN=CH}-$ ; $Q^2$ представляет собой $\text{Ph}(2\text{-F},3\text{-Cl})$ ; и $J^1$ представляет собой
	351	$J^2$ представляет собой $-\text{CH}_2\text{CH}_2-$ ; A представляет собой $-\text{CHN=NH}-$ ; $Q^2$ представляет собой $\text{Ph}(2\text{-F})$ ; и $J^1$ представляет собой
10	352	$J^2$ представляет собой $-\text{CH}_2\text{CH}_2-$ ; A представляет собой $-\text{CHN=NH}-$ ; $Q^2$ представляет собой $\text{Ph}(2,3\text{-ди-F})$ ; и $J^1$ представляет собой
	353	$J^2$ представляет собой $-\text{CH}_2\text{CH}_2-$ ; A представляет собой $-\text{CHN=NH}-$ ; $Q^2$ представляет собой $\text{Ph}(2,4\text{-ди-F})$ ; и $J^1$ представляет собой
	354	$J^2$ представляет собой $-\text{CH}_2\text{CH}_2-$ ; A представляет собой $-\text{CHN=NH}-$ ; $Q^2$ представляет собой $\text{Ph}(2,3,4\text{-три-F})$ ; и $J^1$ представляет собой
15	355	$J^2$ представляет собой $-\text{CH}_2\text{CH}_2-$ ; A представляет собой $-\text{CHN=NH}-$ ; $Q^2$ представляет собой $\text{Ph}(2\text{-CF}_3)$ ; и $J^1$ представляет собой
	356	$J^2$ представляет собой $-\text{CH}_2\text{CH}_2-$ ; A представляет собой $-\text{CHN=NH}-$ ; $Q^2$ представляет собой $\text{Ph}(2\text{-Me})$ ; и $J^1$ представляет собой
	357	$J^2$ представляет собой $-\text{CH}_2\text{CH}_2-$ ; A представляет собой $-\text{CHN=NH}-$ ; $Q^2$ представляет собой $\text{Ph}(2\text{-NO}_2)$ ; и $J^1$ представляет собой
20	358	$J^2$ представляет собой $-\text{CH}_2\text{CH}_2-$ ; A представляет собой $-\text{CHN=NH}-$ ; $Q^2$ представляет собой $\text{Ph}(2\text{-Cl})$ ; и $J^1$ представляет собой
	359	$J^2$ представляет собой $-\text{CH}_2\text{CH}_2-$ ; A представляет собой $-\text{CHN=NH}-$ ; $Q^2$ представляет собой $\text{Ph}(2\text{-SO}_2\text{Me})$ ; и $J^1$ представляет собой
	360	$J^2$ представляет собой $-\text{CH}_2\text{CH}_2-$ ; A представляет собой $-\text{CHN=NH}-$ ; $Q^2$ представляет собой $\text{Ph}(2\text{-F},3\text{-Cl})$ ; и $J^1$ представляет собой

### 25 Таблица 361

Таблица 361 составлена таким же образом, что и таблица 1 выше, за исключением того, что структура заменена следующей:

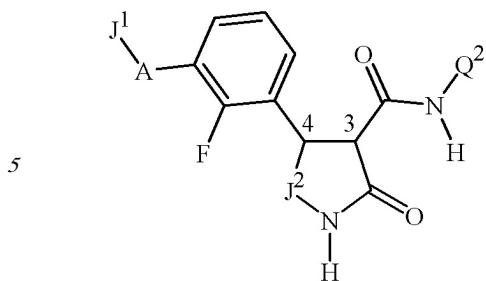


### Таблицы 362-720

Настоящее раскрытие также включает таблицы 362-720, причем каждая таблица составлена таким же образом, как и таблицы 2-360 выше, за исключением того, что структура заменена структурой в таблице 361 выше.

### 40 Таблица 1081

Таблица 1081 составлена таким же образом, что и таблица 1 выше, за исключением того, что структура заменена следующей:

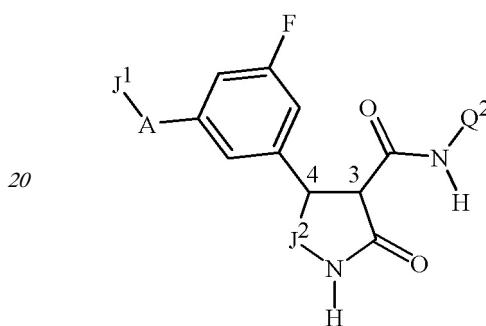


Таблицы 1082-1440

10 Настоящее раскрытие также включает таблицы 1082-1440, причем каждая таблица составлена таким же образом, как и таблицы 2-360 выше, за исключением того, что структура заменена структурой в таблице 1081 выше.

Таблица 1441

15 Таблица 1441 составлена таким же образом, что и таблица 1 выше, за исключением того, что структура заменена следующей:

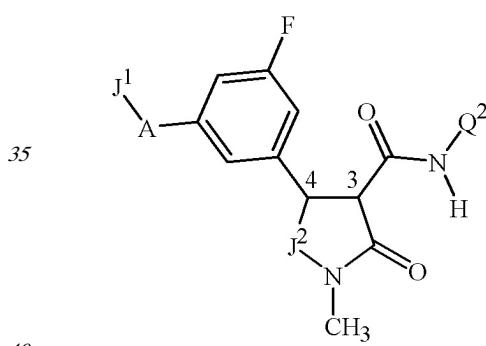


Таблицы 1442-1800

25 Настоящее раскрытие также включает таблицы 1442-1800, причем каждая таблица составлена таким же образом, как и таблицы 2-360 выше, за исключением того, что структура заменена структурой в таблице 1441 выше.

Таблица 1801

30 Таблица 1801 составлена таким же образом, что и таблица 1 выше, за исключением того, что структура заменена следующей:

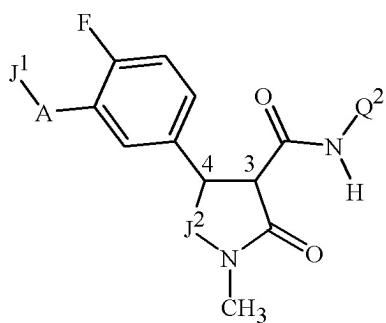


40 Таблицы 1802-2160

Настоящее раскрытие также включает таблицы 1802-2160, причем каждая таблица составлена таким же образом, как и таблицы 2-360 выше, за исключением того, что структура заменена структурой в таблице 1801 выше.

Таблица 2161

45 Таблица 2161 составлена таким же образом, что и таблица 1 выше, за исключением того, что структура заменена следующей:

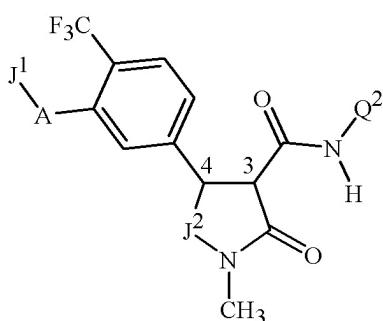


Таблицы 2162-2520

Настоящее раскрытие также включает таблицы 2162-2520, причем каждая таблица составлена таким же образом, как и таблицы 2-360 выше, за исключением того, что структура заменена структурой в таблице 2161 выше.

Таблица 2521

Таблица 2521 составлена таким же образом, что и таблица 1 выше, за исключением того, что структура заменена следующей:

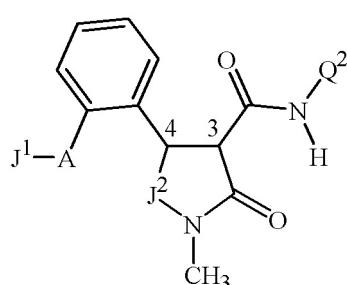


Таблицы 2522-2880

Настоящее раскрытие также включает таблицы 2522-2880, причем каждая таблица составлена таким же образом, как и таблицы 2-360 выше, за исключением того, что структура заменена структурой в таблице 2521 выше.

Таблица 2881

Таблица 2881 составлена таким же образом, что и таблица 1 выше, за исключением того, что структура заменена следующей:

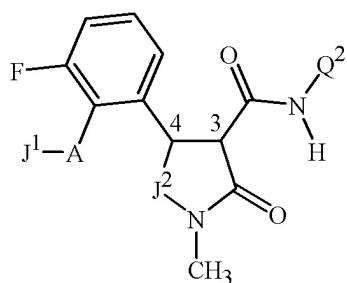


Таблицы 2882-3240

Настоящее раскрытие также включает таблицы 2882-3240, причем каждая таблица составлена таким же образом, как и таблицы 2-360 выше, за исключением того, что структура заменена структурой в таблице 7561 выше.

Таблица 3241

Таблица 3241 составлена таким же образом, что и таблица 1 выше, за исключением того, что структура заменена следующей:

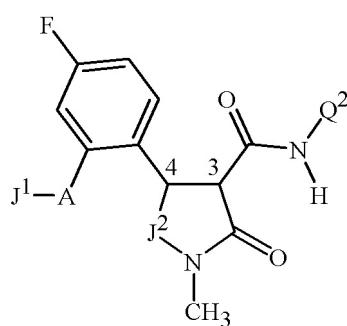


Таблицы 3242-3600

10 Настоящее раскрытие также включает таблицы 3242-3600, причем каждая таблица составлена таким же образом, как и таблицы 2-360 выше, за исключением того, что структура заменена структурой в таблице 3241 выше.

Таблица 3601

15 Таблица 3601 составлена таким же образом, что и таблица 1 выше, за исключением того, что структура заменена следующей:

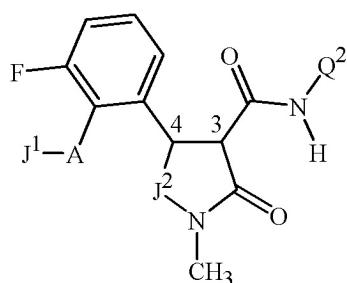


25 Таблицы 3602-3960

Настоящее раскрытие также включает таблицы 3602-3960, причем каждая таблица составлена таким же образом, как и таблицы 2-360 выше, за исключением того, что структура заменена структурой в таблице 3601 выше.

Таблица 3961

30 Таблица 3961 составлена таким же образом, что и таблица 1 выше, за исключением того, что структура заменена следующей:

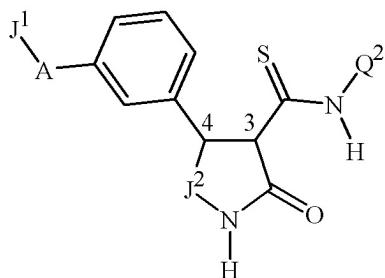


40 Таблицы 3962-4320

Настоящее раскрытие также включает таблицы 3962-4320, причем каждая таблица составлена таким же образом, как и таблицы 2-360 выше, за исключением того, что структура заменена структурой в таблице 3961 выше.

Таблица 4321

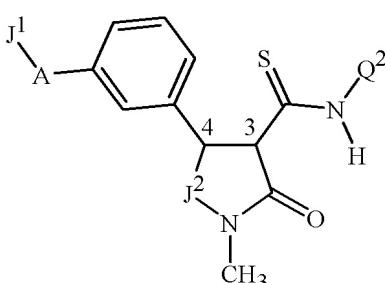
45 Таблица 4321 составлена таким же образом, что и таблица 1 выше, за исключением того, что структура заменена следующей:

Таблицы 4322-4680

10 Настоящее раскрытие также включает таблицы 4322-4680, причем каждая таблица составлена таким же образом, как и таблицы 2-360 выше, за исключением того, что структура заменена структурой в таблице 4321 выше.

Таблица 4681

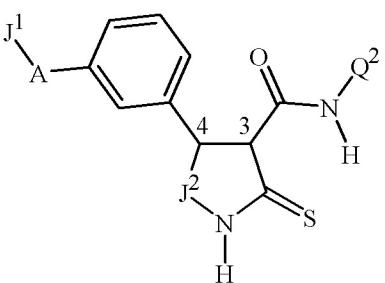
15 Таблица 4681 составлена таким же образом, что и таблица 1 выше, за исключением того, что структура заменена следующей:

Таблицы 4682-5040

25 Настоящее раскрытие также включает таблицы 4682-5040, причем каждая таблица составлена таким же образом, как и таблицы 2-360 выше, за исключением того, что структура заменена структурой в таблице 4681 выше.

Таблица 5041

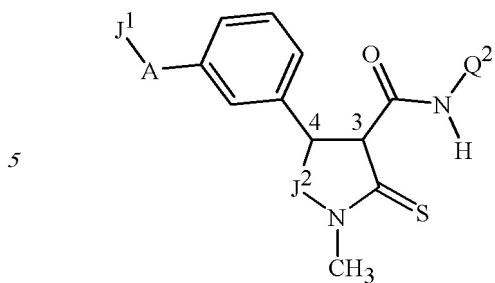
30 Таблица 5041 составлена таким же образом, что и таблица 1 выше, за исключением того, что структура заменена следующей:

Таблицы 5042-5400

40 Настоящее раскрытие также включает таблицы 5042-5400, причем каждая таблица составлена таким же образом, как и таблицы 2-360 выше, за исключением того, что структура заменена структурой в таблице 5041 выше.

Таблица 5401

45 Таблица 5401 составлена таким же образом, что и таблица 1 выше, за исключением того, что структура заменена следующей:

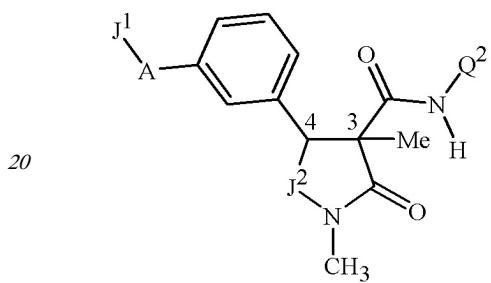


Таблицы 5402-5760

10 Настоящее раскрытие также включает таблицы 5402-5760, причем каждая таблица составлена таким же образом, как и таблицы 2-360 выше, за исключением того, что структура заменена структурой в таблице 5401 выше.

Таблица 5761

15 Таблица 5761 составлена таким же образом, что и таблица 1 выше, за исключением того, что структура заменена следующей:



Таблицы 5762-6120

25 Настоящее раскрытие также включает таблицы 5762-6120, причем каждая таблица составлена таким же образом, как и таблицы 2-360 выше, за исключением того, что структура заменена структурой в таблице 5761 выше.

Состав/Полезность

30 Соединение по настоящему изобретению обычно будут использовать в качестве гербицидного активного ингредиента в композиции, т. е. в составе, по меньшей мере с одним дополнительным компонентом, выбранным из группы, состоящей из поверхностно-активных веществ, твердых разбавителей и жидких разбавителей, которые служат в качестве носителя. Ингредиенты состава или композиции выбирают таким образом, чтобы они соответствовали физическим свойствам активного ингредиента, 35 способу применения и факторам окружающей среды, таким как тип почвы, влажность и температура.

40 Пригодные составы включают как жидкие, так и твердые композиции. Жидкие композиции включают растворы (в том числе эмульгируемые концентраты), суспензии, эмульсии (в том числе микроэмульсии, эмульсии типа масло в воде, текучие концентраты и/или суспоэмульсии) и т. п., которые необязательно можно загущать в гели. Основными типами водных жидких композиций являются растворимый концентрат, суспензионный концентрат, капсулная суспензия, концентрированная эмульсия, микроэмульсия, эмульсия типа масло в воде, текучий концентрат и суспоэмульсия. Общими типами неводных жидких композиций являются эмульгируемый концентрат, 45 микроэмульгируемый концентрат, диспергируемый концентрат и масляная дисперсия.

Основными типами твердых композиций являются пылевидные препараты, порошки, гранулы, пеллеты, дробинки, пастилки, таблетки, заполненные пленки (включая покрытия для семян) и т. п., которые могут быть диспергируемыми в воде

("смачиваемыми") или водорастворимыми. Пленки и покрытия, образованные из пленкообразующих растворов или текущих суспензий, особенно пригодны для обработки семян. Активный ингредиент может быть (микро)инкапсулирован с дальнейшим

образованием суспензии или твердого состава; в качестве альтернативы, весь состав

5 активного ингредиента может быть инкапсулирован (или подвергнут "нанесению покрытия"). Посредством инкапсулирования можно регулировать или задерживать

высвобождение активного ингредиента. Эмульгируемая гранула сочетает преимущества

как состава эмульгируемого концентрата, так и сухого гранулированного состава.

10 Концентрированные композиции в основном применяют в качестве промежуточных

продуктов для дальнейшего составления.

Распыляемые составы, как правило, разбавляют в подходящей среде перед

распылением. Такие жидкые и твердые составы составляют с возможностью

немедленного разбавления в среде распыления, обычно в воде, но иногда в другой

подходящей среде, такой как ароматический или парафиновый углеводород или

15 растительное масло. Объемы для распыления могут находиться в диапазоне от

приблизительно одного до нескольких тысяч литров на гектар, но, более типично,

находятся в диапазоне от приблизительно десяти до нескольких сотен литров на гектар.

Из распыляемых составов может быть приготовлена баковая смесь с водой или другой

20 подходящей средой для обработки листвы посредством авиационного нанесения или

внесения в почву, или внесения в субстрат для выращивания растений. Жидкие и сухие

25 составы можно отмерять непосредственно в системы капельного орошения или отмерять

в борозду во время посадки.

Составы, как правило, будут содержать эффективные количества активного

ингредиента, разбавителя и поверхностно-активного вещества в следующих

25 приблизительных диапазонах, которые составляют в сумме 100 процентов по весу.

	Процент по весу		
	Активный ингредиент	Разбавитель	Поверхностно-активное вещество
	Диспергируемые в воде и водорастворимые гранулы, таблетки и порошки	0,001-90	0-99,999
30	Масляные дисперсии, суспензии, эмульсии, растворы (в том числе эмульгируемые концентраты)	1-50	40-99
	Пылевидные препараты	1-25	70-99
	Гранулы и пеллеты	0,001-99	5-99,999
	Концентрированные композиции	90-99	0-10

35 Твердые разбавители включают, например, глины, такие как бентонит, монтмориллонит, аттапульгит и каолин, гипс, целлюлозу, диоксид титана, оксид цинка, крахмал, декстрин, сахара (например, лактозу, сахарозу), диоксид кремния, тальк, слюду, диатомовую землю, мочевину, карбонат кальция, карбонат и бикарбонат натрия и сульфат натрия. Типичные твердые разбавители описаны в Watkins et al., *Handbook of Insecticide Dust Diluents and Carriers*, 2nd Ed., Dorland Books, Caldwell, New Jersey.

