

(19)



Евразийское  
патентное  
ведомство

(21) 202390849 (13) A1

(12) ОПИСАНИЕ ИЗОБРЕТЕНИЯ К ЕВРАЗИЙСКОЙ ЗАЯВКЕ

(43) Дата публикации заявки  
2023.06.09

(51) Int. Cl. C07D 413/04 (2006.01)  
C07D 413/14 (2006.01)  
C07D 417/04 (2006.01)  
A01N 43/80 (2006.01)  
A01P 13/02 (2006.01)

(22) Дата подачи заявки  
2021.09.08

(54) ГЕРБИЦИДНЫЕ ПРОИЗВОДНЫЕ ПИРИМИДИНА

(31) 2014350.9

(72) Изобретатель:

(32) 2020.09.11

Хоулсби Иан, Аллен Бен (GB)

(33) GB

(74) Представитель:

(86) PCT/GB2021/052319

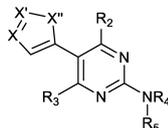
Нагорных И.М. (RU)

(87) WO 2022/053803 2022.03.17

(71) Заявитель:

МОА ТЕКНОЛОДЖИ ЛИМИТЕД  
(GB)

(57) Изобретение относится к применению соединений формулы (I) в качестве агрохимикатов, предпочтительно гербицидов, причем X, X', X'', R<sub>2</sub>, R<sub>3</sub>, R<sub>4</sub> и R<sub>5</sub> определены согласно настоящему документу. Изобретение также относится к агрохимическим композициям, содержащим соединения формулы (I), и к применению таких композиций для борьбы с сорняками в месте произрастания, в частности среди полезных сельскохозяйственных культур. Изобретение также относится к выбору соединений формулы (I).



202390849

A1

A1

202390849

## ГЕРБИЦИДНЫЕ ПРОИЗВОДНЫЕ ПИРИМИДИНА

### **Область техники**

Настоящее изобретение относится к применению гетероциклических производных в качестве агрохимикатов, например, гербицидов, и к соединениям некоторых новых гетероциклических производных. Оно также относится к агрохимическим композициям, которые могут быть получены с применением гетероциклических производных, и способу борьбы с сорняками в месте произрастания.

### **Уровень техники**

Наличие нежелательных растений, например сорняков, увеличивает потребность в ресурсах и фактически сокращает долю ресурсов, доступных для более полезных растений, таких как сельскохозяйственные культуры. Это, в свою очередь, снижает урожайность таких сельскохозяйственных культур, на которые влияет рост сорняков по соседству. Существуют самые разные растения, которые обычно считают сорняками в контексте выращивания сельскохозяйственных культур, в том числе широколиственные растения и злаки.

Помимо прямой конкуренции за ресурсы сорняки часто являются аллелопатическими, т. е. они продуцируют одно или более биохимических веществ (часто в виде вторичных метаболитов), которые способны влиять на прорастание, рост, выживание и размножение других организмов поблизости. В число таких организмов могут входить другие виды растений или могут входить виды животных. Процесс аллелопатии является ключевым элементом в распределении видов и конкуренции между ними, а также считается серьезным оружием в арсенале многих инвазивных видов. Аллелопатические сорняки могут быть способны подавлять рост культурных растений в большей степени, чем только из-за конкуренции за ресурсы.

Агрохимикаты, или сельскохозяйственные химикаты, представляют собой химикаты, используемые в сельскохозяйственных целях. Их классифицируют в зависимости от роли, для которой они используются, например, пестициды — для борьбы с вредителями, фунгициды — для борьбы с ростом грибов, удобрения — для повышения содержания питательных веществ в почве, в которой выращивают сельскохозяйственные культуры, или гербициды, которые используются для уничтожения нежелательной растительности.

Гербициды, в частности, могут быть селективными или неселективными. Первые представляют собой гербициды, предназначенные для применения вокруг желаемых растений/сельскохозяйственных культур и направленные на борьбу с сорняками без повреждения самого желаемого растения/сельскохозяйственной культуры. Последние представляют собой гербициды, которые не различают сорта растений, а вместо этого уничтожают всю растительность. Поэтому неселективные гербициды обычно не используют на полях сельскохозяйственных культур во время их роста.

Гербициды могут применяться различными путями и могут иметь различные механизмы действия. Их можно вносить в почву, чтобы они впитались корнями/побегами появляющихся всходов сорняков, или их можно наносить на листья существующих растений. Выбор пути также может определяться тем, является ли гербицид довсходовым (т. е. применяемым до появления всходов сорняков на поверхности) или послевсходовым (который применяют после появления всходов сорняков на поверхности почвы). Для каждого типа гербицида существуют конкретные факторы, которые необходимо учитывать в отношении способа применения и того, как добиться стойкости в почве.

Использование гербицидов должно быть тщательно продумано. Как правило, гербициды являются дорогостоящими веществами, и поэтому сведение к минимуму их использования экономически обосновано. Кроме того, использование гербицидов может оказать нежелательное воздействие на окружающую среду, например, приводить к загрязнению грунтовых вод, проблемам со здоровьем животных и человека, а также к развитию резистентных к гербицидам сорняков. Поэтому существует стимул свести к минимуму количество гербицидов, используемых в любой области, нуждающейся в борьбе с сорняками. Однако, это не всегда легко, поскольку развитие резистентности к существующим гербицидам требует использования все больших количеств гербицидов.

Урожаи сельскохозяйственных растений могут быть значительно снижены засорениями сорняками. Например, щирица колосистая, или *Amaranthus retroflexus*, является агрессивным и высококонкурентным сорняком при выращивании многих сельскохозяйственных культур. Ее неконтролируемый рост приводит к значительным потерям урожая сои, хлопка, кукурузы, сахарной свеклы, сорго и многих других культур (Weaver et al., «The biology of Canadian weeds. 44.

*Amaranthus retroflexus* L., *A. powellii* S. Wats. and *A. hybridus* L.», *Can. J. Plant. Sci.*, 1980, 60, 4, 1215-1234). Ущерб, причиняемый *A. retroflexus*, также не ограничен географией — действительно, сорняк присутствует по всему миру. Сообщалось, что *A. retroflexus* оказывает аллелопатическое действие на другие сорняки и культурные растения, еще больше снижая урожаи сельскохозяйственных культур. Она также причастна к нанесению ущерба домашнему скоту, например, способствуя накоплению вредных веществ (например, нитратов и оксалатов) в листьях и стеблях. Кроме того, известно, что *A. retroflexus* является дополнительным переносчиком целого ряда вредителей и болезней сельскохозяйственных культур, включая паразитические сорняки растений томатов (*Orobanche ramosa*), тлю в садах (*Myzus persicae*) и вирус огуречной мозаики на перцах (Weaver et al.). Многие сорняки, включая *A. retroflexus*, выработали резистентность к существующим гербицидам (Francischini, A., et al. «Multiple-and Cross-Resistance of *Amaranthus retroflexus* to Acetolactate Synthase (ALS) and Photosystem II (PSII) Inhibiting Herbicides in Preemergence». *Planta Daninha* 37 (2019).) Подобные проблемы и вопросы возникают с многими другими видами сорняков.

Соответственно, существует мощный стимул для разработки новых гербицидов, расширения диапазона имеющихся гербицидов и получения гербицидов с лучшими характеристиками, такими как лучшее гербицидное действие или меньшее воздействие на окружающую среду. Соединения и композиции согласно настоящему изобретению являются значительным шагом вперед в достижении этих целей.

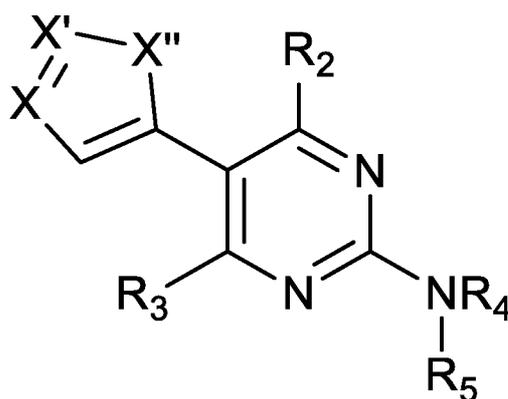
В WO 2018/019574 раскрыты используемые в качестве гербицидов гетероциклические производные, в которых со вторым гетероциклом связан пиримидин. В нем не раскрыты соединения согласно настоящему изобретению, в которых гетероцикл, присоединенный к пиримидину, не имеет замещенного углерода или азота в орто-положении (или альфа-положении) относительно точки присоединения пиримидина.

### **Раскрытие сущности изобретения**

Настоящее изобретение относится к гербицидно активным гетероциклическим производным. Изобретение также распространяется на гербицидные композиции, включающие такие производные, а также на применение таких соединений и

композиции для борьбы с нежелательным ростом растений, таких как сорняки, и способ связанный с таким применением.

В соответствии с первым аспектом в настоящем изобретении предложено применение соединения, которое определено в пункте 1 формулы изобретения общей формулой (I), или его приемлемой для сельского хозяйства соли в качестве агрохимиката, предпочтительно гербицида:



(I)

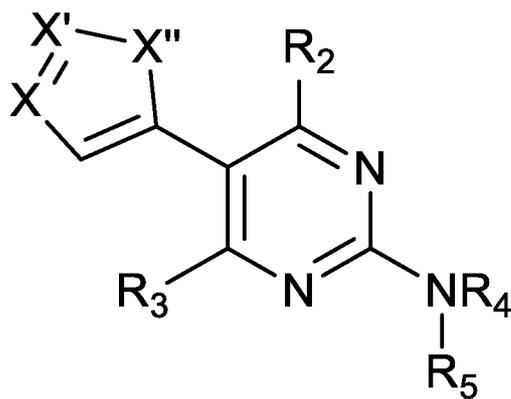
В соответствии со вторым аспектом в изобретении предложена агрохимическая композиция, предпочтительно гербицидная композиция, содержащая соединение согласно первому аспекту изобретения и приемлемый для сельского хозяйства адъювант для приготовления состава.

В соответствии с третьим аспектом в изобретении предложен способ борьбы с сорняками в месте произрастания, включающий применение в месте произрастания подавляющего сорняки количества композиции согласно второму аспекту изобретения.

В соответствии с четвертым аспектом в изобретении предложено новое соединение и или его соль, приемлемая для сельского хозяйства.

#### **Осуществление изобретения**

В соответствии с настоящим изобретением предложено применение в качестве агрохимиката, предпочтительно гербицида, соединения по общей формуле (I) или его соли, приемлемой для сельского хозяйства:



(I)

где

**X** выбран из N и CR<sub>1</sub>;

**X'** выбран из N и CR<sub>1A</sub>;

**X''** выбран из O и S;

**R<sub>1</sub>** и **R<sub>1A</sub>** независимо выбраны из группы, состоящей из H, CN, нитро, галида, OR<sub>6</sub>, SR<sub>6</sub>, NR<sub>6</sub>R<sub>7</sub>, NR<sub>6</sub>OR<sub>7</sub>, NR<sub>6</sub>NR<sub>7</sub>R<sub>8</sub>, ONR<sub>6</sub>R<sub>7</sub>, ON(=CR<sub>6</sub>), R<sub>20</sub>, OR<sub>20</sub>, SR<sub>20</sub>, NR<sub>6</sub>R<sub>20</sub>, C<sub>1-6</sub> алкила, C<sub>2-6</sub> алкенила, C<sub>2-6</sub> алкинила, C<sub>3-10</sub> циклоалкила, C<sub>3-10</sub> гетероциклоалкила, C<sub>3-10</sub> циклоалкенила, C<sub>3-10</sub> гетероциклоалкенила, C<sub>6-20</sub> арила, C<sub>5-20</sub> гетероарила, любой из которых может быть необязательно замещен;

**R<sub>2</sub>** выбирают из водорода, CN, нитро, галида, OR<sub>6</sub>, SR<sub>6</sub>, NR<sub>6</sub>R<sub>7</sub>, NR<sub>6</sub>OR<sub>7</sub>, NR<sub>6</sub>NR<sub>7</sub>R<sub>8</sub>, ONR<sub>6</sub>R<sub>7</sub>, ON(=CR<sub>6</sub>), R<sub>20</sub>, OR<sub>20</sub>, SR<sub>20</sub>, NR<sub>6</sub>R<sub>20</sub>, C<sub>1-6</sub> алкила, C<sub>2-6</sub> алкенила, C<sub>2-6</sub> алкинила, C<sub>3-10</sub> циклоалкила, C<sub>3-10</sub> гетероциклоалкила, C<sub>3-10</sub> циклоалкенила, C<sub>3-10</sub> гетероциклоалкенила, C<sub>6-20</sub> арила, C<sub>5-20</sub> гетероарила, любой из которых может быть необязательно замещен;