40 Жидкие разбавители включают, например, воду, *N,N*-диметилалканамиды (например, *N,N*-диметилформамид), лимонен, диметилсульфоксид, *N*-алкилпирролидоны (например, *N*-метилпирролидинон), алкилфосфаты (например, триэтилфосфат), этиленгликоль, триэтиленгликоль, пропиленгликоль, дипропиленгликоль, полипропиленгликоль,

45 пропиленкарбонат, бутиленкарбонат, парафины (например, светлые минеральные масла, нормальные парафины, изопарафины), алкилбензолы, алкилнафталины, глицерин, триацетат глицерина, сорбит, ароматические углеводороды, деароматизированные алифатические углеводороды, алкилбензолы, алкилнафталины, кетоны, такие как

циклогексанон, 2-гептанон, изофорон и 4-гидрокси-4-метил-2-пентанон, ацетаты, такие как изоамилацетат, гексилацетат, гептилацетат, октилацетат, нонилацетат, тридецилацетат и изоборнилацетат, другие сложные эфиры, такие как алкилированные сложные эфиры молочной кислоты, сложные эфиры двухосновных кислот, алкил- и 5 арилбензоаты и  $\gamma$ -бутиrolактон, и спирты, которые могут быть линейными, разветвленными, насыщенными или ненасыщенными, такими как метанол, этанол,  $n$ -пропанол, изопропиловый спирт,  $n$ -бутанол, изобутиловый спирт,  $n$ -гексанол, 2- этилгексанол,  $n$ -октанол, деканол, изодециловый спирт, изооктадеканол, цетиловый спирт, лауриловый спирт, тридекиловый спирт, олеиловый спирт, циклогексанол, 10 тетрагидрофурфуриловый спирт, диацетоновый спирт, крезол и бензиловый спирт. Жидкие разбавители также включают сложные эфиры глицерина и насыщенных и ненасыщенных жирных кислот (как правило,  $C_6$ - $C_{22}$ ), такие как масла семян растений и плодов (например, масла маслины, клещевины, семян льна, кунжута, кукурузы (маиса), арахиса, подсолнечника, виноградных косточек, сафлора, семян хлопчатника, соевых 15 бобов, семян рапса, кокосового ореха и ядер кокосового ореха), жиры животного происхождения (например, говяжье сало, свиное сало, топленое свиное сало, жир печени трески, рыбий жир) и их смеси. Жидкие разбавители также включают алкилированные жирные кислоты (например, метилированные, этилированные, бутилированные), где жирные кислоты можно получить путем гидролиза сложных эфиров глицерина из 20 источников растительного и животного происхождения и можно очищать путем перегонки. Типичные жидкие разбавители описаны в Marsden, *Solvents Guide*, 2nd Ed., Interscience, New York, 1950.

Твердые и жидкие композиции по настоящему изобретению часто включают одно или несколько поверхностно-активных веществ. При добавлении к жидкости 25 поверхностно-активные вещества (также известные как "поверхностно-активные средства"), как правило, модифицируют, чаще всего уменьшают, поверхностное натяжение жидкости. В зависимости от природы гидрофильной и липофильной групп в молекуле поверхностно-активного вещества поверхностно-активные вещества можно применять в качестве смачивающих средств, диспергирующих средств, эмульгаторов 30 или пеногасителей.

Поверхностно-активные вещества могут быть классифицированы как неионогенные, анионные или катионные. Неионогенные поверхностно-активные вещества, пригодные для композиций по настоящему изобретению, включают без ограничения алcoxилаты спиртов, такие как алcoxилаты спиртов на основе природных и синтетических спиртов 35 (которые могут быть разветвленными или линейными) и полученные из спиртов и этиленоксида, пропиленоксида, бутиленоксида или их смесей; этоксилаты аминов, алканоламиды и этоксилированные алканоламиды; алcoxилированные триглицериды, такие как этоксилированные соевое, касторовое и рапсовое масла; алcoxилаты алкилфенолов, такие как этоксилаты октилфенола, этоксилаты нонилфенола, этоксилаты 40 динонилфенола и этоксилаты додецилфенола (полученные из фенолов и этиленоксида, пропиленоксида, бутиленоксида или их смесей); блок-сополимеры, полученные из этиленоксида или пропиленоксида, и блок-сополимеры обратного типа, в которых концевые блоки получены из пропиленоксида; этоксилированные жирные кислоты; этоксилированные сложные эфиры жирных кислот и масел; этоксилированные 45 метиловые сложные эфиры; этоксилированные тристирилфенолы (в том числе полученные из этиленоксида, пропиленоксида, бутиленоксида или их смесей); сложные эфиры жирных кислот, сложные эфиры глицерина, производные на основе ланолина, полиэтоксилированные сложные эфиры, такие как полиэтоксилированные сложные

эфиры сорбитана и жирных кислот, полиэтиоксилированные сложные эфиры сорбита и жирных кислот и полиэтиоксилированные сложные эфиры глицерина и жирных кислот; другие производные сорбитана, такие как сложные эфиры сорбитана; полимерные

поверхностно-активные вещества, такие как статистические сополимеры, блок-

5 сополимеры, алкидные ПЭГ (полиэтиленгликолевые) смолы, привитые или гребнеобразные полимеры и звездообразные полимеры; полиэтиленгликоли (ПЭГ); сложные эфиры полиэтиленгликоля и жирных кислот; поверхностно-активные вещества на основе кремнийорганических соединений и производные сахаров, такие как сложные эфиры сахарозы, алкилполигликозиды и алкилполисахариды.

10 Пригодные анионные поверхностно-активные вещества включают без ограничений алкиларилсульфоновые кислоты и их соли; карбоксилированные этоксилаты спиртов или алкилфенолов; дифенилсульфонатные производные; лигнин и производные лигнина, такие как лигносульфонаты; малеиновая или янтарная кислоты или их ангидриды; олефисульфонаты; сложные эфиры фосфорной кислоты, такие как сложные эфиры

15 фосфорной кислоты и алcoxилатов спиртов, сложные эфиры фосфорной кислоты и алcoxилатов алкилфенола и сложные эфиры фосфорной кислоты и этоксилатов стирилфенола; поверхностно-активные вещества на основе белка; производные саркозина; сульфат простого эфира стирилфенола; сульфаты и сульфонаты масел и жирных кислот; сульфаты и сульфонаты этоксилированных алкилфенолов; сульфаты

20 спиртов; сульфаты этоксилированных спиртов; сульфонаты аминов и амида, такие как *N,N*-алкилтаураты; сульфонаты бензола, кумола, толуола, кислола и додецил- и тридекилбензолов; сульфонаты конденсированных нафталинов; сульфонаты нафталина и алкилнафталина; сульфонаты нефти, фракционированной путем перегонки; сульфосукцинаты и сульфосукцинаты и их производные, такие как

25 диалкилсульфосукцинатные соли.

Пригодные катионные поверхностно-активные вещества включают без ограничения амида и этоксилированные амида; амины, такие как *N*-алкилпропандиамины, трипропилентриамины и дипропилентетраамины, и этоксилированные амины, этоксилированные диамины и пропоксилированные амины (полученные из аминов и 30 этиленоксида, пропиленоксида, бутиленоксида или их смесей); соли аминов, такие как аминоацетаты и соли диаминов; четвертичные соли аммония, такие как простые четвертичные соли, этоксилированные четвертичные соли и дичетвертичные соли; и аминоксиды, такие как алкилдиметиламиноксиды и бис-(2-гидроксиэтил) алкиламиноксиды.

35 Также пригодными для композиций по настоящему изобретению являются смеси неионогенных и анионных поверхностно-активных веществ или смеси неионогенных и катионных поверхностно-активных веществ. Неионогенные, анионные и катионные поверхностно-активные вещества и их рекомендуемые пути применения раскрыты во множестве опубликованных литературных источников, в том числе в *McCutcheon's*

40 *Emulsifiers and Detergents*, ежегодных американских и международных изданиях, публикуемых McCutcheon's Division, The Manufacturing Confectioner Publishing Co.; Sisely and Wood, *Encyclopedia of Surface Active Agents*, Chemical Publ. Co., Inc., New York, 1964; и A. S. Davidson and B. Milwidsky, *Synthetic Detergents*, Seventh Edition, John Wiley and Sons, New York, 1987.

45 Композиции по настоящему изобретению также могут содержать вспомогательные вещества и добавки для составления, известные специалистам в данной области техники в качестве вспомогательных средств для составления (некоторые из которых могут рассматриваться также как выполняющие функцию твердых разбавителей, жидких

разбавителей или поверхностно-активных веществ). Такие вспомогательные вещества и добавки для составления могут регулировать pH (буферы), пенообразование в ходе изготовления (противовспениватели, такие как полиорганосилоксаны), осаждение активных ингредиентов (суспендирующие средства), вязкость (тиксотропные

5 загустители), развитие микроорганизмов в таре (противомикробные средства), замораживание продуктов (антифризы), цвет (дисперсии красителей/пигментов), смывание (пленкообразователи или клейкие вещества), испарение (замедлители испарения) и другие свойства состава. Пленкообразователи включают, например, поливинилацетаты, сополимеры поливинилацетата, сополимер поливинилпирролидона 10 и винилацетата, поливиниловые спирты, сополимеры поливиниловых спиртов и воски. Примеры вспомогательных веществ и добавок для составления включают перечисленные в *McCutcheon's Volume 2: Functional Materials*, ежегодных международных и североамериканских изданиях, опубликованных McCutcheon's Division, The Manufacturing Confectioner Publishing Co.; и PCT публикации WO 03/024222.

15 Соединение формулы 1 и любые другие активные ингредиенты, как правило, включают в композиции по настоящему изобретению посредством растворения активного ингредиента в растворителе или посредством измельчения в жидком или сухом разбавителе. Растворы, в том числе эмульгируемые концентраты, можно получить посредством простого смешивания ингредиентов. Если растворитель жидкой 20 композиции, предназначенной для применения в качестве эмульгируемого концентрата, не смешивается с водой, обычно добавляют эмульгатор для эмульгирования растворителя, содержащего активное вещество, при разбавлении водой. Мокрый помол взвесей активного ингредиента с диаметрами частиц не более 2000 мкм можно проводить с применением мельниц для размола в среде с получением частиц со средними 25 значениями диаметра менее 3 мкм. Водные взвеси можно превращать в готовые супензионные концентраты (см., например, патент США № 3060084) или дополнительно обрабатывать посредством сушки распылением для образования диспергирующихся в воде гранул. Для сухих составов, как правило, требуются способы сухого помола, с помощью которых получают частицы со средними значениями диаметра в диапазоне 30 от 2 до 10 мкм. Пылевидные препараты и порошки можно получать путем смешивания и, как правило, измельчения (например, молотковой мельницей или струйной мельницей). Гранулы и пеллеты можно получать путем распыления активного материала на предварительно полученные гранулированные носители или с помощью методик гранулирования. См., Browning, "Agglomeration", *Chemical Engineering*, December 4, 1967, 35 pp 147-48, *Perry's Chemical Engineer's Handbook*, 4th Ed., McGraw-Hill, New York, 1963, страницы 8-57 и далее, и WO 91/13546. Пеллеты можно получать, как описано в патенте США № 4172714. Диспергируемые в воде и водорастворимые гранулы можно получить, как указано в патентах США № 4144050, № 3920442 и в патенте Германии № 3246493. Таблетки можно получать, как указано в патентах США № 5180587, № 5232701 и № 40 5208030. Пленки можно получать, как указано в патенте Великобритании № 2095558 и в патенте США № 3299566.

Дополнительную информацию касательно технологии составления см. в T.S. Woods, "The Formulator's Toolbox - Product Forms for Modern Agriculture" in *Pesticide Chemistry and Bioscience, The Food-Environment Challenge*, T. Brooks and T. R. Roberts, Eds., Proceedings 45 of the 9th International Congress on Pesticide Chemistry, The Royal Society of Chemistry, Cambridge, 1999, pp. 120-133. См. также патент США № 3235361, от столбца 6, строки 16, до столбца 7, строки 19, и примеры 10-41; патент США № 3309192, от столбца 5, строки 43, до столбца 7, строки 62, и примеры 8, 12, 15, 39, 41, 52, 53, 58, 132, 138-140,

162-164, 166, 167 и 169-182; патент США № 2891855, от столбца 3, строка 66, до столбца 5, строка 17, и примеры 1-4; Klingman, *Weed Control as a Science*, John Wiley and Sons, Inc., New York, 1961, pp 81-96; Hance et al., *Weed Control Handbook*, 8th Ed., Blackwell Scientific Publications, Oxford, 1989; и *Developments in formulation technology*, PJB Publications, Richmond, UK, 2000.

5 В следующих примерах все значения процентного содержания приведены по весу и все составы получают традиционными способами. Номера соединений ссылаются на соединения в таблице индексов А. Без дополнительного уточнения полагают, что специалист в данной области техники, используя предыдущее описание, может применять 10 настоящее изобретение в его наиболее полном объеме. Таким образом, следующие примеры следует рассматривать только как иллюстративные и не ограничивающие каким-либо образом настоящее раскрытие. Значения процентного содержания приведены по весу, за исключением случаев, где указано иное.

### Пример А

Концентрат с высокой степенью концентрирования	
Соединение 20	98,5%
Аэрогель на основе диоксида кремния	0,5%
Синтетический аморфный тонкодисперсный диоксид кремния	1,0%

### Пример В

Смачиваемый порошок	
Соединение 20	65,0%
Простой эфир додецилфенола и полиэтиленгликоля	2,0%
Лигнинсульфонат натрия	4,0%
Алюмосиликат натрия	6,0%
Монтмориллонит (прокаленный)	23,0%

### Пример С

Гранула	
Соединение 20	10,0%
Гранулы аттапульгита (нелетучее вещество, 0,71/0,30 мм; № сит по стандарту США 25-50)	90,0%

### Пример D

Экструдированная пеллета	
Соединение 20	25,0%
Безводный сульфат натрия	10,0%
Неочищенный лигнинсульфонат кальция	5,0%
Алкилнафтилсульфонат натрия	1,0%
Кальциево-магниевый бентонит	59,0%

### Пример Е

Эмульгируемый концентрат	
Соединение 20	10,0%
Полиоксизиленсорбит-гексаолеат	20,0%
Сложный метиловый эфир жирной кислоты C <sub>6</sub> -C <sub>10</sub>	70,0%

### Пример F

Микроэмulsion	
Соединение 20	5,0%
Сополимер поливинилпирролидона и винилацетата	30,0%

Алкилполигликазид	30,0%
Глицерилмоноолеат	15,0%
Вода	20,0%

## Пример G

5

Суспензионный концентрат	
Соединение 20	35%
Блок-сополимер бутилполиоксиэтилена и полипропилена	4,0%
Сополимер стеариновой кислоты и полиэтиленгликоля	1,0%
Стирол-акриловый полимер	1,0%
Ксантановая камедь	0,1%
Пропиленгликоль	5,0%
Пеногаситель на основе силикона	0,1%
1,2-Бензизотиазолин-3-он	0,1%
Вода	53,7%

10

## Пример H

15

Эмульсия в воде	
Соединение 20	10,0%
Блок-сополимер бутилполиоксиэтилена и полипропилена	4,0%
Сополимер стеариновой кислоты и полиэтиленгликоля	1,0%
Стирол-акриловый полимер	1,0%
Ксантановая камедь	0,1%
Пропиленгликоль	5,0%
Пеногаситель на основе силикона	0,1%
1,2-Бензизотиазолин-3-он	0,1%
Ароматический углеводород из нефтяного сырья	20,0
Вода	58,7%

20

## Пример I

25

Масляная дисперсия	
Соединение 20	25%
Полиоксиэтиленсорбиг-гексаолеат	15%
Органически модифицированная бентонитовая глина	2,5%
Сложный метиловый эфир жирной кислоты	57,5%

30

35

40

45

Настоящее раскрытие также включает примеры А-І выше, за исключением того, что "Соединение 20" замещено "Соединением 1", "Соединение 2", "Соединение 3", "Соединение 4", "Соединение 5", "Соединение 6", "Соединение 7", "Соединение 8", "Соединение 9", "Соединение 10", "Соединение 11", "Соединение 12", "Соединение 13", "Соединение 14", "Соединение 15", "Соединение 16", "Соединение 17", "Соединение 18", "Соединение 19", "Соединение 21", "Соединение 22", "Соединение 23", "Соединение 24", "Соединение 25", "Соединение 26", "Соединение 27", "Соединение 28", "Соединение 29", "Соединение 30", "Соединение 31", "Соединение 32", "Соединение 33", "Соединение 34", "Соединение 35", Соединение 36, Соединение 37, Соединение 38, Соединение 39, Соединение 40, Соединение 41, Соединение 42, Соединение 43, Соединение 44, Соединение 45, Соединение 45, Соединение 46, Соединение 47, Соединение 48, Соединение 49, Соединение 50, Соединение 51, Соединение 52, Соединение 53, Соединение 54, Соединение 55, Соединение 56, Соединение 57, Соединение 58, Соединение 59, Соединение 60, Соединение 61, Соединение 62, Соединение 63, Соединение 64, Соединение 65, Соединение 66, Соединение 67, Соединение 68, Соединение 69, Соединение 70, Соединение 71, Соединение 72, Соединение 73, Соединение 74, Соединение 75, Соединение 76, Соединение 77, Соединение 78,

Соединение 79, Соединение 80, Соединение 81, Соединение 82, Соединение 83, Соединение 84, Соединение 85, Соединение 86, Соединение 87, Соединение 88, Соединение 89 Соединение 90, Соединение 91, Соединение 92, Соединение 93 или Соединение 94.

- 5 Результаты тестов указывают на то, что соединения по настоящему изобретению являются высокоактивными предвсходовыми и/или послевсходовыми гербицидами и/или регуляторами роста растений. Соединения по настоящему изобретению обычно проявляют наиболее высокую активность в отношении послевсходового контроля сорняков (т. е. их вносят после появления проростков сорняков из почвы) и
- 10 предвсходового контроля сорняков (т. е. их вносят до появления проростков сорняков из почвы). Многие из них применимы для пред- и/или послевсходового контроля широкого спектра сорняков на участках, где желательным является полный контроль всей растительности, как например, вокруг резервуаров для хранения топлива, промышленных складских площадок, мест стоянки автомобилей, кинотеатров для
- 15 автомобилистов, аэродромов, берегов рек, ирригационных и других водных путей, около рекламных щитов и сооружений автомагистралей и железных дорог. Многие из соединений по настоящему изобретению, в силу избирательного метаболизма у сельскохозяйственных культур по сравнению с сорняками или избирательной активности в месте физиологического подавления у сельскохозяйственных культур и сорняков,
- 20 или избирательного размещения в окружающей среде или в ее пределах смеси сельскохозяйственных культур и сорняков, являются полезными для избирательного контроля травянистых и широколистенных сорняков в смеси сельскохозяйственных культур/сорняков. Специалисту в данной области техники будет понятно, что предпочтительную комбинацию этих факторов избирательности с соединением или
- 25 группой соединений можно легко определить путем осуществления стандартных биологических и/или биохимических анализов. Переносимость соединений по настоящему изобретению могут проявлять важные с агрономической точки зрения сельскохозяйственные культуры, в том числе без ограничения люцерна, ячмень, хлопчатник, пшеница, рапс, разновидности сахарной свеклы, кукуруза (маис), сорго,
- 30 разновидности сои, рис, разновидности овса, разновидности арахиса, овощи, томат, картофель, многолетние плантационные культуры, в том числе кофе, какао, масличная пальма, каучуконосы, сахарный тростник, цитрусовые, разновидности винограда, фруктовые деревья, орехоплодные деревья, банан, банан райский, ананас, разновидности хмеля, чай и лесные культуры, такие как эвкалипт и хвойные (например, сосна ладанная),
- 35 и виды дернообразующих трав (например, мяты луговой, августинова трава, овсяница тростниковая и бермудская трава). Соединения по настоящему изобретению можно использовать для сельскохозяйственных культур, которые подверглись генетической трансформации или селекции для приобретения устойчивости к гербицидам, для экспрессии белков, токсичных для беспозвоночных вредителей (как например, токсин
- 40 *Bacillus thuringiensis*), и/или экспрессии других полезных признаков. Специалистам в данной области техники будет понятно, что не все соединения в равной степени эффективны против всех сорняков. В качестве альтернативы, заявленные соединения являются полезными для модификации роста растений.