**R<sub>3</sub>** выбирают из H, галида и C<sub>1-6</sub> алкила, причем алкил может быть необязательно замещен;

**R<sub>4</sub>** и **R<sub>5</sub>** независимо выбирают из H, C<sub>1-6</sub> алкила, C<sub>2-6</sub> алкенила, C<sub>2-6</sub> алкинила, C<sub>3-10</sub> циклоалкила, C<sub>3-10</sub> гетероциклоалкила, C<sub>3-10</sub> циклоалкенила, C<sub>3-10</sub> гетероциклоалкенила, C<sub>6-20</sub> арила, C<sub>5-20</sub> гетероарила, которые могут быть необязательно замещены; причем **R<sub>4</sub>** может независимо или вместе с **R<sub>5</sub>** образовывать C<sub>3-10</sub> циклоалкил, C<sub>3-10</sub> гетероциклоалкил, C<sub>3-10</sub> циклоалкенил, C<sub>3-10</sub>

гетероциклоалкенил, C<sub>6-10</sub> арил или C<sub>5-10</sub> гетероарил, которые могут быть необязательно замещены;

**R<sub>6</sub>**, **R<sub>7</sub>** и **R<sub>8</sub>** независимо выбирают из группы, состоящей из H, C<sub>1-6</sub> алкила, C<sub>2-6</sub> алкенила, C<sub>2-6</sub> алкинила, C<sub>3-10</sub> циклоалкила, C<sub>3-10</sub> гетероциклоалкила, C<sub>3-10</sub> циклоалкенила, C<sub>3-10</sub> гетероциклоалкенила, C<sub>6-20</sub> арила, C<sub>5-20</sub> гетероарила, которые могут быть необязательно замещены; причем **R<sub>6</sub>** может независимо или вместе с **R<sub>7</sub>** образовывать C<sub>3-10</sub> циклоалкил, C<sub>3-10</sub> гетероциклоалкил, C<sub>3-10</sub> циклоалкенил, C<sub>3-10</sub> гетероциклоалкенил, C<sub>6-10</sub> арил или C<sub>5-10</sub> гетероарил, которые могут быть необязательно замещены;

**R<sub>20</sub>** выбирают из

C(=O)R<sub>6</sub>,

C(=O)OR<sub>6</sub>, C(=O)NR<sub>6</sub>R<sub>7</sub>, C(=O)NR<sub>6</sub>C(=O)R<sub>7</sub>, C(=O)C(=O)R<sub>6</sub>, C(=O)C(=O)OR<sub>6</sub>,

C(=O)C(=O)NR<sub>6</sub>R<sub>7</sub>, C(=O)NR<sub>7</sub>S(=O)OR<sub>6</sub>, C(=O)NR<sub>6</sub>OR<sub>7</sub>, (C=O)SR<sub>6</sub>,

S(=O)R<sub>6</sub>, S(=O)<sub>2</sub>R<sub>6</sub>, S(=O)OR<sub>6</sub>, S(=O)<sub>2</sub>OR<sub>6</sub>, S(=O)NR<sub>6</sub>R<sub>7</sub>, S(=O)<sub>2</sub>NR<sub>6</sub>R<sub>7</sub>,

S(=O)<sub>2</sub>NR<sub>7</sub>COR<sub>6</sub>, S(=O)(=NR<sub>8</sub>)NR<sub>6</sub>R<sub>7</sub>, S(=O)(=NR<sub>6</sub>)R<sub>7</sub>, S(=NR<sub>6</sub>)R<sub>7</sub>,

SC(=O)R<sub>6</sub>, SC(=O)OR<sub>6</sub>, SC(=O)NR<sub>6</sub>R<sub>7</sub>,

C(=S)R<sub>6</sub>, C(=S)OR<sub>6</sub>, C(=S)NR<sub>6</sub>R<sub>7</sub>,

CR<sub>7</sub>(=NR<sub>6</sub>), CR<sub>7</sub>(=N-OR<sub>6</sub>), COR<sub>7</sub>(=N-OR<sub>6</sub>), CNR<sub>7</sub>R<sub>8</sub>(=N-OR<sub>6</sub>), CR<sub>8</sub>(=N-NR<sub>7</sub>R<sub>6</sub>).

В настоящем изобретении необязательные заместители могут быть выбраны из циано (CN), нитро (NO<sub>2</sub>), галогена, OR<sub>6</sub>, SR<sub>6</sub>, NR<sub>6</sub>R<sub>7</sub>, NR<sub>6</sub>OR<sub>7</sub>, NR<sub>6</sub>NR<sub>7</sub>R<sub>8</sub>, R<sub>20</sub>, OR<sub>20</sub>, SR<sub>20</sub>, NR<sub>6</sub>R<sub>20</sub>, C<sub>1-6</sub> алкила, C<sub>3-10</sub> циклоалкила, C<sub>3-10</sub> гетероциклоалкила, C<sub>3-10</sub> циклоалкенила, C<sub>3-10</sub> гетероциклоалкенила, C<sub>6-20</sub> арила, C<sub>5-20</sub> гетероарила, C<sub>2-6</sub> алкенила и C<sub>2-6</sub> алкинила, которые сами могут быть необязательно замещены.

В настоящем изобретении, когда говорится, что заместители «включают» определенные группы, указанные группы являются охватывающими, но не ограничивающими.

Предпочтительные необязательные заместители выбирают из гало, циано, нитро, OH, C<sub>1-4</sub> алкила, C<sub>1-4</sub> галоалкила, C<sub>1-4</sub> алкокси, C<sub>1-4</sub> карбоксила, C<sub>1-4</sub> алкилкарбонила, C<sub>2-3</sub> алкенила, C<sub>2-3</sub> алкинила, C<sub>6-20</sub> арила и C<sub>5-20</sub> гетероарила. Эти заместители сами могут быть необязательно замещены, где это применимо. Например, C<sub>1-4</sub> алкил может быть замещен галидом (с получением C<sub>1-4</sub> галоалкила).

Может быть более одного необязательного заместителя. Например, могут быть один, два или три необязательных заместителя.

Группу  $R_1$  выбирают из группы, состоящей из H, CN, нитро, галида,  $OR_6$ ,  $SR_6$ ,  $NR_6R_7$ ,  $NR_6OR_7$ ,  $NR_6NR_7R_8$ ,  $ONR_6R_7$ ,  $ON(=CR_6)$ ,  $R_{20}$ ,  $OR_{20}$ ,  $SR_{20}$ ,  $NR_6R_{20}$ ,  $C_{1-6}$  алкила,  $C_{2-6}$  алкенила,  $C_{2-6}$  алкинила,  $C_{3-10}$  циклоалкила,  $C_{3-10}$  гетероциклоалкила,  $C_{3-10}$  циклоалкенила,  $C_{3-10}$  гетероциклоалкенила,  $C_{6-20}$  арила,  $C_{5-20}$  гетероарила, любой из которых может быть необязательно замещен. Необязательные заместители могут быть выбраны из тех групп, которые перечислены выше.

В одном варианте осуществления группу  $R_1$  выбирают из группы, состоящей из CN, нитро, галида,  $OR_6$ ,  $SR_6$ ,  $NR_6R_7$ ,  $NR_6OR_7$ ,  $NR_6NR_7R_8$ ,  $ONR_6R_7$ ,  $ON(=CR_6)$ ,  $R_{20}$ ,  $OR_{20}$ ,  $SR_{20}$ ,  $NR_6R_{20}$ ,  $C_{1-6}$  алкила,  $C_{2-6}$  алкенила,  $C_{2-6}$  алкинила,  $C_{3-10}$  циклоалкила,  $C_{3-10}$  гетероциклоалкила,  $C_{3-10}$  циклоалкенила,  $C_{3-10}$  гетероциклоалкенила,  $C_{6-20}$  арила,  $C_{5-20}$  гетероарила, любой из которых может быть необязательно замещен. Необязательные заместители могут быть выбраны из тех групп, которые перечислены выше.

В одном варианте осуществления  $R_1$  выбирают из  $C_{1-6}$  алкила,  $C_{1-6}$  галоалкила,  $C_{3-6}$  циклоалкила и галида. В предпочтительном варианте осуществления  $R_1$  представляет собой метил.

Группу  $R_{1A}$  выбирают из группы, состоящей из водорода, CN, нитро, галогена,  $OR_6$ ,  $SR_6$ ,  $NR_6R_7$ ,  $NR_6OR_7$ ,  $NR_6NR_7R_8$ ,  $ONR_6R_7$ ,  $ON(=CR_6)$ ,  $R_{20}$ ,  $OR_{20}$ ,  $SR_{20}$ ,  $NR_6R_{20}$ ,  $C_{1-6}$  алкила,  $C_{2-6}$  алкенила,  $C_{2-6}$  алкинила,  $C_{3-10}$  циклоалкила,  $C_{3-10}$  гетероциклоалкила,  $C_{3-10}$  циклоалкенила,  $C_{3-10}$  гетероциклоалкенила,  $C_{6-20}$  арила,  $C_{5-20}$  гетероарила, любой из которых может быть необязательно замещен. Необязательные заместители могут быть выбраны из тех групп, которые перечислены выше.

В предпочтительном варианте осуществления группу  $R_{1A}$  выбирают из группы, состоящей из CN, нитро, галогена,  $OR_6$ ,  $SR_6$ ,  $NR_6R_7$ ,  $NR_6OR_7$ ,  $NR_6NR_7R_8$ ,  $ONR_6R_7$ ,  $ON(=CR_6)$ ,  $R_{20}$ ,  $OR_{20}$ ,  $SR_{20}$ ,  $NR_6R_{20}$ ,  $C_{1-6}$  алкила,  $C_{2-6}$  алкенила,  $C_{2-6}$  алкинила,  $C_{3-10}$  циклоалкила,  $C_{3-10}$  гетероциклоалкила,  $C_{3-10}$  циклоалкенила,  $C_{3-10}$  гетероциклоалкенила,  $C_{6-20}$  арила,  $C_{5-20}$  гетероарила, любой из которых может быть необязательно замещен. Необязательные заместители могут быть выбраны из тех групп, которые перечислены выше.

В одном варианте осуществления  $R_{1A}$  выбирают из  $C_{1-6}$  алкила,  $C_{1-6}$  галоалкила,  $C_{3-6}$  циклоалкила и галида. В предпочтительном варианте осуществления  $R_{1A}$  представляет собой метил. В одном предпочтительном варианте осуществления  $X' = N$ ,  $R_{1A}$  отсутствует.

Предпочтительно как  $R_1$ , так и  $R_{1A}$  не представляют собой H.

Группу  $R_2$  независимо выбирают из водорода, CN, нитро, галида,  $OR_6$ ,  $SR_6$ ,  $NR_6R_7$ ,  $NR_6OR_7$ ,  $NR_6NR_7R_8$ ,  $ONR_6R_7$ ,  $ON(=CR_6)$ ,  $R_{20}$ ,  $OR_{20}$ ,  $SR_{20}$ ,  $NR_6R_{20}$ ,  $C_{1-6}$  алкила,  $C_{2-6}$  алкенила,  $C_{2-6}$  алкинила,  $C_{3-10}$  циклоалкила,  $C_{3-10}$  гетероциклоалкила,  $C_{3-10}$  циклоалкенила,  $C_{3-10}$  гетероциклоалкенила,  $C_{6-20}$  арила,  $C_{5-20}$  гетероарила, любой из которых может быть необязательно замещен. Необязательные заместители могут быть выбраны из тех групп, которые перечислены выше.

Группу  $R_{20}$  выбирают из  $C(=O)R_6$ ,  $C(=O)OR_6$ ,  $C(=O)NR_6R_7$ ,  $C(=O)NR_6C(=O)R_7$ ,  $C(=O)C(=O)R_6$ ,  $C(=O)C(=O)OR_6$ ,  $C(=O)C(=O)NR_6R_7$ ,  $C(=O)NR_7S(=O)OR_6$ ,  $C(=O)NR_6OR_7$ ,  $(C=O)SR_6$ ,  $S(=O)R_6$ ,  $S(=O)_2R_6$ ,  $S(=O)OR_6$ ,  $S(=O)_2OR_6$ ,  $S(=O)NR_6R_7$ ,  $S(=O)_2NR_6R_7$ ,  $S(=O)_2NR_7COR_6$ ,  $S(=O)(=NR_8)NR_6R_7$ ,  $S(=O)(=NR_6)R_7$ ,  $S(=NR_6)R_7$ ,  $SC(=O)R_6$ ,  $SC(=O)OR_6$ ,  $SC(=O)NR_6R_7$ ,  $ONR_6R_7$ ,  $ON(=CR_6)$ ,  $C(=S)R_6$ ,  $C(=S)OR_6$ ,  $C(=S)NR_6R_7$ ,  $CR_7(=NR_6)$ ,  $CR_7(=N-OR_6)$ ,  $COR_7(=N-OR_6)$ ,  $CNR_7R_8(=N-OR_6)$ ,  $CR_8(=N-NR_7R_6)$ .

Соответственно, группу  $R_{20}$  выбирают, наряду с группами  $R_6$ ,  $R_7$  и  $R_8$ , где это уместно, для получения предпочтительных соединений, описанных в настоящем документе.

Соответственно, предпочтительные группы для  $R_{20}$  включают  $C(=O)R_6$ ,  $C(=O)OR_6$ ,  $C(=O)NR_6R_7$  и  $S(=O)R_6$ .

Вышеуказанные группы заместителей могут быть выбраны таким образом, чтобы они включали эфир, алкоксиамин, оксим, сложный эфир, карбонат, карбамат, сульфит, сульфид, сульфенил, сульфонил, сульфиновая кислота, сульфинамид, сульфонамид, сульфонидамины, сульфилимин, сульфоксимин, сульфенамид, тиолэстер, тиокарбонат, тиокарбамат, кетон, амид, имидид, дикетон, кетокислота, кетоамид, ацетамид, тиоальдегид, тионоэфир, тиоамид, имин, карбоксимидат, енамин, азо, нитрил, изонитрил, цианат или изоцианат.

Группы  $R_6$ ,  $R_7$  и  $R_8$  независимо выбирают из группы, состоящей из H,  $C_{1-6}$  алкила,  $C_{2-6}$  алкенила,  $C_{2-6}$  алкинила,  $C_{3-10}$  циклоалкила,  $C_{3-10}$  гетероциклоалкила,  $C_{3-10}$  циклоалкенила,  $C_{3-10}$  гетероциклоалкенила,  $C_{6-20}$  арила,  $C_{5-20}$  гетероарила, которые могут быть необязательно замещены; причем  $R_6$  может независимо или вместе с  $R_7$  образовывать  $C_{3-10}$  циклоалкил,  $C_{3-10}$  гетероциклоалкил,  $C_{3-10}$  циклоалкенил,  $C_{3-10}$  гетероциклоалкенил,  $C_{6-10}$  арил или  $C_{5-10}$  гетероарил, которые могут быть необязательно замещены. Необязательные заместители могут быть выбраны из тех групп, которые перечислены выше.

Предпочтительные группы для  $R_6$ ,  $R_7$  и  $R_8$  включают H,  $C_{1-4}$  алкил и  $C_{1-4}$  галоалкил.

В одном варианте осуществления  $R_2$  выбирают из  $C_{1-6}$  алкила,  $C_{3-6}$  циклоалкила и галида. В предпочтительном варианте осуществления  $R_2$  представляет собой *i*-пропил, *t*-бутил или циклопропил.

В одном варианте осуществления  $R_3$  выбирают из галида, водорода и  $C_{1-4}$  алкила, которые могут быть необязательно заменены. Необязательные заместители включают гало. В предпочтительном варианте осуществления  $R_3$  выбирают из F, Cl или H.

Группы  $R_4$  и  $R_5$  независимо выбирают из H,  $C_{1-6}$  алкила,  $C_{2-6}$  алкенила,  $C_{2-6}$  алкинила,  $C_{3-10}$  циклоалкила,  $C_{3-10}$  гетероциклоалкила,  $C_{3-10}$  циклоалкенила,  $C_{3-10}$  гетероциклоалкенила,  $C_{6-20}$  арила,  $C_{5-20}$  гетероарила, которые могут быть необязательно замещены; причем  $R_4$  может независимо или вместе с  $R_5$  образовывать  $C_{3-10}$  циклоалкил,  $C_{3-10}$  гетероциклоалкил,  $C_{3-10}$  циклоалкенил,  $C_{3-10}$  гетероциклоалкенил,  $C_{6-10}$  арил или  $C_{5-10}$  гетероарил, которые могут быть необязательно замещены. Необязательные заместители могут быть выбраны из тех групп, которые перечислены выше.

В предпочтительном варианте осуществления один из  $R_4$  и  $R_5$  представляет собой H. В предпочтительном варианте осуществления, в котором  $R_4$  не представляет собой H, он выбран из  $C_{1-6}$  алкила,  $C_{3-10}$  циклоалкила,  $C_{3-10}$  гетероциклоалкила,  $C_{6-20}$  арила,  $C_{5-20}$  гетероарила, любой из которых может быть необязательно замещен. Еще в одном предпочтительном варианте осуществления  $R_4$  имеет формулу  $-(CH_2)_n-Y$ , где  $n$  — целое число в диапазоне 0–4, а Y выбирают из  $C_{1-6}$  алкила,  $C_{3-10}$  циклоалкила,  $C_{3-6}$  гетероциклоалкила,  $C_{6-20}$  арила,  $C_{5-20}$  гетероарила, любой из которых может быть необязательно замещен. Еще в одном

предпочтительном варианте осуществления Y выбирают из C<sub>1-6</sub> алкила, C<sub>3-8</sub> циклоалкила, C<sub>3-6</sub> гетероциклоалкила, C<sub>6-20</sub> арила, C<sub>5-20</sub> гетероарила, любой из которых может быть необязательно замещен, еще более предпочтительно из C<sub>1-6</sub> алкила, C<sub>3-6</sub> циклоалкила, C<sub>3-6</sub> гетероциклоалкила, C<sub>6-20</sub> арила, C<sub>5-20</sub> гетероарила, любой из которых может быть необязательно замещен. В этом предпочтительном варианте осуществления необязательные заместители предпочтительно выбирают из одного или более из галида, OH, C<sub>1-6</sub> алкокси и CN. Необязательные заместители более предпочтительно выбирают из галида, OH, OMe и CN. В предпочтительном варианте осуществления n = 0 или 1.

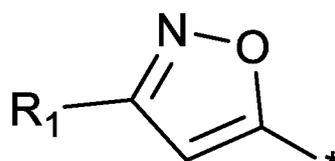
Особенно предпочтительные группы для Y выбирают из метила, этила, циклопропила, циклобутила, циклопентила, циклогексила, фенила, пиридина, пиримидина, диоксана и морфолина.

В одном варианте осуществления R<sub>4</sub> может представлять собой C<sub>3-6</sub> циклоалкил или иметь формулу -(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>-Y, в которой n является целым числом в диапазоне 0–4, а Y выбирают из C<sub>3-6</sub> циклоалкила.

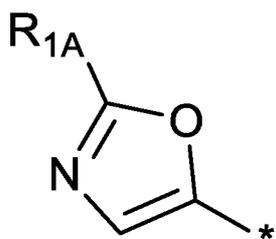
В другом варианте осуществления R<sub>4</sub> может представлять собой -(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>-Y, где Y выбирают из C<sub>6-20</sub> арила или C<sub>5-20</sub> гетероарила, которые могут быть необязательно замещены, как описано выше. Когда Y представляет собой C<sub>6-20</sub> арил или C<sub>5-20</sub> гетероарил, необязательные заместители предпочтительно являются галидом. Когда имеется один заместитель, например, галид, он предпочтительно находится в положении *пара* или *орто* на арильном кольце.

Формула (I) содержит 5-членный гетероцикл. Такие гетероциклы содержат множество изомеров и таутомеров. Такой гетероцикл согласно настоящему изобретению может быть в форме следующих соединений (где \* обозначает остальную часть молекулы, не показанную для ясности):

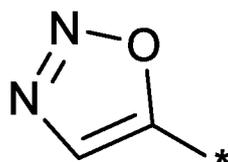
- Изоксазол:



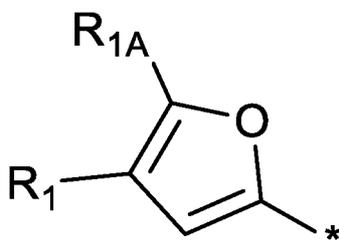
- Оксазол:



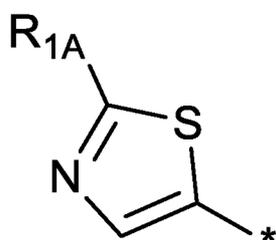
- Оксадиазол:



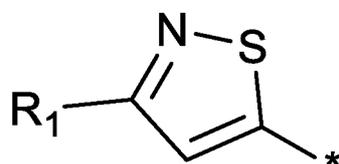
- Фуран:



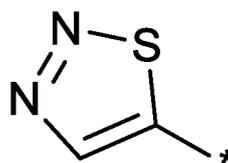
- Тиазол:



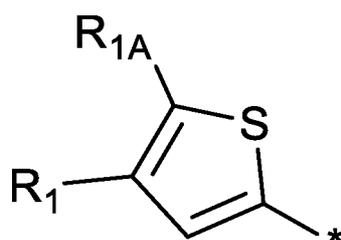
- Изотиазол:



- Тиadiaзол:

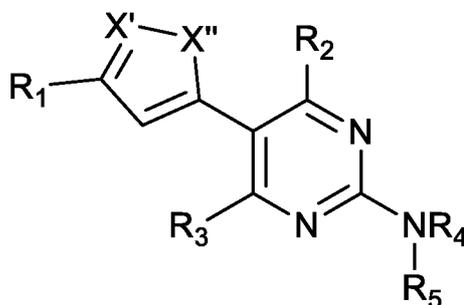


- Тиофен:



5-членный гетероцикл всегда по меньшей мере частично замещен, т. е. всегда имеется по меньшей мере один заместитель R<sub>1</sub>. Вокруг кольца могут быть и другие заместители. В предпочтительном варианте осуществления 5-членный гетероцикл замещен одной группой R<sub>1</sub>. В предпочтительном варианте осуществления атомы кольца в альфа-положениях относительно остальной части молекулы не замещены, т. е. альфа-углерод несет водород, а альфа-гетероатом не замещен.

Предпочтительные соединения согласно изобретению содержат 5-членные гетероциклы, содержащие два гетероатома. Предпочтительное соединение согласно изобретению имеет формулу (II):

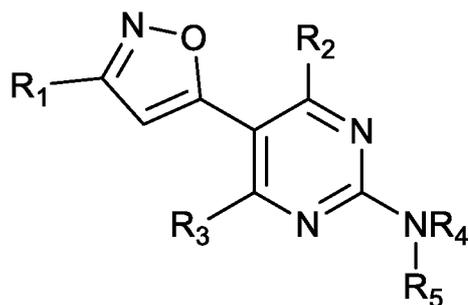


(II)

где

каждый из R<sub>1</sub>, R<sub>2</sub>, R<sub>3</sub>, R<sub>4</sub> и R<sub>5</sub> определяется согласно первому аспекту изобретения; X' выбирают из N и CR<sub>1A</sub>, а X'' выбирают из O или S.

Предпочтительными соединениями согласно изобретению являются изоксазолы, т. е. 5-членный гетероцикл представляет собой изоксазол. Например, предпочтительное соединение согласно изобретению имеет формулу (III):



(III)

где

каждый из **R<sub>1</sub>**, **R<sub>2</sub>**, **R<sub>3</sub>**, **R<sub>4</sub>** и **R<sub>5</sub>** определяется согласно первому аспекту изобретения;

кроме того, когда **R<sub>1</sub>** предпочтительно выбирают из метила или C<sub>1-4</sub> алкила, которые могут быть необязательно замещены, при этом предпочтительно необязательный заместитель представляет собой галид.

Новые соединения согласно изобретению проиллюстрированы в настоящем документе как соединения **1–14**.

### Определения групп

Там, где это обозначено в формуле изобретения, заместители и функциональные группы могут быть необязательно замещенными. Это может проявляться в единичном или множественном замещении и может включать различные таутомеры, изомеры и стереоизомеры, где это уместно. Понятно, что ссылка на циклические группы, например, циклоалкильные группы или арильные группы, включает полициклические соединения, например нафталин. Это относится также к их эквивалентам, содержащим гетероатом, таким как гетероарильные группы, например индол.

Понятно, что любая ссылка в настоящем документе на префиксы, относящиеся к числам атомов в заместителях, например, C<sub>3-20</sub>, C<sub>5-20</sub>, C<sub>1-6</sub> и т. д. (также записывается, как C<sub>x</sub>-C<sub>y</sub>), означает диапазон числа атомов, будь то атомы цепи или кольца, атомы углерода или гетероатомы. Например, используемое в настоящем документе выражение «C<sub>5-20</sub> гетероарил» означает арильную группу, имеющую от 5 до 20 атомов кольца, причем по меньшей мере один из этих атомов является гетероатомом: поэтому «C<sub>5</sub> гетероарил» представляет собой 5-членный

ароматический гетероцикл, содержащий 5 атомов, из которых по меньшей мере один является гетероатомом. Этот принцип распространяется на все группы, упомянутые в настоящем документе.

Алкильные группы (например, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> алкил) могут включать метил (Me), этил (Et), *n*-пропил (*n*-Pr), изопропил (*i*-Pr), *n*-бутил (*n*-Bu), изобутил (*i*-Bu), *втор*-бутил (*s*-Bu) и *трет*-бутил (*t*-Bu). Алкильные группы обычно представляют собой C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> алкил и предпочтительно представляют собой C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> алкил.