Соединения по настоящему изобретению могут демонстрировать удивительную 45 селективную активность в отношении контроля видов сорняков, произрастающих в рисе, в том числе без ограничения частуха обыкновенная (*Alisma plantago-aquatica L.*), сыть разнородная (*Cyperus difformis L.*), сыть ирия (*Cyperus iria L.*), ежовник пирамидальный (*Echinochloa colonum (L.) LINK*), ежовник обыкновенный (*Echinochloa*

*crus-galli* (L.) PBEAUV), ежовник рисовидный (на стадии, характеризующейся наличием 2 листков; *Echinochloa oryzoides* (ARD.) FRITSCH), рисовое просо (на стадии характеризующейся наличием 2 листков; *Echinochloa phyllopon* (STAPF) KOSS./VASC.), болотница сладкая (*Eleocharis dulcis* (BURM.f.) TRIN. ex HENSCHEL), гетерантера илистая 5 (*Heteranthera limosa* (SW.) WILLD./VAHL), тонкоколосник пучковатый (*Leptochloa fascicularis* (LAM.) GRAY), монохория (*Monochoria vaginalis* (BURM.f.) C.PRESL ex KUNTH), стрелолист широколистный (*Sagittaria latifolia* WILLD.), стрелолист монтевидеоский (*Sagittaria montevidensis* CHAM. & SCHLECHT), стрелолист жесткий (*Sagittaria rigida* PURSH), камыш ситниковидный (*Scirpus juncoides* ROXB.) и камыш 10 остроконечный (*Scirpus mucronatus* L.).

Соединения по настоящему изобретению также демонстрируют особенную активность (биологическую активность) в отношении контроля видов сорняков, произрастающих в зерновых культурах, в том числе без ограничения лисохвост мышевостниквидный (*Alopecurus myosuroides* Huds.), метлица обыкновенная (*Apera spica-venti* (L.) BEAUV.), 15 овсянка (*Avena fatua* L.), плевел многоцветковый (*Lolium multiflorum* LAM.), канареекник малый (*Phalaris minor* RETZ.), щетинник зеленый (*Setaria viridis* (L.) PBEAUV.).

Поскольку соединения по настоящему изобретению характеризуются (как предвсходовой, так и послевсходовой) гербицидной активностью, для контроля нежелательной растительности путем уничтожения или повреждения растительности, 20 или уменьшения ее роста, соединения можно подходящим образом наносить с помощью ряда способов, включающих приведение в контакт гербицидно эффективного количества соединения по настоящему изобретению или композиции, содержащей указанное соединение и по меньшей мере одно из поверхностно-активного вещества, твердого разбавителя или жидкого разбавителя, с листвой или другой частью нежелательной 25 растительности, или вносить в среду, окружающую нежелательную растительность, такую как почва или вода, в которой растет нежелательная растительность или которая окружает семена нежелательного растения или другую его часть для вегетативного размножения.

Гербицидно эффективное количество соединений по настоящему изобретению 30 определяется рядом факторов. Эти факторы включают: выбранный состав, способ внесения, количество и тип присутствующей растительности, условия роста и т. д. В целом, гербицидно эффективное количество соединений по настоящему изобретению составляет приблизительно 0,001-20 кг/га с предпочтительным диапазоном приблизительно 0,004-1 кг/га. Специалист в данной области техники может легко 35 определить гербицидно эффективное количество, необходимое для желаемого уровня контроля сорняков.

В одном обычном варианте осуществления соединение по настоящему изобретению вносят, как правило в форме составленной композиции, в место произрастания, содержащее желательную растительность (например, сельскохозяйственные культуры) 40 и нежелательную растительность (т. е сорняки), каждый из которых может представлять собой семена, проростки и/или более большие растения, в контакте со средой для произрастания (например, почвой). В данном месте произрастания композицию, содержащую соединение по настоящему изобретению, непосредственно применяют по отношению к растению или его части, особенно по отношению к нежелательной 45 растительности, и/или к среде для произрастания, которая находится в контакте с растением.

Виды и сорта растений желательной растительности в месте произрастания, обработанном с помощью соединения по настоящему изобретению, можно получать

традиционными способами размножения и селекции или способами генной инженерии. Генетически модифицированные растения (трансгенные растения) являются такими растениями, у которых гетерологичный ген (трансген) был стабильно интегрирован в геном растения. Трансген, который характеризуется его конкретным положением в геноме растения, называют трансформантом или трансгенным объектом.

Генетически модифицированные сорта растений в месте произрастания, которые можно обрабатывать в соответствии с настоящим изобретением, включают сорта растений, устойчивые к одному или нескольким видам биотического стресса (вредители, такие как нематоды, насекомые, клещи, грибы и т. д.) или абиотического стресса (засуха, низкая температура, засоленность почв и т. д.), или характеризующиеся другими необходимыми характеристиками. Растения можно генетически модифицировать для проявления признаков, например, переносимости гербицида, устойчивости к насекомым, модифицированных профилей масел или засухоустойчивости. Пригодные генетически модифицированные растения, содержащие трансформанты отдельного гена или комбинации трансформантов, приведены в приложении С. Дополнительную информацию по генетическим модификациям, приведенным в приложении С, можно получить из общедоступных баз данных, поддерживаемых, например, Министерством сельского хозяйства США.

Следующие сокращения, T1-T37, применяют в приложении С для признаков. "-"

означает, что запись не доступна; "переносим." означает "переносимость", и "уст." означает устойчивый.

Признак	Описание	Признак	Описание	Признак	Описание
25 T1	Переносим. глифосата	T15	Переносим. холода	T27	Высокий уровень триптофана
T2	Масло с высоким содержанием лауриновой кислоты	T16	Переносим. Имидазолиноногого герб.	T28	Прямостоящие листья, полукарлико-вость
30 T3	Переносим. глюфосината	T17	Модифицированная альфа-амилаза	T29	Полукарлико-вость
T4	Распад фитатов	T18	Контроль опыления	T30	Переносим. низкого уровня железа
35 T5	Переносим. оксинаила	T19	Переносим. 2,4-Д	T31	Модифицированная масляная/жирная кислота
T6	Уст. к болезни	T20	Повышенный уровень лизина	T32	Переносим. HPPD
T7	Уст. к насекомым	T21	Переносим. засухи	T33	Высокое содержание масел
40 T9	Модифицированный цвет цветка	T22	Замедленное созревание/увядание	T34	Переносим. Арилоксилканоата
T11	Переносим. гербицида, ингибирующего ALS	T23	Качество модифицированного продукта	T35	Переносим. мезотриона
T12	Переносим. дикамбы	T24	Высокий уровень содержания целлюлозы	T36	Сниженный уровень содержания никотина
T13	Антиаллергическое свойство	T25	Модифицированный крахмал/углевод	T37	Модифицированный продукт
T14	Переносим. соли	T26	Устойчив. к насекомым и заболеваниям		

### Приложение С

Сельскохозяйственная культура	Название объекта	Код объекта	Признак (признаки)	Ген(гены)
45 Люцерна	J101	MON-00101-8	T1	cp4 epsps (aroA:CP4)
Люцерна	J163	MON-ØØ163-7	T1	cp4 epsps (aroA:CP4)
Канола*	23-18-17 (Объект 18)	CGN-89465-2	T2	te
Канола*	23-198 (Объект 23)	CGN-89465-2	T2	te
Канола*	61061	DP-Ø61Ø61-7	T1	gat4621

	Канола*	73496	DP-Ø73496-4	T1	gat4621
	Канола*	GT200 (RT200)	MON-89249-2	T1	cp4 epsps (aroA:CP4); goxv247
	Канола*	GT73 (RT73)	MON-ØØØ73-7	T1	cp4 epsps (aroA:CP4); goxv247
5	Канола*	HCN10 (Topas 19/2)	-	T3	bar
	Канола*	HCN28 (T45)	ACS-BNØØ8-2	T3	pat (syn)
	Канола*	HCN92 (Topas 19/2)	ACS-BNØØ7-1	T3	bar
	Канола*	MON88302	MON-883Ø2-9	T1	cp4 epsps (aroA:CP4)
	Канола*	MPS961	-	T4	phyA
	Канола*	MPS962	-	T4	phyA
	Канола*	MPS963	-	T4	phyA
10	Канола*	MPS964	-	T4	phyA
	Канола*	MPS965	-	T4	phyA
	Канола*	MS1 (B91-4)	ACS-BNØØ4-7	T3	bar
	Канола*	MS8	ACS-BNØØ5-8	T3	bar
	Канола*	OXY-235	ACS-BNØ11-5	T5	bxn
15	Канола*	PHY14	-	T3	bar
	Канола*	PHY23	-	T3	bar
	Канола*	PHY35	-	T3	bar
	Канола*	PHY36	-	T3	bar
	Канола*	RF1 (B93-101)	ACS-BNØØ1-4	T3	bar
	Канола*	RF2 (B94-2)	ACS-BNØØ2-5	T3	bar
	Канола*	RF3	ACS-BNØØ3-6	T3	bar
20	Фасоль	EMBRAPA 5,1	EMB-PV051-1	T6	ac1 (смысловая и антисмысловая)
	Бадриджан#	EE-1	-	T7	cry1Ac
	Хлопчатник	19-51a	DD-Ø1951A-7	T11	S4-HrA
	Хлопчатник	281-24-236	DAS-24236-5	T3,T7	pat (syn); cry1F
	Хлопчатник	3006-210-23	DAS-21Ø23-5	T3,T7	pat (syn); cry1Ac
25	Хлопчатник	31707	-	T5,T7	bxn; cry1Ac
	Хлопчатник	31803	-	T5,T7	bxn; cry1Ac
	Хлопчатник	31807	-	T5,T7	bxn; cry1Ac
	Хлопчатник	31808	-	T5,T7	bxn; cry1Ac
	Хлопчатник	42317	-	T5,T7	bxn; cry1Ac
	Хлопчатник	BNLA-601	-	T7	cry1Ac
30	Хлопчатник	BXN10211	BXN10211-9	T5	bxn; cry1Ac
	Хлопчатник	BXN10215	BXN10215-4	T5	bxn; cry1Ac
	Хлопчатник	BXN10222	BXN10222-2	T5	bxn; cry1Ac
	Хлопчатник	BXN10224	BXN10224-4	T5	bxn; cry1Ac
	Хлопчатник	COT102	SYN-IR102-7	T7	vip3A(a)
	Хлопчатник	COT67B	SYN-IR67B-1	T7	cry1Ab
35	Хлопчатник	COT202	-	T7	vip3A
	Хлопчатник	Объект 1	-	T7	cry1Ac
	Хлопчатник	GMF Cry1A	GTL-GMF311-7	T7	cry1Ab-Ac
	Хлопчатник	GHB119	BCS-GH005-8	T7	cry2Ae
	Хлопчатник	GHB614	BCS-GH002-5	T1	2mepsps
	Хлопчатник	GK12	-	T7	cry1Ab-Ac
40	Хлопчатник	LLCotton25	ACS-GH001-3	T3	bar
	Хлопчатник	MLS 9124	-	T7	cry1C
	Хлопчатник	MON1076	MON-89924-2	T7	cry1Ac
	Хлопчатник	MON1445	MON-01445-2	T1	cp4 epsps (aroA:CP4)
	Хлопчатник	MON15985	MON-15985-7	T7	cry1Ac; cry2Ab2
	Хлопчатник	MON1698	MON-89383-1	T7	cp4 epsps (aroA:CP4)
45	Хлопчатник	MON531	MON-00531-6	T7	cry1Ac
	Хлопчатник	MON757	MON-00757-7	T7	cry1Ac
	Хлопчатник	MON88913	MON-88913-8	T1	cp4 epsps (aroA:CP4)
	Хлопчатник	Nqwe Chi 6 Bt	-	T7	-
	Хлопчатник	SKG321	-	T7	cry1A; CpTI

	Хлопчатник	T303-3	BCS-GH003-6	T3,T7	cry1Ab; bar
	Хлопчатник	T304-40	BCS-GH004-7	T3,T7	cry1Ab; bar
	Хлопчатник	CE43-67B	-	T7	cry1Ab
	Хлопчатник	CE46-02A	-	T7	cry1Ab
5	Хлопчатник	CE44-69D	-	T7	cry1Ab
	Хлопчатник	1143-14A	-	T7	cry1Ab
	Хлопчатник	1143-51B	-	T7	cry1Ab
	Хлопчатник	T342-142	-	T7	cry1Ab
	Хлопчатник	PV-GHGT07 (1445)	-	T1	cp4 epsps (aroA:CP4)
	Хлопчатник	EE-GH3	-	T1	mepsps
10	Хлопчатник	EE-GH5	-	T7	cry1Ab
	Хлопчатник	MON88701	MON-88701-3	T3,T12	Модифицированный dmo; bar
	Хлопчатник	OsCr11	-	T13	Модифицированный Cry j
	Лен	FP967	CDC-FL001-2	T11	als
	Чечевица	RH44	-	T16	als
15	Маис	3272	SYN-E3272-5	T17	amy797E
	Маис	5307	SYN-05307-1	T7	ecry3,1Ab
	Маис	59122	DAS-59122-7	T3,T7	cry34Ab1; cry35Ab1; pat
	Маис	676	PH-000676-7	T3,T18	pat; dam
	Маис	678	PH-000678-9	T3,T18	pat; dam
	Маис	680	PH-000680-2	T3,T18	pat; dam
	Маис	98140	DP-098140-6	T1,T11	gat4621; zm-hra
20	Маис	Bt10	-	T3,T7	cry1Ab; pat
	Маис	Bt176 (176)	SYN-EV176-9	T3,T7	cry1Ab; bar
	Маис	BVLA430101	-	T4	phyA2
	Маис	CBH-351	ACS-ZM004-3	T3,T7	cry9C; bar
	Маис	DAS40278-9	DAS40278-9	T19	aad-1
	Маис	DBT418	DKB-89614-9	T3,T7	cry1Ac; pinII; bar
25	Маис	DLL25 (B16)	DKB-89790-5	T3	bar
	Маис	GA21	MON-00021-9	T1	mepsps
	Маис	GG25	-	T1	mepsps
	Маис	GJ11	-	T1	mepsps
	Маис	Fl117	-	T1	mepsps
30	Маис	GAT-ZM1	-	T3	pat
	Маис	LY038	REN-00038-3	T20	cordapA
	Маис	MIR162	SYN-IR162-4	T7	vip3Aa20
	Маис	MIR604	SYN-IR604-5	T7	mcry3A
	Маис	MON801 (MON80100)	MON801	T1,T7	cry1Ab; cp4 epsps (aroA:CP4); goxv247
35	Маис	MON802	MON-80200-7	T1,T7	cry1Ab; cp4 epsps (aroA:CP4); goxv247
	Маис	MON809	PH-MON-809-2	T1,T7	cry1Ab; cp4 epsps (aroA:CP4); goxv247
	Маис	MON810	MON-00810-6	T1,T7	cry1Ab; cp4 epsps (aroA:CP4); goxv247
	Маис	MON832	-	T1	cp4 epsps (aroA:CP4); goxv247
	Маис	MON863	MON-00863-5	T7	cry3Bb1
40	Маис	MON87427	MON-87427-7	T1	cp4 epsps (aroA:CP4)
	Маис	MON87460	MON-87460-4	T21	cspB
	Маис	MON88017	MON-88017-3	T1,T7	cry3Bb1; cp4 epsps (aroA:CP4)
	Маис	MON89034	MON-89034-3	T7	cry2Ab2; cry1A.105
	Маис	MS3	ACS-ZM001-9	T3,T18	bar; barnase
	Маис	MS6	ACS-ZM005-4	T3,T18	bar; barnase
45	Маис	NK603	MON-00603-6	T1	cp4 epsps (aroA:CP4)
	Маис	T14	ACS-ZM002-1	T3	pat (syn)
	Маис	T25	ACS-ZM003-2	T3	pat (syn)
	Маис	TC1507	DAS-01507-1	T3,T7	cry1Fa2; pat
	Маис	TC6275	DAS-06275-8	T3,T7	mcry1F; bar

	Маис	VIP1034	-	T3,T7	vip3A; pat
	Маис	43A47	DP-043A47-3	T3,T7	cry1F; cry34Ab1; cry35Ab1; pat
	Маис	40416	DP-040416-8	T3,T7	cry1F; cry34Ab1; cry35Ab1; pat
	Маис	32316	DP-032316-8	T3,T7	cry1F; cry34Ab1; cry35Ab1; pat
	Маис	4114	DP-004114-3	T3,T7	cry1F; cry34Ab1; cry35Ab1; pat
5	Дыня	Дыня А	-	T22	sam-k
	Дыня	Дыня В	-	T22	sam-k
	Папайя	55-1	CUH-CP551-8	T6	prsv cp
	Папайя	63-1	CUH-CP631-7	T6	prsv cp
	Папайя	Huanong № 1	-	T6	prsv rep
10	Папайя	X17-2	UFL-X17CP-6	T6	prsv cp
	Слива	C-5	ARS-PLMC5-6	T6	ppv cp
	Канола**	ZSR500	-	T1	cp4 epsps (aroA:CP4); goxv247
	Канола**	ZSR502	-	T1	cp4 epsps (aroA:CP4); goxv247
	Канола**	ZSR503	-	T1	cp4 epsps (aroA:CP4); goxv247
	Рис	7Crp#242-95-7	-	T13	7crp
15	Рис	7Crp#10	-	T13	7crp
	Рис	GM Shanyou 63	-	T7	cry1Ab; cry1Ac
	Рис	Huahui-1/TT51-1	-	T7	cry1Ab; cry1Ac
	Рис	LLRICE06	ACS-OS001-4	T3	bar
	Рис	LLRICE601	BCS-OS003-7	T3	bar
	Рис	LLRICE62	ACS-OS002-5	T3	bar
20	Рис	Tarom molaii+cry1Ab	-	T7	cry1Ab (усеченный)
	Рис	GAT-OS2	-	T3	bar
	Рис	GAT-OS3	-	T3	bar
	Рис	PE-7	-	T7	Cry1Ac
	Рис	7Crp#10	-	T13	7crp
25	Рис	KPD627-8	-	T27	OASA1D
	Рис	KPD722-4	-	T27	OASA1D
	Рис	KA317	-	T27	OASA1D
	Рис	HW5	-	T27	OASA1D
	Рис	HW1	-	T27	OASA1D
	Рис	B-4-1-18	-	T28	Δ OsBRI1
30	Рис	G-3-3-22	-	T29	OSGA2ox1
	Рис	AD77	-	T6	DEF
	Рис	AD51	-	T6	DEF
	Рис	AD48	-	T6	DEF
	Рис	AD41	-	T6	DEF
	Рис	13pNasNa800725atAprt1	-	T30	HvNAS1; HvNAAT-A; APRT
35	Рис	13pAprt1	-	T30	APRT
	Рис	gHvNAS1-gHvNAAT-1	-	T30	HvNAS1; HvNAAT-A; HvNAAT-B
	Рис	gHvIDS3-1	-	T30	HvIDS3
	Рис	gHvNAAT1	-	T30	HvNAAT-A; HvNAAT-B
	Рис	gHvNAS1-1	-	T30	HvNAS1
40	Рис	NIA-OS006-4	-	T6	WRKY45
	Рис	NIA-OS005-3	-	T6	WRKY45
	Рис	NIA-OS004-2	-	T6	WRKY45
	Рис	NIA-OS003-1	-	T6	WRKY45
	Рис	NIA-OS002-9	-	T6	WRKY45
	Рис	NIA-OS001-8	-	T6	WRKY45
45	Рис	OsCr11	-	T13	Модифицированный Cry j
	Рис	17053	-	T1	cp4 epsps (aroA:CP4)
	Рис	17314	-	T1	cp4 epsps (aroA:CP4)
	Роза	WKS82/130-4-1	IFD-52401-4	T9	5AT; bp40 (f3'5'h)
	Роза	WKS92/130-9-1	IFD-52901-9	T9	5AT; bp40 (f3'5'h)
	Соя	260-05 (G94-1, G94-19, G168)	-	T9	gm-fad2-1 (сайленсинг локуса)