Циклоалкильные группы (например, C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub> циклоалкил) включают, например, циклопропил (*ц*-пропил, *c*-Pr), циклобутил (*ц*-бутил, *c*-Bu), циклопентил (*ц*-пентил) и циклогексил (*ц*-гексил). Циклоалкильные группы обычно представляют собой C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub>.

Алкенильные и алкинильные фрагменты могут существовать в виде прямых или разветвленных цепей. Алкенильные фрагменты могут иметь либо (*E*)-, либо (*Z*)-конфигурацию, где это уместно. В их число входят, например, винил, аллил и пропаргил. Алкенильные и алкинильные фрагменты могут содержать множественные двойные и тройные связи в любой комбинации. Например, алкенильный фрагмент может содержать две отдельные алкеновые двойные связи или одну двойную связь и тройную связь. Алкенильные и алкинильные группы обычно представляют собой C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> и предпочтительно представляют собой C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>.

Циклоалкенильные группы (например, C<sub>3-10</sub> циклоалкенил), также известные как циклоолефины, включают, например, циклопропилен, циклобутилен, циклопентилен и циклогексилен. Циклоалкенильные группы согласно настоящему изобретению предпочтительно имеют размер кольца по меньшей мере C<sub>4</sub>, предпочтительно C<sub>5</sub> и выше.

Циклоалкенильные фрагменты могут содержать множественные двойные связи в любой комбинации. Например, циклоалкенильный фрагмент может содержать две отдельные алкеновые двойные связи.

Галоген (который может быть написан как гало или галид) включает фтор, хлор, бром или йод. Это определение галогена также применимо в других ситуациях, например, галоалкил, галоарил или галоалкенил. Например, галоалкил включает

бромэтил, фторэтил; галоарил включает бромбензил, фторбензил; а галоалкенил включает этилендибромид или этилендифторид.

Галоалкильные группы (например, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> галоалкил) представляют собой, например, фторметил, дифторметил, трифторметил, хлорметил, дихлорметил, трихлорметил 2,2,2-трифторэтил, 2-фторэтил, 2-хлорэтил, пентафторэтил, 1,1-дифтор-2,2,2-трихлорэтил, 2,2,3,3-тетрафторэтил и 2,2,2-трихлорэтил, гептафтор-*n*-пропил и перфтор-*n*-гексил.

Алкоксильные группы (например, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> алкокси) включают, например, метокси, этокси, пропокси, изопропокси, *n*-бутокси, изобутокси, *втор*-бутокси или *треть*-бутокси.

Алкоксиалкильные группы (например, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> алкокси-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> алкил) включают, например, метоксиметил, метоксиэтил, этоксиметил, этоксиэтил, *n*-пропоксиметил, *n*-пропоксиэтил, изопропоксиметил или изопропоксиэтил.

Алкилкарбонильные группы (например, C<sub>1-6</sub> алкилкарбонил) включают кетоны, альдегиды и карбоновые кислоты, например, пропанон, бутанон, пентанон, формальдегид, ацетальдегид, пропиональдегид, бутиральдегид, муравьиную кислоту, уксусную кислоту, пропионовую кислоту, масляную кислоту или валериановую кислоту.

Карбоксильные группы включают -C(=O)OH.

C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> алкил-S- (тиоалкил) представляет собой, например, метилтио, этилтио, пропилтио, изопропилтио, *n*-бутилтио, изобутилтио, *втор*-бутилтио или *треть*-бутилтио.

C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> алкил-S(O)- (алкилсульфинил) представляет собой, например, метилсульфинил, этилсульфинил, пропилсульфинил, изопропилсульфинил, *n*-бутилсульфинил, изобутилсульфинил, *втор*-бутилсульфинил или *треть*-бутилсульфинил.

C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> алкил-S(O)<sub>2</sub>- (алкилсульфонил) представляет собой, например, метилсульфонил, этилсульфонил, пропилсульфонил, изопропилсульфонил, *n*-

булитсульфонил, изобутилсульфонил, *втор*-бутилсульфонил или *трет*-бутилсульфонил.

Гетероциклил, если не указано иное, представляет собой кольцевую структуру, которая может быть ароматической или полностью либо частично насыщенной и может содержать от 1 до 4 гетероатомов, каждый из которых независимо выбирают из группы, состоящей из кислорода, азота и серы. Термин «гетероциклил» охватывает гетероциклоалкил, гетероциклоалкенил и гетероарил.

Термины «гетероциклоалкил» и «гетероциклоалкенил» обозначают структурные эквиваленты циклоалкилу и циклоалкенилу, которые могут содержать от 1 до 4 гетероатомов, каждый независимо выбираемый из группы, состоящей из кислорода, азота и серы, и которые обычно не являются ароматическими. Гетероциклоалкенильные кольца могут содержать множественные двойные связи в любой комбинации.

Термин «арил» обозначает ароматический углеводород, который, например, включает, фенильную, толильную, ксилильную и нафтильную группы. Арильные группы могут быть однократно или многократно замещены в различных положениях вокруг кольца. В настоящем изобретении арильные группы обычно представляют собой  $C_6-C_{20}$  и предпочтительно представляют собой  $C_6-C_{10}$ .

Термин «гетероарил» обозначает арильную группу, в которой по меньшей мере один атом в ароматическом кольце является гетероатомом, таким как S (например, тиофен), O (например, фуран) или N (например, индол). Гетероарильные группы могут иметь больше одного гетероатома в кольце (например, цитозин). В настоящем изобретении гетероарильные группы обычно представляют собой  $C_5-C_{20}$  и предпочтительно представляют собой  $C_5-C_{10}$ .

Понятно, что арильные группы могут присутствовать в виде заместителей, связанных посредством линкера, причем этот линкер может быть алкильной, алкенильной или алкинильной цепью. В предпочтительном варианте осуществления арильная группа связана с молекулой посредством алкила. В предпочтительном варианте осуществления арил связан группой  $CH_2$  и поэтому является бензильной группой.

Кроме того, настоящее изобретение относится к приемлемым для сельского хозяйства солям соединений формулы (I). Эти соли могут включать соли, которые могут быть образованы в результате реакции с аминами, основаниями элементов группы 1 и группы 2 или четвертичными аммониевыми основаниями. Особый интерес из оснований элементов группы 1 и группы 2 представляют те, которые содержат гидроксиды Li, Na, K, Mg и Ca, из которых наиболее важными являются NaOH и KOH. Соединения формулы (I) согласно изобретению могут также включать гидраты, формирующиеся при солеобразовании.

Амины, пригодные для образования аммониевых солей, включают аммиак, первичные, вторичные и третичные C<sub>1</sub>-C<sub>18</sub> алкиламины, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> гидроксиалкиламины и C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> алкоксиалкиламины. Специалисту в данной области известно, какие амины подойдут для образования аммониевых солей. Предпочтительными аминами для образования аммониевой соли являются триэтиламин, изопропиламин и диизопропиламин.

В зависимости от характера заместителей соединения формулы (I) могут существовать в различных изомерных формах. Например, когда X, X' и X'' выбирают так, что гетероциклическое кольцо представляет собой изоксазол, соединения формулы (I) могут существовать в различных таутомерных формах.

Данное изобретение охватывает все изомеры, таутомеры и их смеси в любой и во всех пропорциях. При наличии двойных связей могут существовать *цис*- и *транс*-изомеры. Такие изомеры входят в объем настоящего изобретения. Соединения формулы (I) могут содержать стереоцентры и могут существовать в виде одного энантиомера, пар энантиомеров в любой пропорции или, когда присутствует более одного стереоцентра, содержать диастереоизомеры во всех возможных соотношениях. Как правило, один из энантиомеров имеет повышенную биологическую активность по сравнению с другими.

### **Применение в сельском хозяйстве**

Соединения согласно изобретению используются в качестве агрохимикатов, или сельскохозяйственных химикатов, которые представляют собой те химикаты, которые используются в сельскохозяйственных целях. Агрохимикаты классифицируют в зависимости от роли, для которой они используются, например, пестициды — для борьбы с вредителями, фунгициды — для борьбы с ростом грибов, удобрения — для повышения содержания питательных веществ в почве,

в которой выращивают сельскохозяйственные культуры, или гербициды, которые используются для уничтожения нежелательной растительности. Соединения согласно настоящему изобретению могут быть применены в качестве любого агрохимиката, но предпочтительно используются как гербициды.

Гербициды, в частности, могут быть селективными или неселективными. Первые представляют собой гербициды, предназначенные для применения вокруг желаемых растений/сельскохозяйственных культур и направленные на борьбу с сорняками без повреждения самого желаемого растения/сельскохозяйственной культуры. Последние представляют собой гербициды, которые не различают сорта растений, а вместо этого уничтожают всю растительность. Соединения согласно настоящему изобретению предпочтительно являются селективными гербицидами.

Гербициды могут применяться различными путями и могут иметь различные механизмы действия. Их можно вносить в почву, чтобы они впитались корнями/побегами появляющихся всходов сорняков, или их можно наносить на листья существующих растений. Выбор пути также может определяться тем, является ли гербицид довсходовым (т. е. применяемым до появления всходов сорняков на поверхности) или послевсходовым (который применяют после появления всходов сорняков на поверхности почвы). Соединения и композиции согласно настоящему изобретению могут быть применены в качестве довсходовых и послевсходовых гербицидов. Предпочтительно эти соединения и композиции используют в качестве послевсходовых гербицидов.

Соединения по изобретению могут использоваться в качестве гербицидов сами по себе, но обычно их готовят в виде агрохимических композиций, предпочтительно гербицидных композиций, с применением адъювантов для приготовления состава, таких как носители, растворители и поверхностно-активные вещества (SFA или также называемые суфрактаантами). В соответствии с аспектом настоящего изобретения предложена гербицидная композиция, содержащая гербицидное соединение согласно формуле (I) и вспомогательное вещество, приемлемое для сельского хозяйства. Соответствующая агрохимическая композиция может быть в форме концентратов, требующих разбавления перед использованием, или может быть составлена для немедленного применения без дальнейшей обработки. Для разбавления перед применением чаще всего используют воду, но также могут быть использованы вещества, отличные от воды, такие как жидкие удобрения,

микроудобрения, биологические организмы, масло или растворители, или это может быть сделано с использованием воды и одного или более из указанных веществ в сочетании.

Любые ссылки на соединения формулы (I) включают ссылку на конкретные варианты осуществления формулы (II)–(III) и любые другие формулы, указанные в настоящем документе.

Гербицидные композиции обычно содержат 0,1–99 мас.% соединений согласно формуле (I) и 1–99,9 мас.% вспомогательного вещества, предпочтительно содержащего 0–25 мас.% поверхностно-активного вещества.

Используемый состав может быть выбран из ряда классов рецептур, подробная информация о которых известна из Руководства по разработке и использованию спецификаций ФАО на средства защиты растений (Manual on Development and Use of FAO Specifications for Plant Protection Products, 5th Edition, 1999) и последующих связанных документов. К ним относятся распыляемые порошки (DP), растворимые порошки (SP), смачиваемые порошки (WP), водорастворимые гранулы (SG), водно-диспергируемые гранулы (WG), гранулы (GR) (медленного или быстрого высвобождения), растворимые концентраты (SL), смешивающиеся с маслом жидкости (OL), жидкости сверхмалого объема (UL), диспергируемые концентраты (DC), эмульгируемые концентраты (EC), эмульсии (как масло в воде (EW), так и вода в масле (EO)), микроэмульсии (ME), суспензионные концентраты (SC), капсулированные суспензии (CS), аэрозоли и составы для обработки семян. Актуальный выбираемый состав будет зависеть от конкретной желаемой цели и конечного использования состава, а также от физических, химических и биологических свойств соединения формулы (I).

Композиция может включать одну или более добавок для усиления биологических характеристик композиции, например, путем улучшения смачивания, удерживания или распределения на поверхностях и между ними; стойкости на обработанных поверхностях в присутствии дождя или другого природного источника воды (например, росы); или поглощения или подвижности соединения формулы (I). Такие добавки включают поверхностно-активные вещества, аэрозольные добавки на основе масел, например, некоторые минеральные масла или натуральные растительные масла (такие как масло соевых бобов и рапсовых семян), а также их

смеси с другими биоусиливающими адъювантами (ингредиентами, которые могут способствовать действию соединения формулы (I) или изменять его).

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

Смачивающие средства, диспергирующие средства и эмульгирующие средства могут быть поверхностно-активными веществами катионного, анионного, амфотерного или неионного типа.

Подходящие катионные поверхностно-активные вещества включают соединения четвертичного аммония (например, бромид цетилтриметиламмония), имидазолины и соли аминов.