	Соя	A2704-12	ACS-GM005-3	T3	pat
	Соя	A2704-21	ACS-GM004-2	T3	pat
	Соя	A5547-127	ACS-GM006-4	T3	pat
	Соя	A5547-35	ACS-GM008-6	T3	pat
5	Соя	CV127	BPS-CV127-9	T16	csr1-2
	Соя	DAS68416-4	DAS68416-4	T3	pat
	Соя	DP305423	DP-305423-1	T11,T31	gm-fad2-1 (сайленсинг локуса); gm-hra
	Соя	DP356043	DP-356043-5	T1,T31	gm-fad2-1 (сайленсинг локуса); gat4601
10	Соя	FG72	MST-FG072-3	T32,T1	2mepsps; hppdPF W336
	Соя	GTS 40-3-2 (40-3-2)	MON-04032-6	T1	cp4 epsps (aroA:CP4)
	Соя	GU262	ACS-GM003-1	T3	pat
	Соя	MON87701	MON-87701-2	T7	cry1Ac
	Соя	MON87705	MON-87705-6	T1,T31	fatb1-A (смысловая и антисмысловая); fad2-1A (смысловая и антисмыловая); cp4 epsps (aroA: CP4)
15	Соя	MON87708	MON-87708-9	T1,T12	dmo; cp4 epsps (aroA:CP4)
	Соя	MON87769	MON-87769-7	T1,T31	Pj.D6D; Nc.Fad3; cp4 epsps (aroA: CP4)
	Соя	MON89788	MON-89788-1	T1	cp4 epsps (aroA:CP4)
	Соя	W62	ACS-GM002-9	T3	bar
	Соя	W98	ACS-GM001-8	T3	bar
20	Соя	MON87754	MON-87754-1	T33	dga12A
	Соя	DAS21606	DAS-21606	T34,T3	Модифицированный aad-12; pat
	Соя	DAS44406	DAS-44406-6	T1,T3,T34	Модифицированный aad-12; 2mepsps; pat
	Соя	SYHT04R	SYN-0004R-8	T35	Модифицированный avhppd
	Соя	9582,814,19,1	-	T3,T7	cry1Ac, cry1F, PAT
25	Тыква	CZW3	SEM-0CZW3-2	T6	cmv cp, zymv cp, wmv cp
	Тыква	ZW20	SEM-0ZW20-7	T6	zymv cp, wmv cp
	Сахарная свекла	GTSB77 (T9100152)	SY-GTSB77-8	T1	cp4 epsps (aroA:CP4); goxv247
	Сахарная свекла	H7-1	KM-000H71-4	T1	cp4 epsps (aroA:CP4)
	Сахарная свекла	T120-7	ACS-BV001-3	T3	pat
	Сахарная свекла	T227-1	-	T1	cp4 epsps (aroA:CP4)
30	Сахарный тростник	NXI-1T	-	T21	EcbetA
	Подсолнечник	X81359	-	T16	als
	Перец	PK-SP01	-	T6	cmv cp
	Табак	C/F/93/08-02	-	T5	bxn
	Табак	Вектор 21-41	-	T36	NtQPT1 (антисмысловая)
	Подсолнечник	X81359	-	T16	als
35	Пшеница	MON71800	MON-71800-3	T1	cp4 epsps (aroA:CP4)

\* Аргентинский (*Brassica napus*), \*\* польский (*B. rapa*), # баклажан

Хотя, как правило, соединения по настоящему изобретению применяют для контроля нежелательной растительности, приведение в контакт желательной растительности в обработанном месте произрастания с соединениями по настоящему изобретению может

40 привести в результате к сверхаддитивным или синергическим эффектам с генетическими признаками желательной растительности, в том числе с признаками, введенными с помощью генетической модификации. Например, устойчивость к растительноядным вредителям-насекомым или болезням растений, устойчивость к биотическим/абиотическим стрессам или стабильность при хранении может быть больше ожидаемых 45 как результат генетических признаков в желательной растительности.

Соединения по настоящему изобретению также можно смешивать с одним или несколькими другими биологически активными соединениями или средствами, включая гербициды, антидоты гербицидов, фунгициды, инсектициды, нематоциды, бактерициды,

акарициды, регуляторы роста, такие как ингибиторы линьки насекомых и стимуляторы укоренения, хемостерилизаторы, химические сигнальные вещества, репелленты, аттрактанты, феромоны, стимуляторы питания, питательные вещества растений, другие биологически активные соединения или энтомопатогенные бактерии, вирусы или грибы, с образованием многокомпонентного пестицида, обеспечивающего еще более широкий спектр защиты сельскохозяйственных культур и продукции. Смеси соединений по настоящему изобретению с другими гербицидами могут расширить спектр активности против дополнительных видов сорняков и подавлять пролиферацию любых устойчивых биотипов. Таким образом, настоящее изобретение также относится к композиции, содержащей соединение формулы 1 (в гербицидно эффективном количестве) и по меньшей мере одно дополнительное биологически активное соединение или средство (в биологически эффективном количестве) и может дополнительно содержать по меньшей мере одно из поверхностно-активного вещества, твердого разбавителя или жидкого разбавителя. Другие биологически активные соединения или средства можно составлять в композиции, содержащие по меньшей мере одно из поверхностно-активного вещества, твердого или жидкого разбавителя. Для смесей по настоящему изобретению одно или несколько других биологически активных соединений или средств можно составлять вместе с соединением формулы 1 с образованием премикса, или одно или несколько других биологически активных соединений или средств можно составлять 20 отдельно от соединения формулы 1, и составы можно объединять вместе перед внесением (например, в резервуаре распылителя) или, в качестве альтернативы, вносить последовательно.

Для контроля сорняков может быть особенно пригодной смесь одного или нескольких из следующих гербицидов с соединением по настоящему изобретению: ацетохлора, ацифлуорфена и его натриевой соли, аклонифена, акролеина (2-пропенала), алахлора, аллоксидима, аметрина, амикарбазона, амидосульфуриона, аминоциклических и его сложных эфиров (например, метилового, этилового) и солей (например, натриевой, калиевой), аминопирилида, амитрола, сульфамата аммония, анилофоса, асулама, атразина, азимсульфуриона, бефлубутамида, беназолина, бенкарбазона, бенфлуралина, бенфуресата, бенсульфурион-метила, бенсулида, бентазона, бензобициклина, бензофенапа, бициклического, бифенокса, биланафоса, биспиробака и его натриевой соли, бромацила, бромобутида, бромофероноксима, бромоксилила, бромоксилилоктаноата, бутахлора, бутафенацила, бутамифоса, бутралина, бутроксидима, бутилата, кафенстрола, карбетамида, карфентразон- этила, катехина, хлорметоксифена, хлорамбена, хлорбромуриона, хлорфлуоренол-метила, хлоридазона, хлоримурион- этила, хлоротолуриона, хлорпрофама, хлорсульфуриона, хлортал-диметила, хлортиамида, цинидон- этила, цинметилина, циносульфуриона, клацифоса, клефоксидима, клетодима, клодинафоп-пропаргила, кломазона, кломепропа, клопириалида, клопириалид-оламина, клорансулам-метила, кумилуриона, цианазина, циклоата, циклопиримората, циклосульфамуриона, циклоксидима, цигалофоп-бутила, 2,4-Д и его бутотилового, бутилового, изооктилового и изопропилового сложных эфиров и его диметиламмониевой, диоламинной и троламинной солей, даймурона, далапона, далапон-натрия, дазомета, 2,4-DB и его диметиламмониевой, калиевой и натриевой солей, десмедифама, десметрина, дикамбы и ее дигликольаммониевой, диметиламмониевой, 45 калиевой и натриевой солей, дихлобенила, дихлорпропа, диклофоп-метила, диклосулама, дифензокват-метилсульфата, дифлуфеникана, дифлуфензопира, димефуриона, димепиперата, диметахлора, диметаметрина, диметенамида, диметенамида-Р, диметипина, диметиларсиновой кислоты и ее натриевой соли, динитрамина, динотерба,

дифенамида, дикват-дибромида, дитиопира, диурона, DNOC, эндотала, EPTC, эспрокарба, эталфлуралина, этаметсульфурон-метила, этиозина, этофумезата, этоксифена, этоксисульфурона, этобензанида, феноксапроп-этила, феноксапроп-Р-этила, феноксасульфона, фенквинотриона, фентразамида, фенурона, фенурона-ТСА, 5 флампроп-метила, флампроп-М-изопропила, флампроп-М-метила, фланасульфурона, флорасулама, флуазифоп-бутила, флуазифоп-Р-бутила, флуазолата, флукарбазона, флуцетосульфурона, флухлоралина, флуфенацета, флуфенпира, флуфенпир-этила, флуметсулема, флумиклорак-пентила, флумиоксазина, флуометурона, флуорогликофен-этила, флупоксами, флупирсульфурон-метила и его натриевой соли, флуоренола, 10 флуоренол-бутила, флуридона, флуорхлоридона, флуорксипира, флуртамона, флутиацет-метила, фомесафена, форамсульфурона, фосамин-аммония, глюфосината, глюфосината аммония, глюфосината-Р, глифосата и его солей, таких как аммониевая, изопропиламмониевая, калиевая, натриевая (в том числе натриевая сесквисоль) и тримезиевая (альтернативно называемая сульфосатом), галауксифена, галауксифен-15 метила, галосульфурон-метила, галоксифоп-этотила, галоксифоп-метила, гексазиона, гидантоцидина, имазаметабенз-метила, имазамокса, имазапика, имазапира, имазаквина, имазаквин-аммония, имазетапира, имазетапир-аммония, имазосульфурона, инданофана, индазифлама, иофенсульфурона, йодосульфурон-метила, иоксинаила, иоксинаил-октаноата, иоксинаил-натрия, ипфенкарбазона, изопротурона, изоурона, изоксабена, 20 изоксафлутола, изоксахлортола, лактофена, ленацила, линурона, гидразида малеиновой кислоты, MCPA и ее солей (например, MCPA-диметиламмония, MCPA-калия и MCPA-натрия), сложных эфиров (например, MCPA-2-этилгексила, MCPA-бутотила) и сложных тиоэфиров (например, MCPA-тиоэтила), MCPB и ее солей (например, MCPB-натрия) и сложных эфиров (например, MCPB-этила), мекопропа, мекопропа-Р, мефенацета, 25 мефлуидида, мезосульфурон-метила, мезотриона, метам-натрия, метамифопа, метамитрона, метазахлора, метазосульфурона, метабензтиазурона, метиларсоновой кислоты и ее кальциевой,monoаммониевой, мононатриевой и динатриевой солей, метилдимрона, метобензурона, метобромурона, метолахлора, S-метолахлора, метосулама, метоксурона, метрибузина, метсульфурон-метила, молината, монолинурона, 30 напранилида, напропамида, напропамида-М, напталама, небурона, никосульфурона, норфлуразона, орбенкарба, ортосульфамурона, оризалина, оксадиаргила, оксадиазона, оксасульфурона, оксазикломефона, оксифлуорфена, паракват-дихлорида, пебулата, пеларгоновой кислоты, пендиметалина, пеноксулама, пентанохлора, пентоксазона, перфлуидона, петоксамида, петоксиамида, фенмедифама, пиклорама, пиклорам-калия, 35 пиколинафена, пиноксадена, пиперофоса, претилахлора, примисульфурон-метила, продиамина, профоксидима, прометона, прометрина, пропахлора, пропанила, пропаквизафопа, пропазина, профама, пропизохлора, пропоксикарбазона, пропирикусульфурона, пропизамида, просульфокарба, просульфурона, пираклонила, пирафлуfen-этила, пирасульфотола, пиразогила, пиразолината, пиразоксифена, 40 пиразосульфурон-этила, пирибензоксима, пирибутикарба, пиридата, пирифталида, пириминобак-метила, пиримисульфана, пиритиобака, пиритиобак-натрия, пироксасульфона, пироксулама, квинклорака, квинмерака, квинокламина, квизалофоп-этила, квизалофоп-Р-этила, квизалофоп-Р-тефурила, римсульфурона, сафлуфенацила, сетоксидима, сидурона, симазина, симетрина, сульфентразона, 45 сульфометурон-метила, сульфосульфурона, 2,3,6-ТВА, ТСА, ТСА-натрия, тебутама, тебутиурона, тефурилтриона, темботриона, тепралоксидима, тербацила, тербуметона, тербутилазина, тербутирина, тенилхлора, тиазопира, тиенкарбазона, тифенсульфурон-метила, тиобенкарба, тиафенацила, тиокарбазила, толпиралата, топрамезона,

траплоксидима, триаллата, триафамона, триасульфурана, триазифлама, трибенурон-метила, триклопира, триклопир-бутотила, триклопир-триэтиламмония, тридифана, триэтазина, трифлоксисульфурана, трифлудимоксазина, трифлуралина,

трифлусульфурон-метила, тритосульфурана, вернолата, 3-(2-хлор-3,6-дифторфенил)-

5 4-гидрокси-1-метил-1,5-нафтиридин-2(1Н)-она, 5-хлор-3-[(2-гидрокси-6-оксо-1-циклогексен-1-ил)карбонил]-1-(4-метоксифенил)-2(1Н)-хиноксалинона, 2-хлор-N-(1-метил-1Н-тетразол-5-ил)-6-(трифторметил)-3-пиридинкарбоксамида, 7-(3,5-дихлор-4-пиридинил)-5-(2,2-дифторэтил)-8-гидроксиридо[2,3-в]пиразин-6(5Н)-она, 4-(2,6-диэтил-4-метилфенил)-5-гидрокси-2,6-диметил-3(2Н)-пиридинона, 5-[(2,6-дифторфенил)

10 метокси]метил]-4,5-дигидро-5-метил-3-(3-метил-2-тиенил)изоксазола (ранее метиоксолин), 4-(4-фторфенил)-6-[(2-гидрокси-6-оксо-1-циклогексен-1-ил)карбонил]-2-метил-1,2,4-триазин-3,5(2Н,4Н)-диона, метил-4-амино-3-хлор-6-(4-хлор-2-фтор-3-метоксифенил)-5-фтор-2-пиридинкарбоксилата, 2-метил-3-(метилсульфонил)-N-(1-метил-1Н-тетразол-5-ил)-4-(трифторметил)бензамида и 2-метил-N-(4-метил-1,2,5-

15 оксациазол-3-ил)-3-(метилсульфинил)-4-(трифторметил)бензамида. Другие гербициды также включают биогербициды, такие как *Alternaria destruens* Simmons, *Colletotrichum gloeosporioides* (Penz.) Penz. & Sacc., *Drechslera monoceras* (MTB-951), *Myrothecium verrucaria* (Albertini & Schweinitz) Ditmar: Fries, *Phytophthora palmivora* (Butl.) Butl. и *Puccinia thlaspeos* Schub.

20 Соединения по настоящему изобретению также можно применять в комбинации с регуляторами роста растений, такими как авиглицин, N-(фенилметил)-1Н-пурин-6-амин, эпохолеон, гибберелловая кислота, гиббереллин A<sub>4</sub> и A<sub>7</sub>, белок харпин, мепикват-хлорид, прогексадион кальция, прогидрожасмон, нитрофенолят натрия и тринексапак-метил, и организмами, модифицирующими рост растений, такими как *Bacillus cereus* штамм BP01.

25 Основные справочные материалы по применяемым в сельском хозяйстве защитным средствам (т. е. гербицидам, антидотам гербицидов, инсектицидам, фунгицидам, нематоцидам, акарицидам и биологическим средствам) включают *The Pesticide Manual, 13th Edition*, C. D. S. Tomlin, Ed., British Crop Protection Council, Farnham, Surrey, U.K., 2003, и *The BioPesticide Manual, 2nd Edition*, L. G. Copping, Ed., British Crop Protection Council, Farnham, Surrey, U.K., 2001.

30 Для вариантов осуществления, где применяют один или несколько данных разных объектов смешивания, объекты для смешивания применяют, как правило, в количествах аналогичных обычным количествам, когда объекты смешивания применяют по 35 отдельности. Более конкретно, в смесях активные ингредиенты часто применяют при норме внесения, составляющей от половины до полной нормы внесения, указанной на этикетке продукта для применения активного ингредиента отдельно. Данные количества приведены в справочных материалах, таких как *The Pesticide Manual* и *The BioPesticide Manual*. Весовое соотношение данных различных объектов смешивания (в сумме) к 40 соединению формулы 1, как правило, составляет от приблизительно 1:3000 до приблизительно 3000:1. Следует отметить весовые соотношения от приблизительно 1:300 до приблизительно 300:1 (например, соотношения от приблизительно 1:30 до приблизительно 30:1). Специалист в данной области техники путем простого проведения 45 опытов может легко определить биологически эффективные количества активных ингредиентов, необходимые для требуемого спектра биологической активности. Будет очевидно, что включение этих дополнительных компонентов может расширить спектр подлежащих контролю сорняков за рамки спектра контроля только с помощью соединения формулы 1.

В определенных случаях комбинации соединения по настоящему изобретению с другими биологически активными (в частности, гербицидными) соединениями или средствами (т. е. активными ингредиентами) могут приводить в результате к эффекту, большему, чем аддитивный (т. е. синергическому) в отношении сорняков и/или к эффекту, 5 меньшему, чем аддитивный (т. е. эффекту антидота) в отношении сельскохозяйственных культур или других желаемых растений. Снижение количества активных ингредиентов, высвобождаемых в окружающую среду при обеспечении эффективного контроля вредителей, всегда является желательным. Возможность применения больших количеств 10 активных ингредиентов для обеспечения более эффективного контроля сорняков без чрезмерного повреждения сельскохозяйственного растения также является желательной. В случае синергизма гербицидных активных ингредиентов в отношении сорняков при нормах внесения, обеспечивающих агрономически удовлетворительные уровни контроля сорняков, такие комбинации могут быть предпочтительными для уменьшения затрат 15 на производство в растениеводстве и снижения нагрузки на окружающую среду. Если имеет место воздействие гербицидных активных ингредиентов по типу антидота на сельскохозяйственные культуры, такие комбинации могут быть предпочтительными для повышения защиты сельскохозяйственных культур путем снижения конкуренции 20 с сорняками.