Подходящие анионные поверхностно-активные вещества включают соли щелочных металлов жирных кислот, соли алифатических моноэфиров серной кислоты (например, иаурилсульфат натрия), соли сульфонированных ароматических соединений (например, додецилбензолсульфонат натрия, додецилбензолсульфонат кальция, бутилнафталинсульфонат и смеси ди-/изопропил- и три-/изопропил-нафталинсульфонатов натрия), сульфаты эфиров, сульфаты простых эфиров (например, лаурет-3-сульфат натрия), карбоксилаты эфиров (например, лаурет-3-карбоксилат натрия), фосфатные эфиры (продукты реакции между одним или более жирными спиртами и фосфорной кислотой (для получения моноэфиров) или пентоксидом фосфора (для получения диэфиров), например, реакции между додеканолом и тетрафосфорной кислотой; кроме того, эти продукты могут быть алкоксилированы, обычно этоксилированы), сульфосукцинаматы, парафиновые или олефиновые сульфонаты, таураты и лигносульфонаты.

Подходящие амфотерные поверхностно-активные вещества включают бетаины, пропионаты и глицинаты.

Подходящие неионные поверхностно-активные вещества включают продукты конденсации алкиленоксидов, таких как окись этилена, окись пропилена, окись бутилена или их смесей, с жирными спиртами (такими как олеиловый спирт или цетиловый спирт) или с алкилфенолами (такими как октилфенол, нонилфенол или

октилкрезол); неполные эфиры, полученные из длинноцепочечных жирных кислот или гекситоловых ангидридов; продукты конденсации указанных неполных эфиров с окисью этилена; блок-полимеры (содержащие окись этилена и окись пропилена); алканоламиды; простые эфиры (например, эфиры полиэтиленгликоля жирных кислот); оксиды аминов (например, лаурилдиметиламинооксид); и лецитины.

Композиция согласно настоящему изобретению может также содержать по меньшей мере один дополнительный пестицид. Например, соединения согласно изобретению также могут быть использованы в сочетании с другими гербицидами, пестицидами или регуляторами роста растений. Дополнительный пестицид предпочтительно является гербицидом и/или антидотом гербицидов. Примерами указанных смесей являются (где I обозначает соединение согласно формуле (1)):

I + ацетохлор, I + ацифлуорфен, I + ацифлуорфен-натрий, I + аклонифен, I + акролеин, I + алахлор, I + аллоксидим, I + аметрин, I + амикарбазон, I + амидосульфурон, I + аминопиралид, I + амитрол, I + анилофос, I + азулам, I + атразин, I + азафенидин, I + азимсульфурон, I + ВСРС, I + бенфлубутамид, I + беназолин, I + бенкарбазон, I + бенфлуралин, I + бенфурезат, I + бенсульфурон, I + бенсульфурон-метил, I + бензулид, I + бентазон, I + бензфендизон, I + бензобициклон, I + бензофенап, I + бициклопирон, I + бифенокс, I + биланофос, I + биспирибак, I + биспирибак натрия, I + боракс, I + бромацил, I + бромобутид, I + бромоксинил, I + бутахлор, I + бутамифос, I + бутралин, I + бутроксидим, I + буталат, I + какодиловая кислота, I + хлорат кальция, I + кафенстрол, I + карбетамид, I + карфентразон, I + карфентразон-этил, I + хлорфлуренол, I + хлорфлуренол-метил, I + хлоридазон, I + хлоримурон, I + хлоримурон-этил, I + хлоруксусная кислота, I + хлоротолурон, I + хлорпрофам, I + хлорсульфурон, I + хлортал, I + хлортал-диметил, I + цинидон-этил, I + цинметилин, I + циноссульфурон, I + цизанилид, I + клетодим, I + клодинафоп, I + клодинафоп-пропаргил, I + кломазон, I + кломепроп, I + клопиралид, I + клоранзулам, I + клоранзулам-метил, I + цианазин, I + циклоат, I + циклопиранил, I + циклосульфамурон, I + циклоксидим, I + цигалофоп, I + цигалофоп-бутил, I + 2,4-Д, I + даимурон, I + далапон, I + дазомет, I + 2,4-ДМ, I + дезмедифам, I + дикамба, I + дихлобенил, I + дихлорпроп, I + дихлорпроп-П, I + диклофоп, I + диклофоп-метил, I + диклосулам, I + дифензокват, I + дифензокватметилсульфат, I + дифлуфеникан, I + дифлуфензопир, I + димефурон, I + димепиперат, I + диметахлор, I + диметаметрин, I + диметенамид, I + диметенамид-П, I + диметипин, I + диметиларсиновая кислота, I + динитрамин, I + динотерб, I + дифенамид, I + дипропетрин, I + дикват, I + дикват дибромид, I + дитиопир, I +

диурон, I + эндотал, I + ЭПТК, I + эспрокарб, I + эталфлуралин, I + этаметсульфурон, I + этаметсульфурон-метил, I + этефон, I + этофумезат, I + этоксифен, I + этокисульфурон, I + этобензанид, I + феноксапроп-П, I + феноксапроп-П-этил, I + фенхинотрион, I + фентразамид, I + сульфат железа, I + флампроп-М, I + флазасульфурон, I + флопирауксифен, I + флорасулам, I + флуазифоп, I + флуазифоп-бутил, I + флуазифоп-П, I + флуазифоп-П-бутил, I + флуазолат, I + флукарбазон, I + флукарбазон натрия, I + флуцетосульфурон, I + флухлоралин, I + флуфенацет, I + флуфенпир, I + флуфенпир-этил, I + флуметралин, I + флуметсулам, I + флумиклорак, I + флумиклорак-пентил, I + флумиоксазин, I + флумипропин, I + флуометурон, I + фторгликофен, I + фторгликофенэтил, I + флуоксапроп, I + флупоксам, I + флупропацил, I + флупропанат, I + флупирсульфурон, I + флупирсульфурон-метил-натрий, I + флуренол, I + флуридон, I + флуорохлоридон, I + флуорокспир, I + флуртамон, I + флутиацет, I + флутиацет-метил, I + фомесафен, I + форамсульфурон, I + фозамин, I + глуфозинат, I + глуфозинат-аммоний, I + глифосат, I + галауксифен, I + галасульфурон, I + галасульфурон-метил, I + гаклоксифоп, I + галоксифоп-П, I + гексазинон, I + имазабетабенз, I + имазабетабенз-метил, I + имазамокс, I + имазапик, I + имазапир, I + имазахин, I + имазатапир, I + имазасульфурон, I + инданофан, I + индазифлам, I + йодометан, I + йодосульфурон, I + йодосульфурон-метил-натрий, I + иоксинил, I + изопротурон, I + изоурон, I + изоксабен, I + изоксахлортон, I + изоксафлутол, I + изоксапирофоп, I + карбутилат, I + лактофен, I + ленацил, I + линурон, I + мекопроп, I + мекопроп-П, I + мефенасет, I + мефлудид, I + мезосульфурон, I + мезосульфурон-метил, I + мезотрион, I + метам, I + метамифоп, I + метамитрон, I + метазахлор, I + метабензтиазурон, I + метазол, I + метиларсиновая кислота, I + метилдимрон, I + метилизотиоцианат, I + метолахлор, I + С-метолахлор, I + метосулам, I + метоксурон, I + метрибузин, I + метсульфурон, I + метсульфурон-метил, I + молинат, I + монолинурон, I + напроанилид, I + напропамид, I + напропамид-М, I + напталам, I + небурон, I + никосульфурон, I + N-метил-глифосат, I + нонановая кислота, I + норфлузарон, I + олеиновая кислота (жирные кислоты), I + орбенкарб, I + ортосульфамурон, I + оризалин, I + оксадиаргил, I + оксадиазон, I + оксасульфурон, I + оксазикломефон, I + оксифлуорфен, I + паракват, I + паракват дихлорид, I + пебулат, I + пендиметалин, I + пеноксулам, I + пентахлорфенол, I + пентанохлор, I + пентоксазон, I + петоксамид, I + фенмедифам, I + пиклорам, I + пиколинафен, I + пиноксаден, I + пиперофос, I + претилахлор, I + примисульфурон, I + примисульфурон-метил, I + продиамин, I + профоксидим, I + прогексадион-кальций, I + прометон, I + прометрин, I + пропахлор, I + пропанил, I + пропахизафоп, I + пропазин, I + профам,

I + пропизохлор, I + пропоксикарбазон, I + пропоксикарбазон-натрий, I + пропизамид, I + просульфокарб, I + просульфурон, I + пираклонил, I + пирафлуфен, I + пирафлуфен-этил, I + пирасульфотол, I + пиразолинат, I + пиразосульфурон, I + пиразосульфурон-этил, I + пиразоксифен, I + пирибензоксим, I + пирибутикарб, I + пиридафол, I + пиридат, I + пирифталид, I + пириминобак, I + пириминобак-метил, I + пиримисульфан, I + пиритиобак, I + пиритиобак-натрий, I + пироксасульфон, I + пироксзулам, I + хинклорак, I + хинмерак, I + хинокламин, I + хизалофоп, I + хизалофоп-П, I + римсульфурон, I + салфлуфенацил, I + сетоксидим, I + сидурон, I + симазин, I + симетрин, I + хлорат натрия, I + сулкотрион, I + сульфентразон, I + сульфометурон, I + сульфометурон-метил, I + сульфосат, I + сульфосульфурон, I + серная кислота, I + тебутиурон, I + тефурилтрион, I + темботрион, I + тепралоксидим, I + тербацил, I + тербуметон, I + тербутилазин, I + тербутрин, I + тенихлор, I + тиазопир, I + тифенсульфурон, I + тиенкарбазон, I + тифенсульфурон-метил, I + тиобенкарб, I + толпиралат, I + топрамезон, I + тралкоксидим, I + триаллат, I + триасульфурон, I + триазифлам, I + трибенурон, I + трибенуронметил, I + триклопир, I + триэтазин, I + трифлорисульфурон, I + трифлорисульфурон-натрий, I + трифлудимоксазин, I + трифлуралин, I + трифлусульфурон, I + трифлусульфурон-метил, I + тригидрокситриазин, I + тринексапак-этил, I + тритосульфурон, I + сложный этиловый эфир [3-[2-хлор-4-фтор-5-(1-метил-6-трифторметил-2,4-диоксо-1,2,3,4-тетрагидропиримидин-3-ил)фенокси]-2-пиридилокси]уксусной кислоты.

Компоненты, смешиваемые с соединением формулы (I), также могут быть в виде сложных эфиров или солей.

Соединение формулы (I) также может быть использовано в смесях с другими агрохимикатами, такими как фунгициды, нематоциды или инсектициды, примеры которых приведены в Руководстве по пестицидам. Соотношение при смешивании соединения формулы (I) с другим компонентом предпочтительно составляет от 1:100 до 1000:1. Преимуществом является то, что смеси могут быть использованы в вышеуказанных составах (в этом случае «активный ингредиент» относится к соответствующей смеси соединения формулы (I) с другим компонентом).

Смеси формулы (I) согласно изобретению также могут быть использованы вместе с одним или более андотами гербицидов. Аналогичным образом смеси соединения формул (I) согласно настоящему изобретению с одним или более дополнительными гербицидами также могут быть использованы в сочетании с

одним или более антидотами гербицидов. Антидоты гербицидов могут представлять собой AD 67 (MON 4660), беноксакор, клохинтоцет-мексил, ципросульфамид (CAS RN 221667-31-8), дихлормид, фенхлоразол-этил, фенхлорим, флуксофеним, фурилазол и соответствующий *R*-изомер, изоксадифен-этил, мефенпир-диэтил, оксабетринил, *N*-изопропил-4-(2-метоксибензоилсульфамоил)-бензамид (CAS RN 221668-34-4). Антидоты гербицидов также могут включать соединения, раскрытые, например, в EP0365484, такие как *N*-(2-метоксибензоил)-4-[(метиламинокарбонил)амино]бензолсульфонамид. Антидоты гербицидов, используемые с соединением формулы (I), также могут быть в виде сложных эфиров или солей.

Предпочтительно соотношение при смешивании соединения формулы (I) с антидотом гербицидов составляет от 100:1 до 1:10, в частности, от 20:1 до 1:1. Преимуществом является то, что смеси могут быть использованы в составах, рассмотренных выше (в этом случае «активный ингредиент» относится к соответствующей смеси соединения формулы (I) с антидотом гербицидов).

В настоящем изобретении также предложен способ борьбы с сорняками в месте произрастания, содержащем культурные растения и сорняки, причем способ включает нанесение в месте произрастания подавляющего сорняки количества композиции согласно настоящему изобретению. «Борьба» в агрохимическом контексте означает уничтожение, уменьшение или замедление роста или предотвращение или снижение прорастания. Растения, с которыми необходимо бороться, представляют собой нежелательные растения, т. е. сорняки. «Место произрастания» означает положение или место, в котором растения растут или будут расти.