Следует отметить комбинацию соединения по настоящему изобретению по меньшей 25 мере с одним другим гербицидным активным ингредиентом. Следует отдельно отметить такую комбинацию, в которой другой гербицидный активный ингредиент имеет место

приложения действия, отличное от соединения по настоящему изобретению. В определенных случаях комбинация, в которой по меньшей мере один другой гербицидный активный ингредиент действует в сходном спектре контроля, но отличается 30 местом приложения действия, будет особенно предпочтительной для контроля устойчивости. Таким образом, композиция по настоящему изобретению может дополнительно содержать (в гербицидно эффективном количестве) по меньшей мере один дополнительный гербицидный активный ингредиент со сходным спектром контроля, но отличающимся местом приложения действия.

Соединения по настоящему изобретению также можно применять в комбинации с антидотами гербицидов, такими как аллидохлор, беноксакор, клоквинтосет-мексил, кумилурон, циометринил, ципросульфонамид, даймурон, дихлормид, дициклонон, диятолат, димепиперат, фенхлоразол-этил, фенклорим, флуразол, флуксофеним, фурилазол, изоксадифен-этил, мефенпир-диэтил, мефенат, метоксифенон, нафталиновый 35 ангидрид (1,8-нафталевый ангидрид), оксабетринил, *N*-(аминокарбонил)-2-метилбензосульфонамид, *N*-(аминокарбонил)-2-фторбензосульфонамид, 1-бром-4-[хлорметил]сульфонил]бензол (BCS), 4-(дихлорацетил)-1-окса-4-азоспиро[4.5]декан (MON 4660), 2-(дихлорметил)-2-метил-1,3-диоксолан (MG 191), этил-1,6-дигидро-1-(2-метоксифенил)-6-оксо-2-фенил-5-пиридинкарбоксилат, 2-гидрокси-*N,N*-диметил-6-40 (трифторметил)пиридин-3-карбоксамид и 3-оксо-1-циклогексен-1-ил-1-(3,4-диметилфенил)-1,6-дигидро-6-оксо-2-фенил-5-пиридинкарбоксилат, 2,2-дихлор-1-(2,2,5-триметил-3-оксазолидинил)этанон и 2-метокси-*N*-[[4-[(метиламино)карбонил]амино]фенил]сульфонил]-бензамид для повышения безопасности определенных 45 сельскохозяйственных культур. Эффективные в качестве антидота количества антидотов гербицидов можно вносить одновременно с соединениями по настоящему изобретению или использовать для обработок семян. Таким образом, аспект настоящего изобретения относится к гербицидной смеси, содержащей соединение по настоящему изобретению и эффективное в качестве антидота количество антидота гербицида. Обработка семян

является особенно полезной для избирательного контроля сорняков, поскольку это физически ограничивает антидотное действие по отношению к культурным растениям. Таким образом, особенно пригодным вариантом осуществления настоящего изобретения является способ избирательного контроля роста нежелательной растительности в сельскохозяйственной культуре, предусматривающий приведение в контакт места произрастания сельскохозяйственной культуры с гербицидно эффективным количеством соединения по настоящему изобретению, где семя, из которого выращивают сельскохозяйственную культуру, обрабатывают эффективным в качестве антидота количеством антидота. Специалист в данной области техники путем простого проведения экспериментов может легко определить эффективные в качестве антидота количества антидотов.

Соединения по настоящему изобретению можно также смешивать с: (1) полинуклеотидами, включая без ограничения ДНК, РНК, и/или химически модифицированные нуклеотиды, которые влияют на количество определенной мишени путем подавления, интерференции, супрессии или сайленсинга генетически выведенного транскрипта, что оказывает гербицидное действие; или (2) полинуклеотидами, включая без ограничения ДНК, РНК, и/или химически модифицированные нуклеотиды, которые влияют на количество определенной мишени путем подавления, интерференции, супрессии или сайленсинга генетически выведенного транскрипта, что оказывает антидотное действие.

Следует отметить композицию, содержащую соединение по настоящему изобретению (в гербицидно эффективном количестве), по меньшей мере один дополнительный активный ингредиент, выбранный из группы, состоящей из других гербицидов и антидотов гербицидов (в эффективном количестве), и по меньшей мере один компонент, выбранный из группы, состоящей из поверхностно-активных веществ, твердых разбавителей и жидких разбавителей.

Предпочтительными для лучшего контроля нежелательной растительности (например, меньшая рабочая концентрация, как, например, в результате синергизма, более широкий спектр контролируемых сорняков или повышенная безопасность для сельскохозяйственной культуры) или для предотвращения развития устойчивых сорняков являются смеси соединения по настоящему изобретению с другим гербицидом. В таблице А1 перечислены конкретные комбинации компонента (а) (т. е. конкретного соединения по настоящему изобретению) с другим гербицидом в качестве компонента (б), иллюстрирующие смеси, композиции и способы по настоящему изобретению. Соединение 20 в столбце компонента (а) определено в таблице индексов А. Во втором столбце таблицы А1 перечислен компонент (б), представляющий собой конкретное соединение, (например, "2,4-D" в первой строке). В третьем, четвертом и пятом столбцах в таблице А1 перечислены диапазоны весовых соотношений для норм, в которых компонент (а), представляющий собой соединение, как правило, наносят на растущие в полевых условиях сельскохозяйственные культуры, по сравнению с компонентом (б) (т. е. (а): (б)). Таким образом, например, в первой строке в таблице А1, в частности, раскрыта комбинация компонента (а) (т. е. соединения 17 в таблице индексов А) с 2,4-D, которую, как правило, вносят в весовом соотношении 1:192-6:1. Остальные строки в таблице А1 также следует толковать подобным образом.

#### ТАБЛИЦА А1

Компонент (а) (№ соединения)	Компонент (б)	Типичное весовое соотношение	Более типичное весовое соотношение	Наиболее типичное весовое соотношение
20	2,4-D	1:192-6:1	1:64-2:1	1:24-1:3

5	20	Ацетохлор	1:768-2:1	1:256-1:2	1:96-1:11
	20	Ацифлуорфен	1:96-12:1	1:32-4:1	1:12-1:2
	20	Аклонифен	1:857-2:1	1:285-1:3	1:107-1:12
	20	Алахлор	1:768-2:1	1:256-1:2	1:96-1:11
	20	Аметрин	1:384-3:1	1:128-1:1	1:48-1:6
	20	Амикарбазон	1:192-6:1	1:64-2:1	1:24-1:3
	20	Амидосульфурон	1:6-168:1	1:2-56:1	1:1-11:1
	20	Аминоциклический	1:48-24:1	1:16-8:1	1:6-2:1
	20	Аминопиразид	1:20-56:1	1:6-19:1	1:2-4:1
	20	Амитрол	1:768-2:1	1:256-1:2	1:96-1:11
10	20	Анилофос	1:96-12:1	1:32-4:1	1:12-1:2
	20	Асулам	1:960-2:1	1:320-1:3	1:120-1:14
	20	Атразин	1:192-6:1	1:64-2:1	1:24-1:3
	20	Азимсульфурон	1:6-168:1	1:2-56:1	1:1-11:1
	20	Бефлубутамид	1:342-4:1	1:114-2:1	1:42-1:5
	20	Бенфуресат	1:617-2:1	1:205-1:2	1:77-1:9
15	20	Бенсульфурон-метил	1:25-45:1	1:8-15:1	1:3-3:1
	20	Бентазон	1:192-6:1	1:64-2:1	1:24-1:3
	20	Бензобициклон	1:85-14:1	1:28-5:1	1:10-1:2
	20	Бензофенап	1:257-5:1	1:85-2:1	1:32-1:4
	20	Бициклический	1:42-27:1	1:14-9:1	1:5-2:1
	20	Бифенокс	1:257-5:1	1:85-2:1	1:32-1:4
20	20	Биспиробак-натрий	1:10-112:1	1:3-38:1	1:1-7:1
	20	Бромацил	1:384-3:1	1:128-1:1	1:48-1:6
	20	Бромобутил	1:384-3:1	1:128-1:1	1:48-1:6
	20	Бромоксинил	1:96-12:1	1:32-4:1	1:12-1:2
	20	Бутахлор	1:768-2:1	1:256-1:2	1:96-1:11
	20	Бутафенацил	1:42-27:1	1:14-9:1	1:5-2:1
25	20	Бутилат	1:1542-1:2	1:514-1:5	1:192-1:22
	20	Карфенстрол	1:192-6:1	1:64-2:1	1:24-1:3
	20	Карфентразон-этил	1:128-9:1	1:42-3:1	1:16-1:2
	20	Хлоримурон-этил	1:8-135:1	1:2-45:1	1:1-9:1
	20	Хлортолурон	1:768-2:1	1:256-1:2	1:96-1:11
	20	Хлорсульфурон	1:6-168:1	1:2-56:1	1:1-11:1
30	20	Цинкосульфурон	1:17-68:1	1:5-23:1	1:2-5:1
	20	Цинидон-этил	1:384-3:1	1:128-1:1	1:48-1:6
	20	Цинметилин	1:34-34:1	1:11-12:1	1:4-3:1
	20	Клаифос	1:34-34:1	1:11-12:1	1:4-3:1
	20	Клетодим	1:48-24:1	1:16-8:1	1:6-2:1
	20	Клодинафоп-пропаргил	1:20-56:1	1:6-19:1	1:2-4:1
35	20	Кломазон	1:384-3:1	1:128-1:1	1:48-1:6
	20	Кломепроп	1:171-7:1	1:57-3:1	1:21-1:3
	20	Клопиразид	1:192-6:1	1:64-2:1	1:24-1:3
	20	Клорансулям-метил	1:12-96:1	1:4-32:1	1:1-6:1
	20	Кумилурон	1:384-3:1	1:128-1:1	1:48-1:6
	20	Цианазин	1:384-3:1	1:128-1:1	1:48-1:6
40	20	Циклопириморат	1:17-68:1	1:5-23:1	1:2-5:1
	20	Циклосульфамурон	1:17-68:1	1:5-23:1	1:2-5:1
	20	Циклоксидим	1:96-12:1	1:32-4:1	1:12-1:2
	20	Цигалофоп	1:25-45:1	1:8-15:1	1:3-3:1
	20	Даимурон	1:192-6:1	1:64-2:1	1:24-1:3
	20	Десмедифам	1:322-4:1	1:107-2:1	1:40-1:5
	20	Дикамба	1:192-6:1	1:64-2:1	1:24-1:3
	20	Дихлобенил	1:1371-1:2	1:457-1:4	1:171-1:20
	20	Дихлорпроп	1:925-2:1	1:308-1:3	1:115-1:13
	20	Диклофоп-метил	1:384-3:1	1:128-1:1	1:48-1:6
45	20	Диклосулям	1:10-112:1	1:3-38:1	1:1-7:1

5	20	Дифензокват	1:288-4:1	1:96-2:1	1:36-1:4
	20	Дифлуфеникан	1:857-2:1	1:285-1:3	1:107-1:12
	20	Дифлуфензопир	1:12-96:1	1:4-32:1	1:1-6:1
	20	Диметахлор	1:768-2:1	1:256-1:2	1:96-1:11
	20	Диметаметрин	1:192-6:1	1:64-2:1	1:24-1:3
	20	Диметенамид-Р	1:384-3:1	1:128-1:1	1:48-1:6
	20	Дитиопир	1:192-6:1	1:64-2:1	1:24-1:3
	20	Диурон	1:384-3:1	1:128-1:1	1:48-1:6
	20	ЕРТС	1:768-2:1	1:256-1:2	1:96-1:11
	20	Эспрокарб	1:1371-1:2	1:457-1:4	1:171-1:20
10	20	Эталфуралин	1:384-3:1	1:128-1:1	1:48-1:6
	20	Этаметсульфурон-метил	1:17-68:1	1:5-23:1	1:2-5:1
	20	Этоксифен	1:8-135:1	1:2-45:1	1:1-9:1
	20	Этоксисульфурон	1:20-56:1	1:6-19:1	1:2-4:1
	20	Этобензанид	1:257-5:1	1:85-2:1	1:32-1:4
	20	Феноксапроп-этил	1:120-10:1	1:40-4:1	1:15-1:2
15	20	Феноксасульфон	1:85-14:1	1:28-5:1	1:10-1:2
	20	Фенквинотрион	1:17-68:1	1:5-23:1	1:2-5:1
	20	Фентразамид	1:17-68:1	1:5-23:1	1:2-5:1
	20	Флазасульфурон	1:17-68:1	1:5-23:1	1:2-5:1
	20	Флорасулам	1:2-420:1	1:1-140:1	2:1-27:1
	20	Флуазифоп-бутил	1:192-6:1	1:64-2:1	1:24-1:3
20	20	Флукарбазон	1:8-135:1	1:2-45:1	1:1-9:1
	20	Флусетосульфурон	1:8-135:1	1:2-45:1	1:1-9:1
	20	Флуфенацет	1:257-5:1	1:85-2:1	1:32-1:4
	20	Флуметсулам	1:24-48:1	1:8-16:1	1:3-3:1
	20	Флумиклорак-пентил	1:10-112:1	1:3-38:1	1:1-7:1
25	20	Флумиоксазин	1:25-45:1	1:8-15:1	1:3-3:1
	20	Флуометурон	1:384-3:1	1:128-1:1	1:48-1:6
	20	Флупирсульфурон-метил	1:3-336:1	1:1-112:1	2:1-21:1
	20	Флуридон	1:384-3:1	1:128-1:1	1:48-1:6
	20	Флуроксипир	1:96-12:1	1:32-4:1	1:12-1:2
	20	Флуртамон	1:857-2:1	1:285-1:3	1:107-1:12
30	20	Флутиацет-метил	1:48-42:1	1:16-14:1	1:3-3:1
	20	Фомесафен	1:96-12:1	1:32-4:1	1:12-1:2
	20	Форамсульфурон	1:13-84:1	1:4-28:1	1:1-6:1
	20	Глюфосинат	1:288-4:1	1:96-2:1	1:36-1:4
	20	Глифосат	1:288-4:1	1:96-2:1	1:36-1:4
	20	Галосульфурон-метил	1:17-68:1	1:5-23:1	1:2-5:1
35	20	Галауксифен	1:20-56:1	1:6-19:1	1:2-4:1
	20	Галауксифен-метил	1:20-56:1	1:6-19:1	1:2-4:1
	20	Галоксифоп-метил	1:34-34:1	1:11-12:1	1:4-3:1
	20	Гексазинон	1:192-6:1	1:64-2:1	1:24-1:3
	20	Гидантоцидин	1:1100-16:1	1:385-8:1	1:144-4:1
	20	Имазамокс	1:13-84:1	1:4-28:1	1:1-6:1
	20	Имазапик	1:20-56:1	1:6-19:1	1:2-4:1
40	20	Имазапир	1:85-14:1	1:28-5:1	1:10-1:2
	20	Имазаквин	1:34-34:1	1:11-12:1	1:4-3:1
	20	Имазетабенз-метил	1:171-7:1	1:57-3:1	1:21-1:3
	20	Имазетапир	1:24-48:1	1:8-16:1	1:3-3:1
	20	Имазосульфурон	1:27-42:1	1:9-14:1	1:3-3:1
	20	Инданофан	1:342-4:1	1:114-2:1	1:42-1:5
45	20	Индазифлам	1:25-45:1	1:8-15:1	1:3-3:1
	20	Йодосульфурон-метил	1:3-336:1	1:1-112:1	2:1-21:1
	20	Иоксинил	1:192-6:1	1:64-2:1	1:24-1:3
	20	Ипфенкарбазон	1:85-14:1	1:28-5:1	1:10-1:2
	20	Изопротурон	1:384-3:1	1:128-1:1	1:48-1:6

5	20	Изоксабен	1:288-4:1	1:96-2:1	1:36-1:4
	20	Изоксафлутол	1:60-20:1	1:20-7:1	1:7-2:1
	20	Лактофен	1:42-27:1	1:14-9:1	1:5-2:1
	20	Ленацил	1:384-3:1	1:128-1:1	1:48-1:6
	20	Линурон	1:384-3:1	1:128-1:1	1:48-1:6
	20	MCRA	1:192-6:1	1:64-2:1	1:24-1:3
	20	MCPB	1:288-4:1	1:96-2:1	1:36-1:4
	20	Мекопроп	1:768-2:1	1:256-1:2	1:96-1:11
	20	Мефенацет	1:384-3:1	1:128-1:1	1:48-1:6
	20	Мефлуид	1:192-6:1	1:64-2:1	1:24-1:3
10	20	Мезосульфурон-метил	1:5-224:1	1:1-75:1	1:1-14:1
	20	Мезотрион	1:42-27:1	1:14-9:1	1:5-2:1
	20	Метамифоп	1:42-27:1	1:14-9:1	1:5-2:1
	20	Метазахлор	1:384-3:1	1:128-1:1	1:48-1:6
	20	Метазосульфурон	1:25-45:1	1:8-15:1	1:3-3:1
	20	Метабензиазурон	1:768-2:1	1:256-1:2	1:96-1:11
15	20	Метолахлор	1:768-2:1	1:256-1:2	1:96-1:11
	20	Метосулам	1:8-135:1	1:2-45:1	1:1-9:1
	20	Метрибузин	1:192-6:1	1:64-2:1	1:24-1:3
	20	Метсульфурон-метил	1:2-560:1	1:1-187:1	3:1-35:1
	20	Молинат	1:1028-2:1	1:342-1:3	1:128-1:15
	20	Напропамид	1:384-3:1	1:128-1:1	1:48-1:6
20	20	Напропамид-М	1:192-6:1	1:64-2:1	1:24-1:3
	20	Наптала	1:192-6:1	1:64-2:1	1:24-1:3
	20	Никосульфурон	1:12-96:1	1:4-32:1	1:1-6:1
	20	Норфлуразон	1:1152-1:1	1:384-1:3	1:144-1:16
	20	Орбенкарб	1:1371-1:2	1:457-1:4	1:171-1:20
25	20	Ортосульфамурон	1:20-56:1	1:6-19:1	1:2-4:1
	20	Оризалин	1:514-3:1	1:171-1:2	1:64-1:8
	20	Оксадиаргил	1:384-3:1	1:128-1:1	1:48-1:6
	20	Оксадиазон	1:548-3:1	1:182-1:2	1:68-1:8
	20	Оксасульфурон	1:27-42:1	1:9-14:1	1:3-3:1
	20	Оксазикломефон	1:42-27:1	1:14-9:1	1:5-2:1
	20	Оксифлуорфен	1:384-3:1	1:128-1:1	1:48-1:6
30	20	Паракват	1:192-6:1	1:64-2:1	1:24-1:3
	20	Пендиметалин	1:384-3:1	1:128-1:1	1:48-1:6
	20	Пеноксулам	1:10-112:1	1:3-38:1	1:1-7:1
	20	Пентоксамид	1:384-3:1	1:128-1:1	1:48-1:6
	20	Пентоксазон	1:102-12:1	1:34-4:1	1:12-1:2
35	20	Фенмедифам	1:102-12:1	1:34-4:1	1:12-1:2
	20	Пиклорам	1:96-12:1	1:32-4:1	1:12-1:2
	20	Пиколинафен	1:34-34:1	1:11-12:1	1:4-3:1
	20	Пиноксаден	1:25-45:1	1:8-15:1	1:3-3:1
	20	Претилахлор	1:192-6:1	1:64-2:1	1:24-1:3
	20	Примисульфурон-метил	1:8-135:1	1:2-45:1	1:1-9:1
40	20	Продиамин	1:384-3:1	1:128-1:1	1:48-1:6
	20	Профоксидим	1:42-27:1	1:14-9:1	1:5-2:1
	20	Прометрин	1:384-3:1	1:128-1:1	1:48-1:6
	20	Пропахлор	1:1152-1:1	1:384-1:3	1:144-1:16
	20	Пропанил	1:384-3:1	1:128-1:1	1:48-1:6
	20	Пропаквизафоп	1:48-24:1	1:16-8:1	1:6-2:1
	20	Пропоксикарбазон	1:17-68:1	1:5-23:1	1:2-5:1
45	20	Пропирисульфурон	1:17-68:1	1:5-23:1	1:2-5:1
	20	Пропизамид	1:384-3:1	1:128-1:1	1:48-1:6
	20	Просульфокарб	1:1200-1:2	1:400-1:4	1:150-1:17
	20	Просульфурон	1:6-168:1	1:2-56:1	1:1-11:1
	20	Пираклонил	1:42-27:1	1:14-9:1	1:5-2:1

20	Пирафлуфен-этил	1:5-224:1	1:1-75:1	1:1-14:1
20	Пирасульфотол	1:13-84:1	1:4-28:1	1:1-6:1
20	Пиразолинат	1:857-2:1	1:285-1:3	1:107-1:12
20	Пиразосульфурон-этил	1:10-112:1	1:3-38:1	1:1-7:1
20	Пиразоксифен	1:5-224:1	1:1-75:1	1:1-14:1
20	Пирибензоксим	1:10-112:1	1:3-38:1	1:1-7:1
20	Пирибутикарб	1:384-3:1	1:128-1:1	1:48-1:6
20	Пиридат	1:288-4:1	1:96-2:1	1:36-1:4
20	Пирифталид	1:10-112:1	1:3-38:1	1:1-7:1
20	Пириминобак-метил	1:20-56:1	1:6-19:1	1:2-4:1
20	Пиримисульфан	1:17-68:1	1:5-23:1	1:2-5:1
20	Пиритиобак	1:24-48:1	1:8-16:1	1:3-3:1
20	Пироксасульфон	1:85-14:1	1:28-5:1	1:10-1:2
20	Пироксулам	1:5-224:1	1:1-75:1	1:1-14:1
20	Квинклорак	1:192-6:1	1:64-2:1	1:24-1:3
20	Квизалофон-этил	1:42-27:1	1:14-9:1	1:5-2:1
20	Римсульфурон	1:13-84:1	1:4-28:1	1:1-6:1
20	Сафлуфенацил	1:25-45:1	1:8-15:1	1:3-3:1
20	Сетоксидим	1:96-12:1	1:32-4:1	1:12-1:2
20	Симазин	1:384-3:1	1:128-1:1	1:48-1:6
20	Сулькотрион	1:120-10:1	1:40-4:1	1:15-1:2
20	Сульфентразон	1:147-8:1	1:49-3:1	1:18-1:3
20	Сульфометурон-метил	1:34-34:1	1:11-12:1	1:4-3:1
20	Сульфосульфурон	1:8-135:1	1:2-45:1	1:1-9:1
20	Тебутиурон	1:384-3:1	1:128-1:1	1:48-1:6
20	Тефурилтрион	1:42-27:1	1:14-9:1	1:5-2:1
20	Темботрион	1:31-37:1	1:10-13:1	1:3-3:1
20	Тепралоксидим	1:25-45:1	1:8-15:1	1:3-3:1
20	Тербацил	1:288-4:1	1:96-2:1	1:36-1:4
20	Тербутилазин	1:857-2:1	1:285-1:3	1:107-1:12
20	Тербутрин	1:192-6:1	1:64-2:1	1:24-1:3
20	Тенилхлор	1:85-14:1	1:28-5:1	1:10-1:2
20	Тиазопир	1:384-3:1	1:128-1:1	1:48-1:6
20	Тиенкарбазон	1:3-336:1	1:1-112:1	2:1-21:1
20	Тифенсульфурон-метил	1:5-224:1	1:1-75:1	1:1-14:1
20	Тиафенацил	1:17-68:1	1:5-23:1	1:2-5:1
20	Тиобенкарб	1:768-2:1	1:256-1:2	1:96-1:11
20	Толпиралат	1:31-37:1	1:10-13:1	1:3-3:1
20	Топрамезон	1:6-168:1	1:2-56:1	1:1-11:1
20	Тралкоксидим	1:68-17:1	1:22-6:1	1:8-2:1
20	Триафамон	1:2-420:1	1:1-140:1	2:1-27:1
20	Триаллат	1:768-2:1	1:256-1:2	1:96-1:11
20	Триасульфурон	1:5-224:1	1:1-75:1	1:1-14:1
20	Триазифлам	1:171-7:1	1:57-3:1	1:21-1:3
20	Трибенурон-метил	1:3-336:1	1:1-112:1	2:1-21:1
20	Триклопир	1:192-6:1	1:64-2:1	1:24-1:3
20	Трифлоксисульфурон	1:2-420:1	1:1-140:1	2:1-27:1
20	Трифлудимоксазин	1:25-45:1	1:8-15:1	1:3-3:1
20	Трифлуралин	1:288-4:1	1:96-2:1	1:36-1:4
20	Трифлусульфурон-метил	1:17-68:1	1:5-23:1	1:2-5:1
20	Тритосульфурон	1:13-84:1	1:4-28:1	1:1-6:1

45 Таблица А2 составлена таким же образом, как и таблица А1 выше, за исключением того, что записи под заголовком столбца "компонент (а)" (т. е. "20") заменены на соответствующую запись в столбце для компонента (а), показанную ниже. В столбце для компонента (а) № соединения определен в таблице индексов А. Таким образом,

например, в таблице A2 во всех записях под заголовком столбца "компонент (а)" упоминается "соединение 1" (т. е. соединение 1, определенное в таблице индексов А), и в первой строке под заголовками столбцов в таблице A2, в частности, раскрывается смесь соединения 1 с 2,4-D. Таблицы А3-А94 составлены подобным образом.

5

10

15

20

25

30

35

40

45

Номер таблицы	Записи в столбце для компонента (а)
A2	Соединение 1
A3	Соединение 2
A4	Соединение 3
A5	Соединение 4
A6	Соединение 5
A7	Соединение 6
A8	Соединение 7
A9	Соединение 8
A10	Соединение 9
A11	Соединение 10
A12	Соединение 11
A13	Соединение 12
A14	Соединение 13
A15	Соединение 14
A16	Соединение 15
A17	Соединение 16
A18	Соединение 17
A19	Соединение 18
A20	Соединение 19
A21	Соединение 21
A22	Соединение 22
A23	Соединение 23
A24	Соединение 24
A25	Соединение 25
A26	Соединение 26
A27	Соединение 27
A28	Соединение 28
A29	Соединение 29
A30	Соединение 30
A31	Соединение 31
A32	Соединение 32
A33	Соединение 33
A34	Соединение 34
A35	Соединение 35
A36	Соединение 36
A37	Соединение 37
A38	Соединение 38
A39	Соединение 39
A40	Соединение 40
A41	Соединение 41
A42	Соединение 42
A43	Соединение 43
A44	Соединение 44
A45	Соединение 45
A46	Соединение 46
A47	Соединение 47
A48	Соединение 48
A49	Соединение 49
A50	Соединение 50
A51	Соединение 51

	A52	Соединение 52
	A53	Соединение 53
	A54	Соединение 54
	A55	Соединение 55
5	A56	Соединение 56
	A57	Соединение 57
	A58	Соединение 58
	A59	Соединение 59
	A60	Соединение 60
	A61	Соединение 61
10	A62	Соединение 62
	A63	Соединение 63
	A64	Соединение 64
	A65	Соединение 65
	A66	Соединение 66
	A67	Соединение 67
15	A68	Соединение 68
	A69	Соединение 69
	A70	Соединение 70
	A70	Соединение 70
	A71	Соединение 71
	A72	Соединение 72
20	A73	Соединение 73
	A74	Соединение 74
	A75	Соединение 75
	A76	Соединение 76
	A77	Соединение 77
	A78	Соединение 78
25	A79	Соединение 79
	A80	Соединение 80
	A81	Соединение 81
	A82	Соединение 82
	A83	Соединение 83
	A84	Соединение 84
30	A85	Соединение 85
	A86	Соединение 86
	A87	Соединение 87
	A88	Соединение 88
	A89	Соединение 89
	A90	Соединение 90
35	A91	Соединение 91
	A92	Соединение 92
	A93	Соединение 93
	A94	Соединение 94

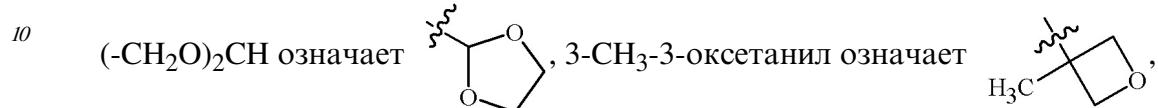
Предпочтительными для лучшего контроля нежелательной растительности

40 (например, меньшая рабочая концентрация, как, например, в результате синергизма, более широкий спектр контролируемых сорняков или повышенная безопасность для сельскохозяйственной культуры) или для предотвращения развития устойчивых сорняков являются смеси соединения по настоящему изобретению с гербицидом, выбранным из группы, состоящей из хлоримурон-етида, никосульфуриона, мезотриона, тифенсульфурон-45 метила, флупирсульфурон-метида, трибенуриона, пироксасульфона, пиноксадена, темботриона, пироксулама, метолахлора и *S*-метолахлора.

Следующие тесты демонстрируют эффективность контроля, характерную для соединений по настоящему изобретению в отношении конкретных сорняков. Контроль

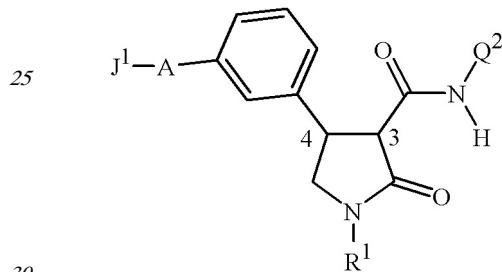
сорняков, обеспечиваемый соединениями, тем не менее, не ограничивается этими видами. См. таблицы индексов А для описаний соединений. Далее приведены сокращения, применяемые в следующих таблицах индексов: *t* означает третичный, *s* означает вторичный, *n* означает нормальный, *i* означает изо, *c* означает цикло, *Me* означает

5 метил, *Et* означает этил, *Pr* означает пропил, *i-Pr* означает изопропил, *Bu* означает бутил, *c-Pr* означает циклопропил, *t-Bu* означает *трет*-бутил, *Ph* означает фенил, *OMe* означает метокси, *OEt* означает этокси, *SMe* означает метилтио, *SEt* означает этилтио, *-CN* означает циано, *-NO<sub>2</sub>* означает нитро, *TMS* означает триметилсилил,



а нафтил означает нафтилил. *(R)* или *(S)* обозначает абсолютную хиральность асимметричного углеродного центра. Сокращение "d" указывает на то, что соединение, 15 по-видимому, разлагается при плавлении. Сокращение "№ соед." обозначает "№ соединения". Сокращение "Прим." обозначает "пример", и после него следует число, указывающее, в каком примере получено соединение. Масс-спектры представлены с предполагаемой точностью в пределах  $\pm 0,5$  Да в виде молекулярной массы исходного иона (M+1) с самой высокой распространенностью изотопа, образованного добавлением 20  $\text{H}^+$  (молекулярная масса 1) к молекуле, отслеживаемой с применением химической ионизации при атмосферном давлении (AP+).

#### ТАБЛИЦА ИНДЕКСОВ А



№ соед.	J <sup>1</sup>	A ***	Q <sup>2</sup>	R <sup>1</sup>	т.пл. (°C)	M-1	M+1
1	2-фуранил	-CH <sub>2</sub> O-	Ph(2-Cl)	H			411
2	2-фуранил	-CH <sub>2</sub> O-	Ph(2-CF <sub>3</sub> )	H			445
3	c-Pr-CH <sub>2</sub>	-O-	Ph(2,4-ди-F)	H			387
4	c-Pr-CH <sub>2</sub>	-O-	Ph(2-Cl)	H			385
5	(-CH <sub>2</sub> O) <sub>2</sub> CH	-CH <sub>2</sub> O-	Ph(2-CF <sub>3</sub> )	H	60-64		451
6	(-CH <sub>2</sub> O) <sub>2</sub> CH	-CH <sub>2</sub> O-	Ph(2-Cl)	H	122-126		417
7	(-CH <sub>2</sub> O) <sub>2</sub> CH	-CH <sub>2</sub> O-	Ph(2,3-ди-F)	H	140-146		419
8	(-CH <sub>2</sub> O) <sub>2</sub> CH	-CH <sub>2</sub> O-	Ph(2-F)	H	113-116		401
9	2-фуранил	-CH <sub>2</sub> O-	Ph(2,3-ди-F)	H	138-142		413
10	2-фуранил	-CH <sub>2</sub> O-	Ph(2-F)	H			395
11	c-Pr-CH <sub>2</sub>	-O-	Ph(2-F)	H			369
12	c-Pr-CH <sub>2</sub>	-O-	Ph(2,3-ди-F)	H			387
13	3-CH <sub>3</sub> -3-оксетанил	-CH <sub>2</sub> O-	Ph(2,3-ди-F)	H			415
14	3-CH <sub>3</sub> -3-оксетанил	-CH <sub>2</sub> O-	Ph(2-F)	H			397
15	3-CH <sub>3</sub> -3-оксетанил	-CH <sub>2</sub> O-	Ph(2-CF <sub>3</sub> )	H			449
16	3-CH <sub>3</sub> -3-оксетанил	-CH <sub>2</sub> O-	Ph(2-Cl)	H			415
17	фенил	-OCH <sub>2</sub> -	Ph(2,3,4-три-F)	H			441

	18	фенил	-OCH <sub>2</sub> -	Ph(2-Cl)	H			421
	19	фенил	-OCH <sub>2</sub> -	Ph(2-F)	H			405
	20	фенил	-OCH <sub>2</sub> -	Ph(2,4-ди-F)	H			423
	21	фенил	-OCH <sub>2</sub> -	Ph(2,3-ди-F)	H			423
5	22	3-CF <sub>3</sub> -1 <i>H</i> -пиразол-1-ил	-CH <sub>2</sub> -	Ph(2,3,4-три-F)	H			483
	23	3-CF <sub>3</sub> -1 <i>H</i> -пиразол-1-ил	-CH <sub>2</sub> -	Ph(2-F)	H			447
	24	3-CF <sub>3</sub> -1 <i>H</i> -пиразол-1-ил	-CH <sub>2</sub> -	Ph(2,4-ди-F)	H			465
	25 (прим. 2)	3-CF <sub>3</sub> -1 <i>H</i> -пиразол-1-ил	-CH <sub>2</sub> -	Ph(2,3-ди-F)	H	**		465
	26	1 <i>H</i> -пиразол-1-ил	-CH <sub>2</sub> -	Ph(2,3,4-три-F)	H			415
	27	1 <i>H</i> -пиразол-1-ил	-CH <sub>2</sub> -	Ph(2-F)	H			379
10	28	1 <i>H</i> -пиразол-1-ил	-CH <sub>2</sub> -	Ph(2,4-ди-F)	H			397
	29	1 <i>H</i> -пиразол-1-ил	-CH <sub>2</sub> -	Ph(2-Cl)	H			395
	30	1 <i>H</i> -пиразол-1-ил	-CH <sub>2</sub> -	Ph(2,3-ди-F)	H			397
	31	1 <i>H</i> -1,2,4-триазол-1-ил	-CH <sub>2</sub> -	Ph(2-F)	H			380
	32	1 <i>H</i> -1,2,4-триазол-1-ил	-CH <sub>2</sub> -	Ph(2,3-ди-F)	H			398
	33	TMS	-C≡C-	Ph(2,3-ди-F)	H		411	
20	34 (прим. 1)	пиридин-2-ил	-O-	Ph(2-F)	H	*		
	35	пиридин-2-ил	-O-	Ph(2,4-ди-F)	H			428
	36 <sup>a</sup>	пиридин-2-ил(5-F)	-O-	Ph(2-F)	CH <sub>3</sub>	61-65		
	37 <sup>a</sup>	пиридин-2-ил(5-F)	-O-	Ph(2,3-ди-F)	H	174-178		
	38 <sup>a</sup>	пиридин-2-ил(5-F)	-O-	Ph(2,3-ди-F)	CH <sub>3</sub>	71-75		
	39 <sup>a</sup>	пиридин-2-ил(5-F)	-O-	Ph(2-F)	H	76-79		
25	40	CF <sub>3</sub> OCHF-	-CF <sub>2</sub> O-	Ph(2-F)	H	129-131		
	41	CF <sub>3</sub> OCHF-	-CF <sub>2</sub> O-	Ph(2-F)	CH <sub>3</sub>	110-113		
	42	пиридин-2-ил	-O-	Ph(2,3,4-три-F)	H			428
	43 <sup>a</sup>	пиридин-2-ил(5-CF <sub>3</sub> )	-O-	Ph(2-F)	CH <sub>3</sub>	56-60		
	44 <sup>a</sup>	пиридин-2-ил(5-CF <sub>3</sub> )	-O-	Ph(2,3-ди-F)	CH <sub>3</sub>	64-68		
	45 <sup>a</sup>	Ph(4-F)	-O-	Ph(2-F)	CH <sub>3</sub>			423
30	46 <sup>a</sup>	Ph(4-F)	-O-	Ph(2,3-ди-F)	CH <sub>3</sub>			441
	47 <sup>a</sup>	пиридин-2-ил(5-CF <sub>3</sub> )	-O-	Ph(2,3-ди-F)	H	76-79		
	48	CF <sub>3</sub> OCHF-	-CF <sub>2</sub> O-	Ph(2,3-ди-F)	CH <sub>3</sub>			513
	49 <sup>a</sup>	пиридин-2-ил(5-F)	-O-	Ph(2-F)	H	140-144		
	50 <sup>a</sup>	фенил	-S-	Ph(2-F)	CH <sub>3</sub>			421
	51 <sup>a</sup>	фенил	-S-	Ph(2,3-ди-F)	CH <sub>3</sub>			439
35	52 <sup>a</sup>	пиридин-2-ил(5-F)	-O-	Ph(2,3-ди-F)	H	185-190		
	55	пиридин-2-ил(5-Cl)	-O-	Ph(2-F)	H			427
	56	пиридин-2-ил(5-Cl)	-O-	Ph(2,3-ди-F)	H			445
	60 <sup>a</sup>	пиридин-2-ил(5-F)	-O-	Ph(2-F)	CH <sub>3</sub>			424
	61 <sup>a</sup>	пиридин-2-ил(5-F)	-O-	Ph(2,3-ди-F)	CH <sub>3</sub>			442
	62 <sup>a</sup>	пиридин-2-ил(5-CF <sub>3</sub> )	-O-	Ph(2-F)	H	67-70		
40	63	фенил	-CH <sub>2</sub> O-	Ph(2-F)	H			405
	64	фенил	-CH <sub>2</sub> O-	Ph(2,4-ди-F)	H			423
	65	фенил	-CH <sub>2</sub> O-	Ph(2,3-ди-F)	H			423
	66	фенил	-CH <sub>2</sub> O-	Ph(2,3,4-три-F)	H			441
	67	фенил	-CH <sub>2</sub> O-	Ph(2-Cl)	H			421
	68	пиридин-2-ил	-O-	Ph(2,3-ди-F)	H		408	