Норма внесения соединений формулы (I) может меняться в пределах значимого диапазона и зависит от характера и качеств почвы, способа внесения (до или после появления всходов; предпосевная обработка семян; внесение в борозду для семян; внесение без обработки/с минимальной обработкой почвы и т. д.), культурного растения, сорняка или сорняков, с которыми необходимо бороться, преобладающих климатических или метеорологических условий и других факторов, определяемых способом внесения, временем внесения и целевой культурой. Соединения формулы (I) согласно изобретению обычно вносят при норме от 10 до 2000 г/га, в частности, от 50 до 1000 г/га.

Внесение обычно производят путем распыления композиции, как правило, с помощью установленного на тракторе распыливателя в случае больших площадей, но также могут быть использованы и другие способы, такие как распыление (например, из механизмов доставки по воздуху), капельное орошение или дождевание.

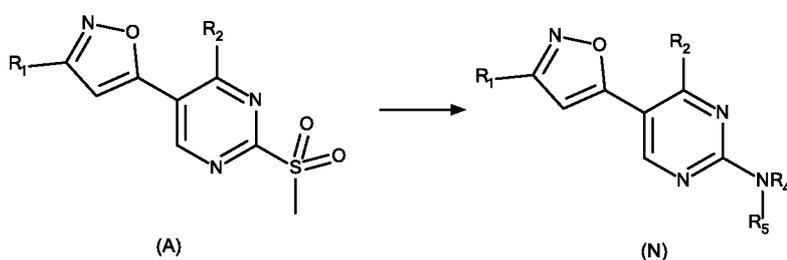
Полезные растения, защиту которых достигают путем применения композиций согласно настоящему изобретению, включают культурные растения, такие как колосовые культуры, например, ячмень и пшеница, хлопок, масличный рапс, подсолнечник, кукуруза, рис, соя культурная, сахарная свекла, сахарный тростник и газон. К культурным растениям также можно отнести деревья, такие как фруктовые деревья, пальмы, кокосовые пальмы или другие ореховые деревья. Также сюда входят лианы, такие как виноград, плодовые кустарники, фруктовые растения, овощи и бобовые.

Термин «культурные растения» также включает те культуры, которые сделали толерантными к гербицидам или их классам (например, ALS-, GS-, EPSPS-, PPO-, ACCase- и HPPD-ингибиторам) с помощью обычной селекции или генной инженерии/модификации. Примером культуры, которую сделали толерантной к имидазолинонам, например имазамоксу, с помощью традиционных методов селекции, является летний рапс Clearfield® (канола). В число примеров культур, которые сделали толерантными к гербицидам с помощью методов генной инженерии, входят, например, резистентные к глифосфату и глюфосинату сорта кукурузы, имеющиеся в продаже под торговыми наименованиями RoundupReady® и LibertyLink®. Термин «культурные растения» также охватывает те культуры, которые были выведены для улучшения их устойчивости к вредным насекомым путем генетической модификации, например, Bt-кукуруза (устойчивая к мотыльку кукурузному), Bt-хлопок (устойчивый к долгоносику хлопковому), а также Bt-картофель (устойчивый к колорадскому жуку). Bt-токсин представляет собой белок, продуцируемый бактериями *Bacillus thuringiensis*. Подобные токсины или генетически модифицированные растения, способные синтезировать такие токсины, описаны, например, в WO 95/34656 и WO 03/052073. В число примеров трансгенных растений, содержащих один или более генов, кодирующих для усиления устойчивости к насекомым и экспрессирования одного или более токсинов, входят KnockOut® (кукуруза), Bollgard® (хлопок) и NewLeaf® (картофель).

Другие полезные растения включают газонную траву, например, для полей для гольфа, площадок для игр, парков и обочин дорог, или выращиваемую на продажу для газонов, а также декоративные растения, такие как цветы или кустарники. Композиции согласно настоящему изобретению могут быть использованы для борьбы с сорняками. Сорняки, с которыми необходимо бороться, могут быть как однодольными видами, например, *Agrostis*, *Alopecurus*, *Avena*, *Brachiaria*, *Bromus*, *Cenchrus*, *Cyperus*, *Digitaria*, *Echinochloa*, *Eleusine*, *Lolium*, *Monochoria*, *Rottboellia*, *Sagittaria*, *Scirpus*, *Setaria* и *Sorghum*, так и двудольными видами, например, *Abutilon*, *Amaranthus*, *Ambrosia*, *Chenopodium*, *Chrysanthemum*, *Conyza*, *Galium*, *Ipomoea*, *Nasturtium*, *Sida*, *Sinapis*, *Solanum*, *Stellaria*, *Veronica*, *Viola* и *Xanthium*. Было показано, что соединения согласно настоящему изобретению особенно хорошо действуют против определенных видов сорных трав, в частности, *Lolium multiflorum* и *Echinochloa crus-galli*, и видов сорных цветов, в частности, *Amaranthus retroflexus*, *Veronica persica*. Сорняки могут также включать растения, которые в ином случае можно считать культурными растениями, но которые растут без специально предназначенной посевной площади («дички»), или которые вырастают из семян, остающихся от предыдущих культур («самосевы»). Эти самосевы или дички могут быть толерантными к определенным другим гербицидам, и эта толерантность может возникать либо естественным путем за счет селекции, либо за счет генетической модификации.

### Примеры

Соединения формулы (N) могут быть получены с помощью реакции амина с сульфеном формулы (A), необязательно с добавлением подходящего основания, такого как диизопропилэтиламин.



### Схема 1

Сульфены формулы (A) могут быть получены в результате окисления сульфидов формулы (B) подходящим окислителем, таким как 3-хлорпербензойная кислота. Сульфиды формулы (B) могут быть получены в результате реакции β-кетонамина формулы (C), или синтетического эквивалента, с S-метилизотиомочевинной и подходящим основанием, например ацетатом натрия.

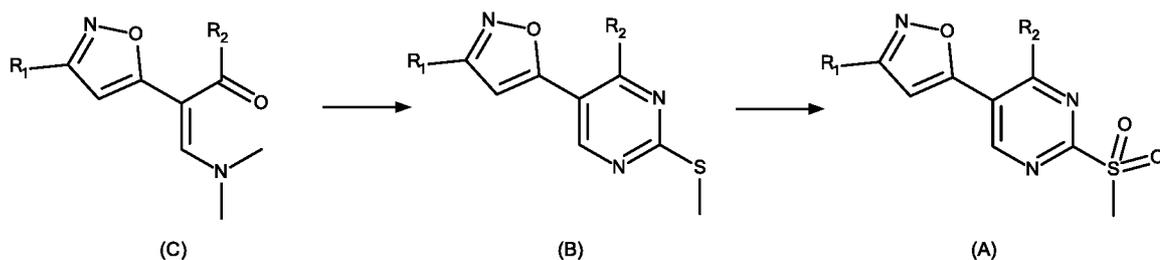


Схема 2

В качестве альтернативы соединения формулы (N) могут быть получены в результате алкилирования соединений формулы (D) алкилбромидом (или последовательными алкилбромидами), или синтетическим эквивалентом. Амины формулы (D) могут быть получены в результате реакции соединений формулы (C) с гуанидином. Кроме того, соединения формулы (N) могут быть получены в результате реакции соединений формулы (C) с замещенным гуанидином формулы (E).

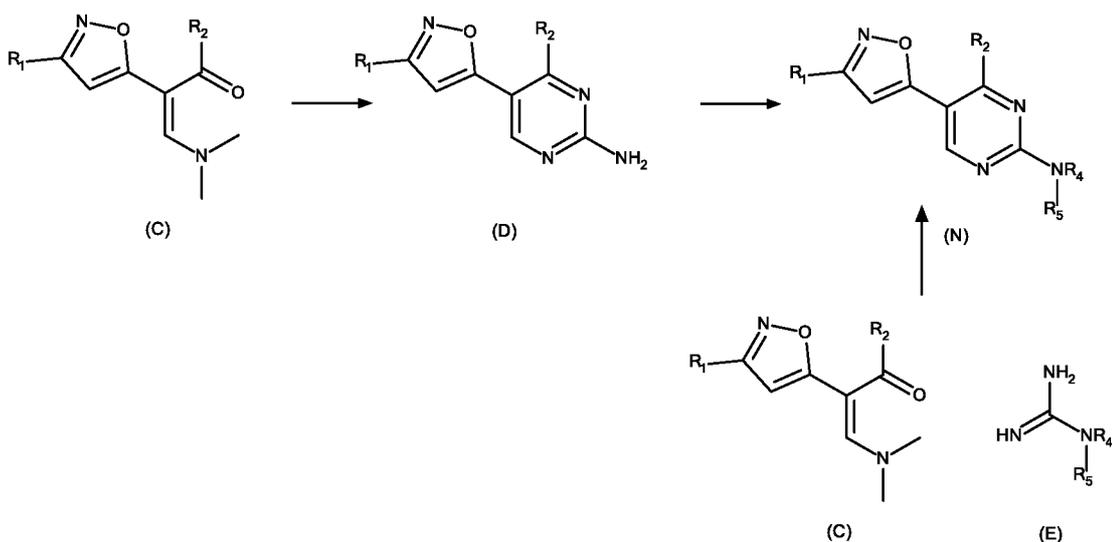


Схема 3

β-кетоенамин формулы (C) может быть получен с использованием (диметоксиметил)диметиламина и кетонов формулы (F), которые сами могут быть получены с использованием 3-замещенных-5-метилизоксазолов формулы (G), соединения формулы (H) и сильного основания, такого как бутиллитий. Подходящие соединения формулы (H) могут включать, например, амид Вайнреба (X = N(OMe)Me) или сложный метиловый эфир (X = OMe).

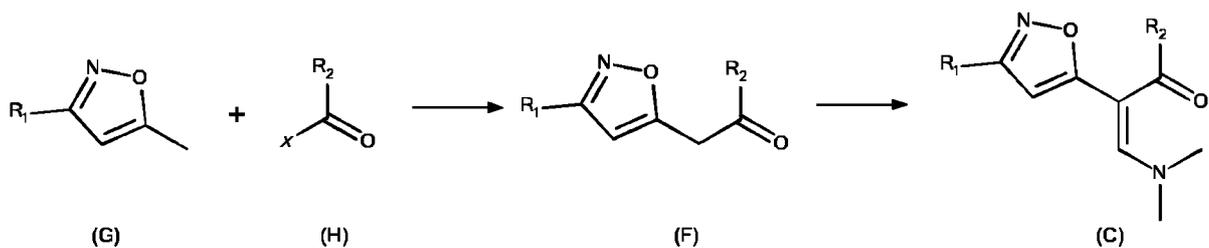


Схема 4

Пиримидины формулы (I) также могут быть получены посредством реакции кросс-сочетания гетероарильных бромидов формулы (J) (или аналогичных арилгалидов или эквивалентов) с подходящим партнером по гетероциклическому соединению, таким как бороновая кислота. В качестве альтернативы соединения формулы (J) могут быть преобразованы в бороновую кислоту, ее эфир или подобное вещество перед реакцией кросс-сочетания с подходящим гетероциклическим галидом или эквивалентом. Специалистам в данной области хорошо известно, что для реакций кросс-сочетания может быть использован, например, [1,1'-бис(дифенилфосфино)ферроцен] дихлорпалладий. Соединения формулы (J) могут быть образованы с помощью реакции пиримидинов формулы (K) с бромлирующим средством, таким как N-бромсукцинимид. Аминопиримидины формулы (K) могут быть получены в результате нуклеофильного ароматического замещения хлорпиримидинов формулы (L) подходящим амином (M) с помощью методов, хорошо известных специалисту в данной области. В качестве альтернативы соединения формулы (K) могут быть получены с помощью методов, подобных описанным Goswami, Shyamaprosad и др. (*Australian Journal of Chemistry* (2007), 60(2), 120-123) или Voerner, Armin и др. (WO2009/024323 A2 2009-02-26).