69	пиридин-2-ил	-O-	Ph(2-Cl)	H			408
70 <sup>a</sup>	фенил	-CH=CH-	Ph(2,3-ди-F)	H	150-153		
71 <sup>a</sup>	пиридин-2-ил(3,5-ди-F)	-O-	Ph(2,3-ди-F)	H			446
72 <sup>a</sup>	пиридин-2-ил(3,5-ди-F)	-O-	Ph(2-F)	CH <sub>3</sub>			442
73 <sup>a</sup>	пиридин-2-ил(3,5-ди-F)	-O-	Ph(2,3-ди-F)	CH <sub>3</sub>			460
74 <sup>a</sup>	пиридин-2-ил(3,5-ди-F)	-O-	Ph(2,3,4-три-F)	CH <sub>3</sub>			478
75 <sup>a</sup>	фенил	-CH=CH-	Ph(2-F)	CH <sub>3</sub>			415
76 <sup>a</sup>	фенил	-CH=CH-	Ph(2,3-ди-F)	CH <sub>3</sub>			433
77 <sup>a</sup>	фенил	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	Ph(2,3-ди-F)	CH <sub>3</sub>			435
78 <sup>a</sup>	фенил	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	Ph(2,3-ди-F)	H			421
79 <sup>a</sup>	фенил	-CH=CH-	Ph(2-SCH <sub>3</sub> )	CH <sub>3</sub>	171-175		
80 <sup>a</sup>	пиридин-2-ил(5-CH <sub>3</sub> )	-O-	Ph(2,3-ди-F)	H			425
81 <sup>a</sup>	пиридин-2-ил(5-CH <sub>3</sub> )	-O-	Ph(2-F)	CH <sub>3</sub>	71-72		
82 <sup>a</sup>	пиридин-2-ил(5-CH <sub>3</sub> )	-O-	Ph(2,3-ди-F)	CH <sub>3</sub>	70-71		
83 <sup>a</sup>	пиридин-2-ил(5-CH <sub>3</sub> )	-O-	Ph(2,3,4-три-F)	CH <sub>3</sub>			457
87 <sup>a</sup> (Прим. 4)	пиридин-2-ил(5-F)	-O-	Ph(2,3,4-три-F)	CH <sub>3</sub>			460
88 <sup>a</sup>	пиридин-2-ил(5-F)	-O-	Ph(3-CN,2-F)	CH <sub>3</sub>			449
89 <sup>a</sup>	пиридин-2-ил(5-F)	-O-	Ph(2-CN,3-F)	CH <sub>3</sub>			449
90 <sup>a</sup>	N-морфолинил	-CH <sub>2</sub> -	Ph(2,3-ди-F)	H			416
91 <sup>a</sup>	фенил	-NH-	Ph(2,3,4-три-F)	CH <sub>3</sub>			440
92 <sup>a</sup>	тиазол-2-ил	-O-	Ph(2-F)	CH <sub>3</sub>			412
93 <sup>a</sup>	тиазол-2-ил	-O-	Ph(2,3-ди-F)	CH <sub>3</sub>			430
94 <sup>a</sup>	тиазол-2-ил	-O-	Ph(2,3,4-три-F)	CH <sub>3</sub>			448

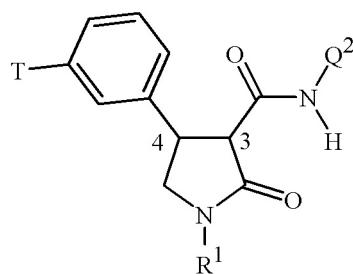
\* см. пример синтеза 1 для данных <sup>1</sup>H ЯМР.

\*\* см. пример синтеза 2 для данных <sup>1</sup>H ЯМР.

\*\*\* свободная связь, направленная вправо, указывает на точку соединения A с Q<sup>1</sup> (т. е. с фенилом), и свободная связь, направленная влево, указывает на точку соединения A с J<sup>1</sup>.

<sup>a</sup> указывает на то, что соединение получают энантиообогащенным по положениям 3 и 4.

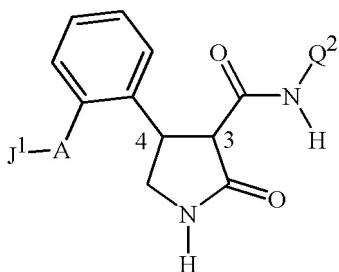
#### ТАБЛИЦА ИНДЕКСОВ В



№ соед.	T	Q <sup>2</sup>	R <sup>1</sup>	т.пл. (°C)
53 (прим. 3)	-CH=N-OCH <sub>3</sub>	Ph(2-F)	CH <sub>3</sub>	113-117

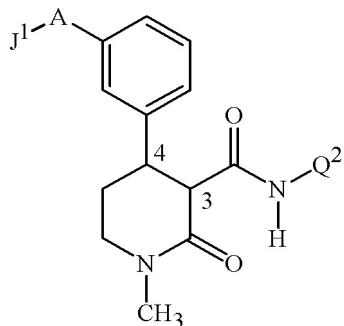
54	-CH=N-N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Ph(2-F)	CH <sub>3</sub>	107-110
----	--	---------	-----------------	---------

## ТАБЛИЦА ИНДЕКСОВ С



№ соед.	J <sup>1</sup>	A	Q <sup>2</sup>	т.пл. (°C)
57	3-CF <sub>3</sub> -1H-пиразол-1-ил	-CH <sub>2</sub> -	Ph(2,3-ди-F)	170-174
58	3-CF <sub>3</sub> -1H-пиразол-1-ил	-CH <sub>2</sub> -	Ph(2,3,4-три-F)	127-130
15 59	3-CF <sub>3</sub> -1H-пиразол-1-ил	-CH <sub>2</sub> -	Ph(2-F)	130-134

## ТАБЛИЦА ИНДЕКСОВ D



№ соед.	J <sup>1</sup>	A	Q <sup>2</sup>	т.пл. (°C)
84 <sup>a</sup>	пириимидин-2-ил(5-F)	-O-	Ph(2-F)	71-72
85 <sup>a</sup>	пириимидин-2-ил(5-F)	-O-	Ph(2,3-ди-F)	70-71
30 86 <sup>a</sup>	пириимидин-2-ил(5-F)	-O-	Ph(3-Cl,2-F)	65-66

<sup>a</sup> указывает на то, что соединение получают энантиообогащенным по положениям 3 и 4.

## БИОЛОГИЧЕСКИЕ ПРИМЕРЫ ИЗОБРЕТЕНИЯ

## ТЕСТ А

Семена видов растений, выбранных из ежовника обыкновенного (*Echinochloa crus-galli*), кохии (*Kochia scoparia*), амброзии (амброзии полыннолистной, *Ambrosia elatior*), многоцветкового плевела (*Lolium multiflorum*), гигантского щетинника (*Setaria faberii*) и амаранта (*Amaranthus retroflexus*), высаживали в смесь суглинистой почвы и песка и обрабатывали до появления всходов направленным распылением на почву с использованием тестируемых химических продуктов, составленных в смешанном нефитотоксичном растворителе, который содержал поверхностно-активное вещество.

Вместе с тем, растения, выбранные из этих видов сорняков, а также лисохвоста мышехвостниковоидного (*Alopecurus myosuroides*), подмаренника (подмаренника цепкого, *Galium aparine*), пшеницы (*Triticum aestivum*) и кукурузы (*Zea mays*) высаживали в горшки, содержащие ту же смесь суглинистой почвы и песка, и обрабатывали путем послевсходового внесения тестируемых химических продуктов, составленных таким же образом. В случае послевсходовой обработки растения располагали в порядке по

высоте от 2 до 10 см и они находились на стадии развития, характеризующейся наличием одного-двух листьев. Обработанные растения и необработанные контроли поддерживали в теплице в течение примерно 10 дней, после чего все обработанные растения сравнивали с необработанными контролями и визуально оценивали в 5 отношении повреждения. Оценки реакции растений, кратко изложенные в таблице А, основаны на шкале от 0 до 100, где 0 означает отсутствие эффекта, а 100 означает полный контроль. Тире (-) означает отсутствие результатов теста.

Таблица А Соединения

500 г а.и./га 1 2 3 4 5 6 7 8 9 10 11 12 13 14

10 После появления всходов

Ежовник обыкновенный 0 0 60 80 20 70 70 70 60 60 90 90 60 60

Лисохвост мышехвостниковидный 0 0 30 40 0 20 40 20 0 0 40 60 20 0

Кукуруза 0 0 20 0 0 20 20 20 0 20 60 0 0

Щетинник гигантский 0 10 70 80 50 70 70 50 30 90 90 70 70

15 Подмаренник 0 0 40 0 0 0 40 0 0 0 30 50 40 0

Кохия 0 0 40 0 0 0 0 0 0 0 20 20 0

Амарант 0 0 0 30 0 0 0 0 0 0 20 20 0 0

Амброзия 30 0 0 40 0 0 20 10 0 0 40 30 0 0

Плевел многоцветковый 0 10 30 40 20 0 20 0 0 0 20 50 30 0

20 Пшеница 0 0 20 0 0 20 40 0 0 0 20 50 0 0

Таблица А Соединения

500 г а.и./га 15 16 17 18 19 20 21 22 23 24 25 26 27 28

После появления всходов

Ежовник обыкновенный 0 50 40 20 50 70 20 60 30 0 60 70 70 20

25 Лисохвост мышехвостниковидный 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0

Кукуруза 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0

Щетинник гигантский 20 20 40 0 40 60 30 60 20 0 60 60 50 20

Подмаренник 0 0 30 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0

Кохия 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0

30 Амарант 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0

Амброзия 30 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0

Плевел многоцветковый 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0

Пшеница 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0

Таблица А Соединения

35 500 г а.и./га 29 30 31 32 33 34 35 36 37 38 39 40 41 42

После появления всходов

Ежовник обыкновенный 20 60 0 10 50 60 60 90 100 100 100 40 50 60

Лисохвост мышехвостниковидный 0 0 0 0 20 0 50 70 70 40 30 30 0

Кукуруза 0 0 0 0 0 0 90 90 100 70 0 40 0

40 Щетинник гигантский 20 50 0 20 50 80 70 80 90 90 80 60 70 70

Подмаренник 0 0 20 40 20 50 0 70 70 30 40 60 30

Кохия 0 0 0 40 0 0 50 50 60 0 60 0

Амарант 0 0 0 0 0 0 50 70 70 20 0 80 0

Амброзия 0 0 0 0 0 0 40 70 80 30 0 0 0

45 Плевел многоцветковый 0 0 0 0 0 30 30 50 60 80 20 0 20 0

Пшеница 0 0 0 0 0 0 60 70 70 60 20 40 0

Таблица А Соединения

500 г а.и./га 43 44 45 46 47 48 49 50 51 52 53 54 55 56

	После появления всходов
	Ежовник обыкновенный 90 90 90 90 90 50 90 30 30 80 90 30 80 30
	Лисохвост мышехвостниковидный 50 50 30 30 20 0 40 0 0 40 20 0 0 0
	Кукуруза 80 80 50 50 80 40 40 20 30 70 0 0 0 0
5	Щетинник гигантский 80 80 80 80 80 90 70 40 90 90 20 80 60
	Подмаренник 80 80 60 70 70 60 70 40 50 60 30 0 30 20
	Кохия 60 60 60 60 70 0-30-0 0 0 0
	Амарант 50 80 60 70 70 90 20 30 0 60 0 0 0 0
	Амброзия 0 0 0 0 0 40 0 20 60 0 0 0 0
10	Плевел многоцветковый 30 30 30 30 40 50 0 30 60 0 0 30 0
	Пшеница 50 50 20 20 30 30 40 0 20 40 0 0 0 0
	Таблица А Соединения
	500 г а.и./га 57 58 59 60 61 62 63 64 65 66 67 68 69
	После появления всходов
15	Ежовник обыкновенный 60 60 30 90 80 90 0 0 0 0 40 20
	Лисохвост мышехвостниковидный 30 0 0 30 50 30 0 0 0 0 20 0
	Кукуруза 30 0 0 50 90 30 0 0 0 0 0 0
	Щетинник гигантский 70 60 20 90 90 90 0 0 0 0 60 30
	Подмаренник 20 20 0 60 70 60 0 0 0 0 0 0
20	Кохия 20 20 0 - - 0 0 0 0 0 0
	Амарант 20 0 0 40 70 30 0 0 0 0 0 0
	Амброзия 30 0 0 40 50 40 0 0 0 0 0 0
	Плевел многоцветковый 0 0 0 50 70 30 0 0 0 0 0 0
	Пшеница 0 0 0 70 80 30 0 0 0 0 0 0
25	Таблица А Соединения
	125 г а.и./га 1 2 3 4 5 6 7 8 9 10 11 12 13 14
	После появления всходов
	Ежовник обыкновенный 0 0 10 40 0 0 40 0 30 10 50 70 0 10
	Лисохвост мышехвостниковидный 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0
30	Кукуруза 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0
	Щетинник гигантский 0 0 20 40 20 0 20 0 0 0 50 70 40 10
	Подмаренник 0 0 20 0 0 0 20 0 0 0 0 0 0 0
	Кохия 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0
	Амарант 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0
35	Амброзия 0 0 0 0 0 0 0 0 0 30 30 0 0
	Плевел многоцветковый 0 0 0 0 20 0 0 0 0 0 0 20 0 0
	Пшеница 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0
	Таблица А Соединения
	125 г а.и./га 15 16 17 18 19 20 21 22 23 24 25 26 27 28
40	После появления всходов
	Ежовник обыкновенный 0 0 30 0 20 40 20 40 0 0 20 30 40 0
	Лисохвост мышехвостниковидный 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0
	Кукуруза 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0
	Щетинник гигантский 10 0 30 0 20 40 30 20 0 0 20 30 40 0
45	Подмаренник 0 0 50 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0
	Кохия 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0
	Амарант 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0
	Амброзия 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0

Плевел многоцветковый 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0  
 Пшеница 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0  
 Таблица А Соединения  
 125 г а.и./га 29 30 31 32 33 34 35 36 37 38 39 40 41 42  
 5 После появления всходов  
 Ежовник обыкновенный 0 20 0 0 0 30 30 90 90 100 70 50 50 40  
 Лисохвост мышехвостниковидный 0 0 0 0 0 0 0 20 40 70 0 0 0 0  
 Кукуруза 0 0 0 0 0 0 40 70 90 30 0 0 0  
 Щетинник гигантский 0 30 0 0 0 30 30 80 70 90 70 40 50 50  
 10 Подмаренник 0 0 0 0 0 20 0 40 50 50 0 40 40 0  
 Кохия 0 0 0 0 0 0 0 0 30 0 0 20 0  
 Амарант 0 0 0 0 0 0 30 40 50 0 0 40 0  
 Амброзия 0 0 0 0 0 0 0 20 20 0 0 0 0  
 Плевел многоцветковый 0 0 0 0 0 0 0 0 0 70 0 0 0 0  
 15 Пшеница 0 0 0 0 0 0 0 20 50 0 0 0 0  
 Таблица А Соединения  
 125 г а.и./га 43 44 45 46 47 48 49 50 51 52 53 54 55 56  
 После появления всходов  
 Ежовник обыкновенный 90 90 90 90 70 20 80 0 0 70 70 0 30 0  
 20 Лисохвост мышехвостниковидный 30 30 30 0 0 0 0 0 0 30 0 0 0 0  
 Кукуруза 40 40 0 40 20 0 30 0 0 50 0 0 0 0  
 Щетинник гигантский 80 70 80 70 60 60 70 50 10 70 80 0 70 0  
 Подмаренник 70 70 60 60 60 60 20 0 40 40 0 0 0 0  
 Кохия 40 30 40 40 0 30 0-0 0 0 0  
 25 Амарант 30 50 30 50 60 60 0 0 0 40 0 0 0 0  
 Амброзия 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0  
 Плевел многоцветковый 0 0 0 0 0 0 0 0 20 30 0 0 0 0  
 Пшеница 30 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0  
 Таблица А Соединения  
 30 125 г а.и./га 57 58 59 60 61 62 63 64 65 66 67 68 69 71  
 После появления всходов  
 Ежовник обыкновенный 0 0 0 70 70 70 0 0 0 0 0 10 0 70  
 Лисохвост мышехвостниковидный 0 0 0 40 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0  
 Кукуруза 30 0 0 30 70 30 0 0 0 0 0 0 20  
 35 Щетинник гигантский 40 30 0 80 90 80 0 0 0 0 0 0 0 70  
 Подмаренник 0 0 0 30 60 30 0 0 0 0 0 0 50  
 Кохия 0 0 0 - - 0 0 0 0 0 0 0 20  
 Амарант 0 0 0 0 40 0 0 0 0 0 0 0 0 50  
 Амброзия 0 0 0 0 40 0 0 0 0 0 0 0 0 30  
 40 Плевел многоцветковый 0 0 0 30 70 0 0 0 0 0 0 0 0 0  
 Пшеница 0 0 0 0 50 0 0 0 0 0 0 0 0 0  
 Таблица А Соединения  
 125 г а.и./га 72 73 74 87 88 89 90  
 После появления всходов  
 45 Ежовник обыкновенный 90 70 90 80 80 70 0  
 Лисохвост мышехвостниковидный 60 40 20 60 0 20 0  
 Кукуруза 20 20 20 90 20 0 0  
 Щетинник гигантский 90 90 80 80 70 70 0