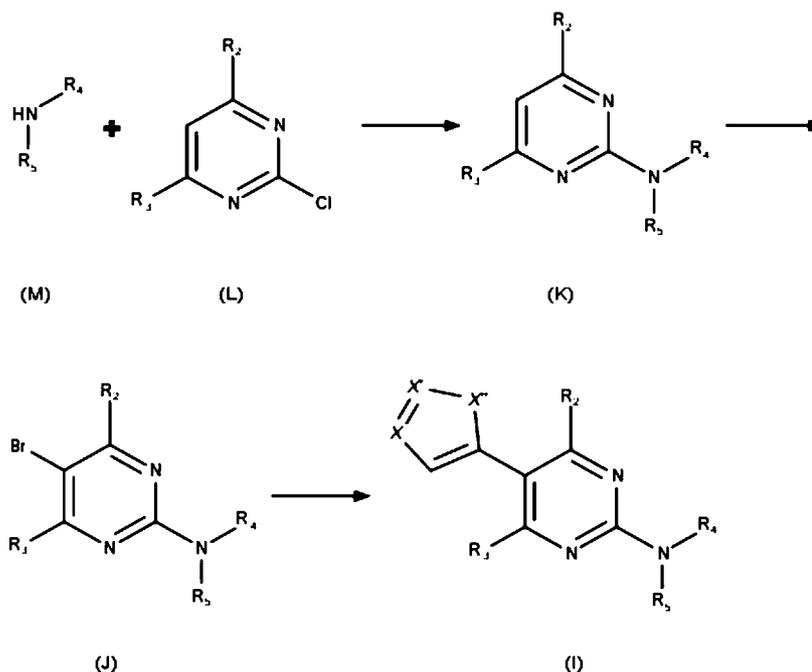


Схема 5

**Пример 1:** 5-(3-метил-1,2-оксазол-5-ил)-4-(5-метилфуран-2-ил)пиримидин-2-амин (2)

Этап 1: BuLi (2,5 М в гексанах, 5,0 ммоль) добавляли по каплям в перемешиваемый раствор 3,5-диметилизоксазола (5,15 ммоль) в тетрагидрофуране (10 мл) при температуре  $-78\text{ }^{\circ}\text{C}$ . Полученную смесь перемешивали при температуре  $-78\text{ }^{\circ}\text{C}$  в течение 75 мин, затем по каплям добавляли метил 5-метилфуран-2-карбоксилат (5,66 ммоль). Полученной смеси давали нагреться до комнатной температуры и перемешивали в течение 8 ч. Добавляли насыщенный водный раствор  $\text{NH}_4\text{Cl}$  (30 мл) и  $\text{Et}_2\text{O}$  (30 мл) и смесь экстрагировали с помощью  $\text{EtOAc}$ . Объединенные органические экстракты промывали рассолом, сушили над  $\text{Na}_2\text{SO}_4$  и концентрировали. Неочищенную реакционную смесь подвергали колоночной флэш-хроматографии (гексан/ $\text{EtOAc}$ ) с получением 2-(3-метил-1,2-оксазол-5-ил)-1-(5-метилфуран-2-ил)этан-1-она (17%) в виде желтого твердого вещества;  $^1\text{H}$  ЯМР (600 МГц,  $\text{CDCl}_3$ ) 7,22 (д,  $J = 3,5$  Гц, 1H), 6,21 (д,  $J = 3,2$  Гц, 1H), 6,12 (с, 1H), 4,21 (с, 2H), 2,42 (с, 3H), 2,28 (с, 3H); МС:  $\text{M}+\text{H}=206$ .

Этап 2: 2-(3-метил-1,2-оксазол-5-ил)-1-(5-метилфуран-2-ил)этан-1-он (0,55 ммоль) растворяли в (диметоксиметил)диметилаmine (5,5 моль) и нагревали до  $100\text{ }^{\circ}\text{C}$  в течение 3 ч. Реакционную смесь охлаждали до комнатной

температуры и концентрировали. Полученную смесь подвергали распределительной экстракции в системе насыщенный водный раствор  $\text{NH}_4\text{Cl}$ - $\text{EtOAc}$ . Объединенные органические экстракты промывали рассолом, сушили над  $\text{Na}_2\text{SO}_4$  и концентрировали. Неочищенную реакционную смесь подвергали колоночной флэш-хроматографии ( $\text{CH}_2\text{Cl}_2/\text{MeOH}$ ) с получением 3-(диметиламино)-2-(3-метил-1,2-оксазол-5-ил)-1-(5-метилфуран-2-ил)проп-2-ен-1-она (94%) в виде желтого твердого вещества;  $^1\text{H}$  ЯМР (600 МГц,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  7,79 (с, 1H), 6,20 (д, J = 3,3 Гц, 1H), 6,02 (с, 1H), 5,93 (д, J = 2,9 Гц, 1H), 2,91 (ушир, с, 6H), 2,30 (с, 3H), 2,28 (с, 3H); МС: М+Н=261.

Этап 3: Гуанидингидрохлорид (2,0 ммоль) и  $\text{K}_2\text{CO}_3$  (4,0 ммоль) добавляли в перемешиваемый раствор 3-(диметиламино)-2-(3-метил-1,2-оксазол-5-ил)-1-(5-метилфуран-2-ил)проп-2-ен-1-он (0,5 ммоль) при комнатной температуре. Полученную смесь нагревали до 70 °С в течение 18 ч. Реакционную смесь охлаждали до комнатной температуры и подвергали распределительной экстракции в системе вода- $\text{EtOAc}$ . Объединенные органические экстракты промывали рассолом, сушили над  $\text{Na}_2\text{SO}_4$  и концентрировали. Неочищенную реакционную смесь подвергали колоночной флэш-хроматографии (гексан/ $\text{EtOAc}$ ) с получением 5-(3-метил-1,2-оксазол-5-ил)-4-(5-метилфуран-2-ил)пиримидин-2-амин (84%) в виде белого твердого вещества;  $^1\text{H}$  ЯМР (600 МГц,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  8,29 (с, 1H), 6,60 (д, J = 3,4 Гц, 1H), 6,18 (с, 1H), 6,08 (д, J = 3,5 Гц, 1H), 5,28 (ушир, с, 2H), 2,38 (с, 3H), 2,33 (с, 3H); МС: М+Н=257.

**Пример 2:** N-циклопентил-4-циклопропил-5-(3-метил-1,2-оксазол-5-ил)пиримидин-2-амин (**13**)

Этап 1:  $\text{BuLi}$  (2,5 М в гексанах, 55 ммоль) добавляли по каплям в перемешиваемый раствор 3,5-диметилизоксазола (55 ммоль) в тетрагидрофуране (90 мл) при температуре -78 °С. Полученную смесь перемешивали при температуре -78 °С в течение 90 мин, затем по каплям добавляли N-метокси-N-метилциклопропанкарбоксамид (50 ммоль) в тетрагидрофуране (5 мл). Полученной смеси давали нагреться до комнатной температуры и перемешивали в течение 16 ч. Добавляли насыщенный водный раствор  $\text{NH}_4\text{Cl}$  (30 мл) и  $\text{Et}_2\text{O}$  (30 мл) и смесь экстрагировали с помощью  $\text{EtOAc}$ . Объединенные органические экстракты промывали рассолом, сушили над  $\text{Na}_2\text{SO}_4$  и концентрировали. Неочищенную реакционную смесь подвергали колоночной флэш-хроматографии (гексан/ $\text{EtOAc}$ ) с получением 1-циклопропил-2-(3-метил-1,2-оксазол-5-ил)этан-1-

она (70%) в виде желтого маслянистого вещества;  $^1\text{H}$  ЯМР (600 МГц,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  6,07 (с, 1H), 3,97 (с, 2H), 2,29 (с, 3H), 2,04–1,99 (м, 1H), 1,13–1,10 (м, 2H), 0,98–0,95 (м, 2H); МС: М+Н=166.

Этап 2: (диметоксиметил)диметиламин (35 ммоль) добавляли в перемешиваемый раствор 1-циклопропил-2-(3-метил-1,2-оксазол-5-ил)этан-1-она (29 ммоль) в бензоле (120 мл) и полученную смесь нагревали при температуре 80 °С в течение 16 ч. Реакционную смесь охлаждали до комнатной температуры и концентрировали. Смесь растирали с  $\text{Et}_2\text{O}$  (30 мл) и собирали твердое вещество фильтрованием с получением 1-циклопропил-3-(диметиламино)-2-(3-метил-1,2-оксазол-5-ил)проп-2-ен-1-она (61%) в виде белого твердого вещества;  $^1\text{H}$  ЯМР (600 МГц,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  7,75 (с, 1H), 6,09 (с, 1H), 3,37–2,46 (м, 6H), 2,33 (с, 3H), 1,74–1,68 (м, 1H), 1,07–0,95 (м, 2H), 0,75–0,62 (м, 2H).

Этап 3: Полусульфат S-метилизотиомочевины (17 ммоль) и ацетат натрия (63 ммоль) добавляли в размешиваемый раствор 1-циклопропил-3-(диметиламино)-2-(3-метил-1,2-оксазол-5-ил)проп-2-ен-1-она (15 ммоль) в N,N-диметилформамиде (50 мл) при комнатной температуре. Полученную смесь нагревали при температуре 85 °С в течение 4 с и затем держали при комнатной температуре в течение 16 ч. Смесь концентрировали и подвергали распределительной экстракции в системе водный раствор  $\text{NH}_4\text{Cl}-\text{Et}_2\text{O}$ . Объединенные органические экстракты промывали рассолом, сушили над  $\text{Na}_2\text{SO}_4$  и концентрировали с получением 4-циклопропил-5-(3-метил-1,2-оксазол-5-ил)-2-(метилсульфанил)пиримидин (87%) в виде грязно-белого твердого вещества;  $^1\text{H}$  ЯМР (600 МГц,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  8,54 (с, 1H), 6,37 (с, 1H), 2,54 (с, 3H), 2,39 (с, 3H), 2,38–2,34 (м, 1H), 1,36–1,30 (м, 2H), 1,15–1,09 (м, 2H).

Этап 4: 3-хлорпербензойную кислоту (22 ммоль) добавляли порционно в перемешиваемый раствор 4-циклопропил-5-(3-метил-1,2-оксазол-5-ил)-2-(метилсульфанил)пиримидина (10 ммоль) в  $\text{CHCl}_3$  (120 мл) при температуре 5 °С. Полученной смеси давали нагреться до комнатной температуры и перемешивали в течение 18 ч. Добавляли водный раствор  $\text{Na}_2\text{SO}_3$  (20 мл) и смесь подвергали распределительной экстракции в системе насыщенный водный раствор  $\text{NaHCO}_3-\text{CHCl}_3$ . Объединенные органические экстракты промывали рассолом, сушили  $\text{Na}_2\text{SO}_4$  и концентрировали с получением 4-циклопропил-2-метансульфонил-5-(3-метил-1,2-оксазол-5-ил)пиримидин (94%) в виде белого твердого вещества;  $^1\text{H}$

ЯМР (600 МГц, CDCl<sub>3</sub>) δ 8,91 (с, 1H), 6,57 (с, 1H), 3,34 (с, 3H), 2,61–2,48 (м, 1H), 2,44 (с, 3H), 1,52–1,43 (м, 2H), 1,39–1,27 (м, 2H); МС: М+Н=280.

Этап 5: Циклопентиламин (1,0 ммоль) добавляли в размешиваемый раствор 4-циклопропил-2-метансульфонил-5-(3-метил-1,2-оксазол-5-ил)пиримидина (0,5 ммоль) и диизопропилэтиламина (1,0 ммоль) в MeCN (2 мл) и полученную смесь перемешивали в течение 24 ч при комнатной температуре. Осадок собирали фильтрованием и промывали водой. Неочищенную реакционную смесь подвергали колоночной флэш-хроматографии (гексан/EtOAc) с получением N-циклопентил-4-циклопропил-5-(3-метил-1,2-оксазол-5-ил)пиримидин-2-амина (88%) в виде белого твердого вещества; <sup>1</sup>H ЯМР (600 МГц, CDCl<sub>3</sub>) δ 8,34 (с, 1H), 6,21 (с, 1H), 5,17 (с, 1H), 4,23 (с, 1H), 2,35 (с, 3H), 2,29 (с, 1H), 2,04 (дт, J = 12,4, 6,3 Гц, 2H), 1,76–1,69 (м, 2H), 1,68–1,61 (м, 2H), 1,58 (с, 2H), 1,50–1,41 (м, 2H), 1,22 (с, 2H), 1,00 (дд, J = 7,7, 3,0 Гц, 2H); МС: М+Н=285.

**Пример 3:** N-этил-N-метил-5-(3-метил-1,2-оксазол-5-ил)-4-(пропан-2-ил)пиримидин-2-амин (**1**)

Этап 1: BuLi (2,5 М в гексанах, 55 ммоль) добавляли по каплям в размешиваемый раствор 3,5-диметилизоксазола (55 ммоль) в тетрагидрофуране (90 мл) при температуре –78 °С. Полученную смесь перемешивали при температуре –78 °С в течение 90 мин, затем по каплям добавляли N-метокси-N,2-диметилпропанамид (50 ммоль) в тетрагидрофуране (5 мл). Полученной смеси давали нагреться до комнатной температуры и перемешивали в течение 16 ч. Добавляли насыщенный водный раствор NH<sub>4</sub>Cl (30 мл) и Et<sub>2</sub>O (30 мл) и смесь экстрагировали с помощью EtOAc. Объединенные органические экстракты промывали рассолом, сушили над Na<sub>2</sub>SO<sub>4</sub> и концентрировали. Неочищенную реакционную смесь подвергали колоночной флэш-хроматографии (гексан/EtOAc) с получением 3-метил-1-(3-метил-1,2-оксазол-5-ил)бутан-2-она (78%) в виде желтого маслянистого вещества; <sup>1</sup>H ЯМР (600 МГц, CDCl<sub>3</sub>) δ 6,07 (с, 1H), 3,88 (с, 2H), 2,78–2,65 (м, 1H), 2,29 (с, 3H), 1,17–1,14 (м, 6H).