	Подмаренник 60 60 70 60 40 40 0
	Кохия 20 20 50 30 30 0 0
	Амарант 30 60 60 70 20 50 0
	Амброзия 30 30 20 0 0 0 0
5	Плевел многоцветковый 50 40 30 70 0 20 0
	Пшеница 20 20 20 40 60 0 0
	Таблица А Соединения
	31 г а.и./га 71 72 73 74 87 88 89 90
	После появления всходов
10	Ежовник обыкновенный 30 60 60 60 50 30 30 0
	Лисохвост мышехвостниковидный 0 20 0 0 30 0 0 0
	Кукуруза 0 0 20 0 60 0 0 0
	Щетинник гигантский 20 80 60 70 70 30 30 0
	Подмаренник 30 40 50 40 30 30 30 0
15	Кохия 0 0 0 20 0 0 0 0
	Амарант 0 0 50 0 0 0 0 0
	Амброзия 0 0 0 0 0 0 0 0
	Плевел многоцветковый 0 20 0 0 40 0 0 0
	Пшеница 0 0 20 0 0 0 0 0
20	Таблица А Соединения
	500 г а.и./га 1 2 3 4 5 6 7 8 9 10 11 12 13 14
	До появления всходов
	Ежовник обыкновенный 0 30 70 90 50 80 90 80 70 0 90 90 80 80
	Щетинник гигантский 0 20 80 90 90 90 90 90 70 0 90 90 90 90
25	Кохия 0 0 20 30 0 0 0 0 0 40 40 0 0
	Амарант 0 0 0 20 30 50 60 0 0 0 30 30 0 0
	Амброзия 0 0 0 0 0 20 0 0 0 0 0 0 0 0
	Плевел многоцветковый 0 0 20 20 0 0 30 0 0 0 20 20 0 0
	Таблица А Соединения
30	500 г а.и./га 15 16 17 18 19 20 21 22 23 24 25 26 27 28
	До появления всходов
	Ежовник обыкновенный 60 60 70 0 70 70 40 30 20 0 40 90 20 30
	Щетинник гигантский 40 70 80 20 80 80 60 80 50 0 80 90 30 30
	Кохия 0 0 30 0 40 30 20 0 20 0 20 0 0 0
35	Амарант 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0
	Амброзия 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0
	Плевел многоцветковый 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0
	Таблица А Соединения
	500 г а.и./га 29 30 31 32 33 34 35 36 37 38 39 40 41 42
40	До появления всходов
	Ежовник обыкновенный 40 50 0 0 80 90 60 90 90 100 90 90 90 80
	Щетинник гигантский 40 90 0 40 80 90 90 90 100 100 90 90 90 90
	Кохия 0 0 0 0 0 0 40 70 70 50 90 60 0
	Амарант 0 0 0 0 0 0 40 80 100 0 0 90 10
45	Амброзия 0 0 0 0 0 0 50 80 80 50 20 70 0
	Плевел многоцветковый 0 0 0 0 0 0 90 50 100 60 0 60 0
	Таблица А Соединения
	500 г а.и./га 43 44 45 46 47 48 49 50 51 52 53 54 55 56

До появления всходов  
 Ежовник обыкновенный 80 80 80 80 80 90 90 40-90 90 20 80 70  
 Щетинник гигантский 90 90 90 90 90 90 90 90 90 90 70 90 0  
 Кохия 30 0 20 20 0 20 70 30 50 80 70 0 20 0  
<sup>5</sup> Амарант 80 80 70 70 50 70 20 20 0 70 0 0 0 0  
 Амброзия 80 60 30 30 60 0 40 30 0 80 0 0 0 0  
 Плевел многоцветковый 80 90 80 80 70 30 70 0 20 40 0 0 20 0  
 Таблица А Соединения  
 500 г а.и./га 57 58 59 60 61 62 63 64 65 66 67 68 69

10 До появления всходов  
 Ежовник обыкновенный 90 90 40 90 90 90 0 0 0 0 0 50 0  
 Щетинник гигантский 90 90 50 90 90 90 0 0 0 0 0 90 50  
 Кохия 0-0 80 80 60 0 0 0 0 0 0 0  
 Амарант 0 0 0 50 90 50 0 0 0 0 0 0 0  
<sup>15</sup> Амброзия 0 0 0 50 60 50 0 0 0 0 0 0 0  
 Плевел многоцветковый 0 20 0 70 90 20 0 0 0 0 0 0 0  
 Таблица А Соединения  
 125 г а.и./га 1 2 3 4 5 6 7 8 9 10 11 12 13 14

До появления всходов  
<sup>20</sup> Ежовник обыкновенный 0 0 40 60 0 20 60 50 10 0 60 90 0 10  
 Щетинник гигантский 0 0 60 70 30 70 90 80 10 0 80 90 80 30  
 Кохия 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0  
 Амарант 0 0 0 0 60 60 0 0 0 0 0 0 0  
 Амброзия 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0  
<sup>25</sup> Плевел многоцветковый 0 0 0 0 0 0 30 0 0 0 0 0 0 0  
 Таблица А Соединения  
 125 г а.и./га 15 16 17 18 19 20 21 22 23 24 25 26 27 28

До появления всходов  
<sup>30</sup> Ежовник обыкновенный 0 0 20 0 30 20 0 0 0 0 20 40 0 0  
 Щетинник гигантский 10 10 50 0 30 30 20 40 20 0 50 40 20 0  
 Кохия 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0  
 Амарант 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0  
 Амброзия 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0  
 Плевел многоцветковый 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0  
<sup>35</sup> Таблица А Соединения  
 125 г а.и./га 29 30 31 32 33 34 35 36 37 38 39 40 41 42

До появления всходов  
 Ежовник обыкновенный 0 0 0 0 60 20 20 90 90 90 70 50 20 40  
 Щетинник гигантский 0 20 0 0 60 70 70 90 90 100 90 90 80 80  
<sup>40</sup> Кохия 0 0 0 0 0 0 0 0 30 30 0 30 0  
 Амарант 0 0 0 0 0 0 0 60 80 0 0 70 0  
 Амброзия 0 0 0 0 0 0 0 40 0 0 20 0  
 Плевел многоцветковый 0 0 0 0 0 0 0 0 20 80 0 0 20 0  
 Таблица А Соединения  
<sup>45</sup> 125 г а.и./га 43 44 45 46 47 48 49 50 51 52 53 54 55 56

До появления всходов  
 Ежовник обыкновенный 80 80 80 70 50 80 90 0 20 70 90 0 0 30  
 Щетинник гигантский 90 90 90 90 80 90 90 90 90 90 90 0 80 0

- Кохия 30 0 0 0 0 20 0 20 70 60 0 0 0  
 Амарант 40 30 40 40 0 70 0 20 0 60 0 0 0  
 Амброзия 0 0 0 0 0 0 0 0 40 0 0 0  
 Плевел многоцветковый 30 30 30 20 0 30 40 0 0 30 0 0 0  
 5 Таблица А Соединения  
 125 г а.и./га 57 58 59 60 61 62 63 64 65 66 67 68 69 71  
 До появления всходов  
 Ежовник обыкновенный 40 30 0 90 90 90 0 0 0 0 0 20 0 70  
 Щетинник гигантский 60 60 0 90 90 90 0 0 0 0 0 60 0 90  
 10 Кохия - 0 0 70 60 30 0 0 0 0 0 0 30  
 Амарант 0 0 0 60 70 30 0 0 0 0 0 0 80  
 Амброзия 0 0 0 40 30 0 0 0 0 0 0 0 0  
 Плевел многоцветковый 0 0 0 20 80 0 0 0 0 0 0 0 0 0  
 Таблица А Соединения  
 15 125 г а.и./га 72 73 74 87 88 89 90  
 До появления всходов  
 Ежовник обыкновенный 90 90 90 90 30 70 0  
 Щетинник гигантский 90 90 100 90 90 90 0  
 Кохия 0 20 40 60 30 0 0  
 20 Амарант 0 0 80 70 20 60 0  
 Амброзия 0 0 0 0 0 0  
 Плевел многоцветковый 50 40 80 80 20 40 0  
 Таблица А Соединения  
 31 г а.и./га 71 72 73 74 87 88 89 90  
 25 До появления всходов  
 Ежовник обыкновенный 0 90 50 70 60 0 30 0  
 Щетинник гигантский 70 90 80 90 90 30 40 0  
 Кохия 0 0 0 0 0 0 0  
 Амарант 20 0 0 0 70 0 0 0  
 30 Амброзия 0 0 0 0 0 0 0  
 Плевел многоцветковый 0 0 0 30 0 0 0 0  
 ТЕСТ В  
 Виды растений в тесте с затоплением по типу рисового поля, выбранные из риса (*Oryza sativa*), съти, разнородной (мелкоцветной съти разнородной, *Cyperus difformis*),  
 35 гетерантеры илистой (*Heteranthera limosa*) и ежовника обыкновенного (*Echinochloa crus-galli*), выращивали до стадии, характеризующейся наличием 2 листьев, для тестирования. Во время обработки тестируемые горшки затапливали до уровня на 3 см выше поверхности почвы, обрабатывали путем внесения тестируемых соединений непосредственно в затопляющую воду, а затем поддерживали при такой толщине слоя  
 40 воды в течение периода теста. Обработанные растения и контроли поддерживали в теплице в течение 13-15 суток, после чего все виды сравнивали с контролями и визуально оценивали. Оценки реакции растений, кратко изложенные в таблице В, основаны на шкале от 0 до 100, где 0 представляет собой отсутствие эффекта и 100 представляет собой полный контроль. Тире (-) означает отсутствие результатов теста.  
 45 Таблица В Соединения  
 500 г а.и./га 22 23 24 25 34 35 42 63 64 65 66 67 68 69  
 Затопление  
 Ежовник обыкновенный 30 0 0 0 20 0 0 0 0 0 0 0 20 0

Гетерантера илистая 0 0 0 60 85 90 80 35 35 0 0 0 80 70

Рис 0 0 0 15 0 15 0 0 0 0 0 0 0

Сыть разнородная 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0

Таблица В Соединения

5 250 г а.и./га 1 2 4 5 6 7 8 9 10 11 12 14 15 16

Затопление

Ежовник обыкновенный 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0

Гетерантера илистая 65 0 0 65 0 75 35 30 60 0 20 70 50 30

Рис 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0

10 Сыть разнородная 30 0 0 0 0 0 0 30 40 0 0 20 0 30

Таблица В Соединения

250 г а.и./га 33 36 37 38 39 40 41 43 44 45 46 47 48 49

Затопление

Ежовник обыкновенный 0 60 30 60 0 20 0 50 40 40 0 0 0 0

15 Гетерантера илистая 50 0 100 80 75 70 100 98 90 70 30 0 80 100

Рис 0 30 20 0 0 0 20 15 0 15 0 0 0 0

Сыть разнородная 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0

Таблица В Соединения

250 г а.и./га 50 51 52 53 54 57 58 59 60 61 62 87 88 89

20 Затопление

Ежовник обыкновенный 0 0 40 30 0 0 0 0 65 40 40 60 0 0

Гетерантера илистая 70 40 100 70 0 0 0 100 100 100 85 50 70

Рис 0 0 0 0 0 0 0 0 20 0 0 0

Сыть разнородная 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0

25 Таблица В Соединение

250 г а.и./га 90

Затопление

Ежовник обыкновенный 0

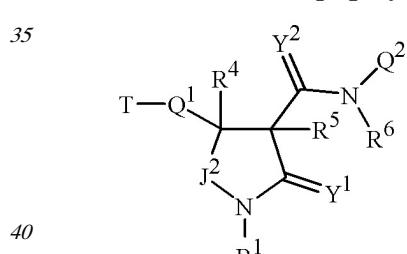
Гетерантера илистая 0

30 Рис 0

Сыть разнородная 0

(57) Формула изобретения

1. Соединение формулы 1:



1

где

45  $Q^1$  представляет собой фенильное кольцо или нафталинильную кольцевую систему, причем каждое кольцо или кольцевая система необязательно замещены 1-4 заместителями, независимо выбранными из  $R^7$ ;

$Q^2$  представляет собой фенильное кольцо или нафталинильную кольцевую систему,

причем каждое кольцо или кольцевая система необязательно замещены не более 5 заместителями, независимо выбранными из  $R^{10}$ ;

Т представляет собой  $J^1$ -А-, при этом свободная связь, направленная вправо, рядом

5 с А указывает на точку соединения  $J^1$ -А- с  $Q^1$ ; или

Т представляет собой  $R^{17}ON=CR^{17a}$ - или  $(R^{19})_2NN=CR^{17a}$ -, при этом свободная связь,

направленная вправо, указывает на точку соединения с  $Q^1$ ;

А представляет собой насыщенную, частично ненасыщенную или полностью

10 ненасыщенную цепь, содержащую 1-3 атома, выбранных из не более 3 атомов углерода, не более 1 атома О, не более 1 атома S и не более 2 атомов N, причем цепь необязательно замещена не более 2 заместителями, независимо выбранными из  $R^{15}$  при атомах углерода;

15 каждый из  $Y^1$  и  $Y^2$  представляет собой О;

$J^1$  представляет собой фенильное кольцо или нафталинильную кольцевую систему, причем каждое кольцо или кольцевая система необязательно замещены не более 5

заместителями, независимо выбранными из  $R^7$ ; или 4-6-членное гетероциклическое кольцо, причем каждое кольцо содержит члены кольца, выбранные из атомов углерода

20 и 1-4 гетероатомов, независимо выбранных из не более 2 атомов О, не более 2 атомов S и не более 4 атомов N, причем каждое кольцо необязательно замещено не более 5 заместителями, независимо выбранными из  $R^7$  при членах кольца, представляющих собой атом углерода; или  $C_4-C_{10}$ циклоалкилкил,  $C_2-C_8$ алкоксиалкокси,

25  $C_2-C_8$ алкоксиалкил,  $C_2-C_8$ галогеналкоксиалкил,  $C_2-C_8$ галогеналкоксигалогеналкил, или триметилсилил;

$J^2$  представляет собой  $-CR^2R^3$ - или  $-CR^2R^3-CR^{2a}R^{3a}$ -, где фрагмент  $-CR^2R^3$ - соединен с N;

30  $R^1$  представляет собой Н или  $C_1-C_6$ алкил;

каждый из  $R^2$  и  $R^3$  представляет собой Н;

каждый из  $R^{2a}$  и  $R^{3a}$  представляет собой Н;

каждый из  $R^4$  и  $R^5$  представляет собой Н;

35  $R^6$  представляет собой Н;

каждый  $R^7$  независимо представляет собой галоген или  $CF_3$ ;

каждый  $R^{10}$  независимо представляет собой галоген, циано,  $C_1-C_8$ галогеналкил или  $C_1-C_8$ алкилтио; или

40 каждый  $R^{7'}$  независимо представляет собой галоген,  $C_1-C_8$ алкил или  $C_1-C_8$ галогеналкил;

каждый  $R^{15}$  независимо представляет собой галоген;

45 каждый  $R^{17}$  независимо представляет собой  $C_1-C_6$ алкил;

каждый  $R^{17a}$  независимо представляет собой Н; и

каждый  $R^{19}$  независимо представляет собой  $C_1-C_6$ алкил

при условии, что если

a)  $J^1$  представляет собой незамещенное фенильное кольцо, A является отличным от  $-CH_2-$ ,  $-O-$ ,  $-C\equiv C-$ ,  $-C(=O)-$  или  $-SO_2-$ ; или

5 b)  $J^1$  представляет собой незамещенное пиридинильное кольцо, A является отличным от  $-CH_2-$ ;

c)  $J^1$  представляет собой  $C_4-C_{10}$ циклоалкилалкил, A является отличным от алкила;

или

10 d)  $J^1$ -A- находится в пара-положении  $Q^1$ , A является отличным от O, а  $J^1$  является отличным от 2-фуранилметила.

2. Соединение по п. 1, где

$Q^1$  представляет собой фенильное кольцо, необязательно замещенное 1-4 заместителями, независимо выбранными из  $R^7$ ;

15  $Q^2$  представляет собой фенильное кольцо, необязательно замещенное не более 5 заместителями, независимо выбранными из  $R^{10}$ ;

20  $J^1$  представляет собой фенильное кольцо, необязательно замещенное не более 5 заместителями, независимо выбранными из  $R^7$ ; или 4-6-членное гетероциклическое кольцо, содержащее члены кольца, выбранные из атомов углерода и 1-4 гетероатомов, независимо выбранных из не более 2 атомов O, не более 2 атомов S и не более 4 атомов N, необязательно замещенное не более 5 заместителями, независимо выбранными из  $R^7$  при членах кольца, представляющих собой атом углерода;

25 А представляет собой  $-CH_2-$ ,  $-CH_2O-$ ,  $-CH=CH-$ ,  $-NH-$ ,  $-O-$ ,  $-S-$ ,  $-CH_2CH_2$  или  $OCH_2$ ; и

каждый  $R^7$  независимо представляет собой F или  $CF_3$ .

3. Соединение по п. 1, где

30  $Q^1$  представляет собой фенильное кольцо, незамещенное  $R^7$ ;

$Q^2$  представляет собой фенильное кольцо, необязательно замещенное 1-5 заместителями, независимо выбранными из  $R^{10}$ ; и

35  $J^1$  представляет собой фенильное кольцо, необязательно замещенное не более 4 заместителями, независимо выбранными из  $R^7$ .

4. Соединение по п. 3, где

А представляет собой  $-CH_2-$ ,  $-CH_2O-$ ,  $-CH=CH-$ ,  $-NH-$ ,  $-O-$  или  $-S-$ ; и

каждый  $R^{10}$  независимо представляет собой галоген, циано или  $C_1-C_3$ галогеналкил.

40 5. Соединение по п. 1, где

$Q^1$  представляет собой фенильное кольцо или нафтилинильную кольцевую систему, причем каждое кольцо или кольцевая система необязательно замещены 1-4 заместителями, независимо выбранными из  $R^7$ ;

45  $Q^2$  представляет собой фенильное кольцо, необязательно замещенное 1-5 заместителями, независимо выбранными из  $R^{10}$ ; и  $J^1$  представляет собой 4-6-членное гетероциклическое кольцо, содержащее члены кольца, выбранные из атомов углерода

и 1-3 гетероатомов, независимо выбранных из не более 2 атомов О, не более 2 атомов S и не более 3 атомов N, причем каждое кольцо необязательно замещено не более 3 заместителями, независимо выбранными из R<sup>7</sup> при членах кольца, представляющих собой атом углерода; и

<sup>5</sup> каждый R<sup>7</sup> независимо представляет собой F или CF<sub>3</sub>.

6. Соединение по п. 5, где

А представляет собой -CH<sub>2</sub>-, -CH<sub>2</sub>O- или -O-; и

<sup>10</sup> каждый R<sup>10</sup> независимо представляет собой галоген, циано или C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>галогеналкил.

7. Соединение по п. 1, выбранное из группы, состоящей из

N-(2,4-дифторфенил)-2-оксо-4-[3-(феноксиметил)фенил]-3-пирролидинкарбоксамида

и

<sup>15</sup> 2-оксо-4-[3-(2-пиридинилокси)фенил]-N-(2,3,4-трифторфенил)-3-пирролидинкарбоксамида.

8. Гербицидная композиция, содержащая соединение по п. 1 и по меньшей мере один компонент, выбранный из группы, состоящей из поверхностно-активных веществ, твердых разбавителей и жидких разбавителей.

<sup>20</sup> 9. Гербицидная композиция, содержащая соединение по п. 1, по меньшей мере один дополнительный активный ингредиент, выбранный из группы, состоящей из других гербицидов и антидотов гербицидов, и по меньшей мере один компонент, выбранный из группы, состоящей из поверхностно-активных веществ, твердых разбавителей и жидких разбавителей.

<sup>25</sup> 10. Способ контроля роста нежелательной растительности, предусматривающий приведение в контакт растительности или окружающей ее среды с гербицидно эффективным количеством соединения по п. 1.

30

35

40

45