Этап 2: (Диметоксиметил)диметиламин (24 ммоль) добавляли в размешиваемый раствор 3-метил-1-(3-метил-1,2-оксазол-5-ил)бутан-2-она (20 ммоль) в бензоле (90 мл) и полученную смесь нагревали при температуре 80 °С в течение 16 ч. Реакционную смесь охлаждали до комнатной температуры и концентрировали. Смесь растворяли в Et<sub>2</sub>O, фильтровали через уголь и концентрировали с

получением 1-(диметиламино)-4-метил-2-(3-метил-1,2-оксазол-5-ил)пент-1-ен-3-она (95%) в виде желтого маслянистого вещества;  $^1\text{H}$  ЯМР (600 МГц,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  7,75 (с, 1H), 6,03 (с, 1H), 3,31–2,67 (м, 6H), 2,63 (дт,  $J = 13,4, 6,7$  Гц, 1H), 2,32 (с, 3H), 1,00 (д,  $J = 6,7$  Гц, 6H).

Этап 3: Полусульфат S-метилизотиомочевины (15 ммоль) и ацетат натрия (55 ммоль) добавляли в размешиваемый раствор 1-(диметиламино)-4-метил-2-(3-метил-1,2-оксазол-5-ил)пент-1-ен-3-она (13 ммоль) в N,N-диметилформамиде (50 мл) при комнатной температуре. Полученную смесь нагревали при температуре 85 °С в течение 4 с и затем держали при комнатной температуре в течение 16 ч. Смесь концентрировали и подвергали распределительной экстракции в системе водный раствор  $\text{NH}_4\text{Cl-Et}_2\text{O}$ . Объединенные органические экстракты промывали рассолом, сушили над  $\text{Na}_2\text{SO}_4$  и концентрировали с получением 5-(3-метил-1,2-оксазол-5-ил)-2-(метилсульфанил)-4-(пропан-2-ил)пиримидина (86%) в виде желтого твердого вещества;  $^1\text{H}$  ЯМР (600 МГц,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  8,59 (с, 1H), 6,28 (с, 1H), 3,43–3,29 (м, 1H), 2,61 (с, 3H), 2,39 (с, 3H), 1,28 (дд,  $J = 14,8, 6,7$  Гц, 6H); МС: М+Н=250.

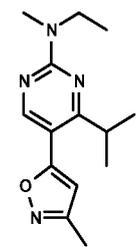
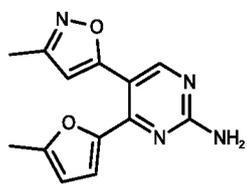
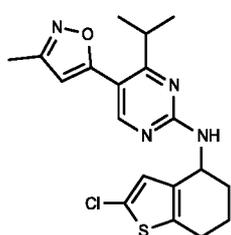
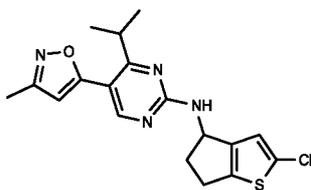
Этап 4: 3-хлорпербензойную кислоту (9,8 ммоль) добавляли порционно в перемешиваемый раствор 5-(3-метил-1,2-оксазол-5-ил)-2-(метилсульфанил)-4-(пропан-2-ил)пиримидина (4,7 ммоль) в  $\text{CHCl}_3$  (100 мл) при температуре 5 °С. Полученной смеси давали нагреться до комнатной температуры и перемешивали в течение 18 ч. Добавляли водный раствор  $\text{Na}_2\text{SO}_3$  (20 мл) и смесь подвергали распределительной экстракции в системе насыщенный водный раствор  $\text{NaHCO}_3\text{-CHCl}_3$ . Объединенные органические экстракты промывали рассолом, сушили над  $\text{Na}_2\text{SO}_4$  и концентрировали с получением 2-метансульфонил-5-(3-метил-1,2-оксазол-5-ил)-4-(пропан-2-ил)пиримидина (88%) в виде белого твердого вещества;  $^1\text{H}$  ЯМР (600 МГц,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  9,01 (с, 1H), 6,50 (с, 1H), 3,63–3,51 (м, 1H), 3,41 (с, 3H), 2,44 (с, 3H), 1,37 (д,  $J = 6,7$  Гц, 6H).

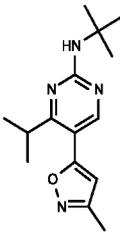
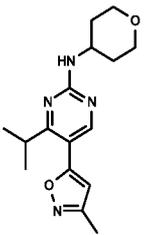
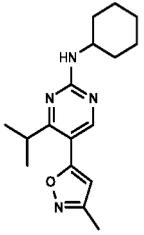
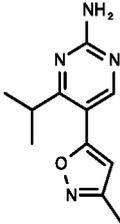
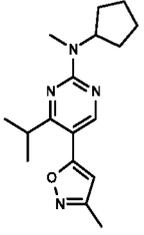
Этап 5: Этил(метил)амин (2,4 ммоль) добавляли в перемешиваемый раствор 2-метансульфонил-5-(3-метил-1,2-оксазол-5-ил)-4-(пропан-2-ил)пиримидина (0,6 ммоль) в  $\text{MeCN}$  (2,5 мл) и полученную смесь перемешивали в течение 48 ч при комнатной температуре, затем концентрировали. Неочищенную реакционную смесь подвергали колоночной флэш-хроматографии ( $\text{CH}_2\text{Cl}_2/\text{MeOH}$ ) с получением N-этил-N-метил-5-(3-метил-1,2-оксазол-5-ил)-4-(пропан-2-ил)пиримидин-2-амин (91%) в виде белого твердого вещества;  $^1\text{H}$  ЯМР (600 МГц,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  8,42 (с, 1H),

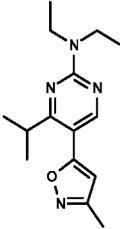
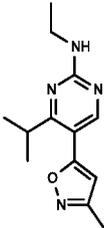
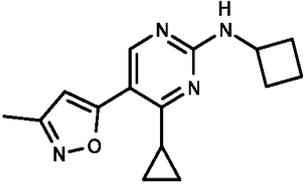
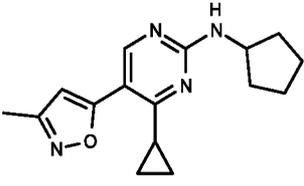
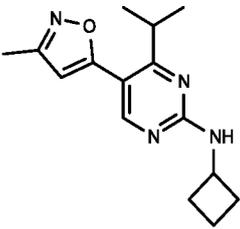
6,10 (с, 1H), 3,73 (к, J = 7,0 Гц, 2H), 3,37–3,25 (м, 1H), 3,20 (с, 3H), 2,35 (с, 3H), 1,24 (д, J = 6,7 гц, 6H), 1,20 (т, J = 7,1 Гц, 3H); МС: М+Н=261.

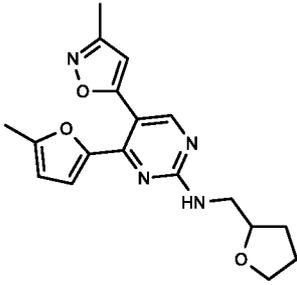
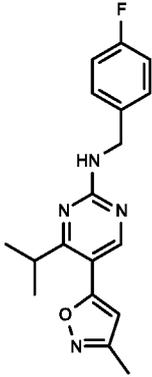
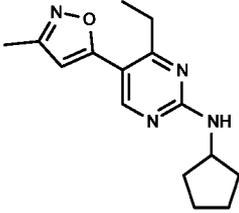
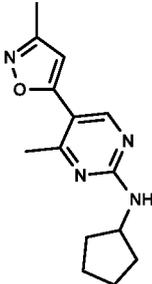
Измерения МС проводили прямой инъекцией с использованием масс-спектрометра Advion CMS S с диапазоном массы 10–1200, ионизацией ESI или APCI, зондом ESI или APCI/ASAP или Plate Express, гексапольным/квадрупольным детектором. Спектры <sup>1</sup>H ЯМР регистрировали с помощью приборов Varian NMR System 600 (600 МГц) с тетраметилсиланом в качестве внутреннего стандарта. Химические сдвиги даны в миллионных долях (м. д.), спектры измеряли в CDCl<sub>3</sub> (<sup>1</sup>H δ 7,26 м. д.) или ДМСО-d<sub>6</sub> (<sup>1</sup>H δ 2,50 м. д.).

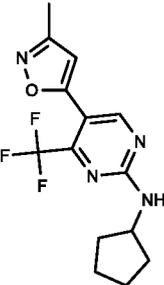
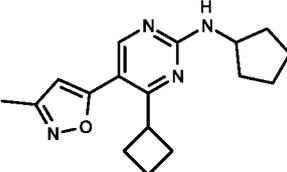
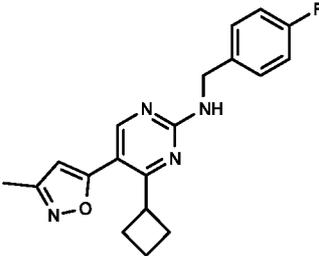
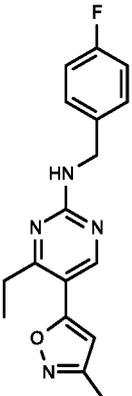
Таблица 1. Примеры соединений соглас изобретению

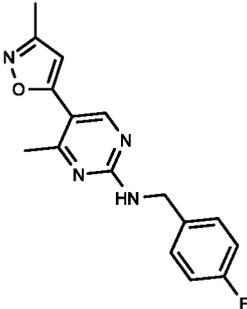
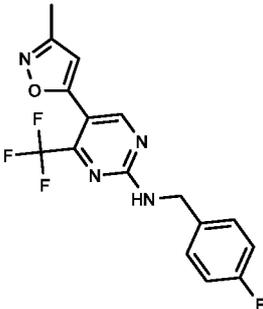
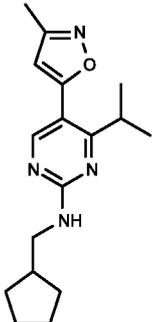
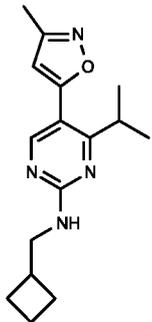
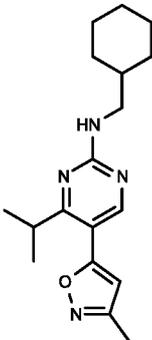
Соединение	Структура	Данные ЯМР
1		<sup>1</sup> H ЯМР (600 МГц, CDCl <sub>3</sub> ) δ 8,42 (с, 1H), 6,10 (с, 1H), 3,73 (к, J = 7,0 Гц, 2H), 3,37–3,25 (м, 1H), 3,20 (с, 3H), 2,35 (с, 3H), 1,24 (д, J = 6,7 Гц, 6H), 1,20 (т, J = 7,1 Гц, 3H).
2		<sup>1</sup> H ЯМР (600 МГц, CDCl <sub>3</sub> ) δ 8,29 (с 1H), 6,60 (д, J = 3,4 Гц, 1H), 6,18 (с, 1H), 6,08 (д, J = 3,5 Гц, 1H), 5,28 (ушир, с, 2H), 2,38 (с, 3H), 2,33 (с, 3H).
3		<sup>1</sup> H ЯМР (600 МГц, CDCl <sub>3</sub> ) δ 8,39 (с, 1H), 6,76 (с, 1H), 6,15 (с, 1H), 5,46 (д, J = 7,9 Гц, 1H), 5,18 (с, 1H), 3,30 (с, 1H), 2,75 (дт, J = 16,2, 5,6 Гц, 1H), 2,67 (дт, J = 16,7, 5,9 Гц, 1H), 2,36 (с, 3H), 2,14–2,07 (м, 1H), 1,97 (д, J = 5,4 Гц, 1H), 1,94–1,84 (м, 2H), 1,24 (с, 6H).
4		<sup>1</sup> H ЯМР (600 МГц, CDCl <sub>3</sub> ) δ 8,41 (с, 1H), 6,79 (с, 1H), 6,15 (с, 1H), 5,46 (с, 2H), 3,30 (с, 1H), 3,07–3,00 (м, 1H), 2,98–2,92 (м, 1H), 2,91–2,84 (м, 1H), 2,36 (с, 3H), 2,24 (с, 3H).

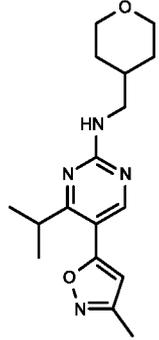
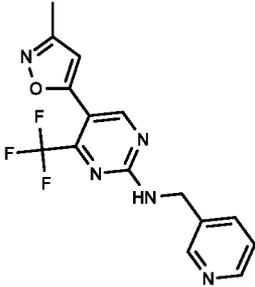
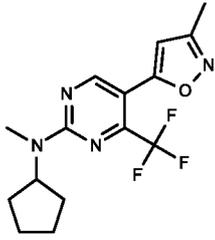
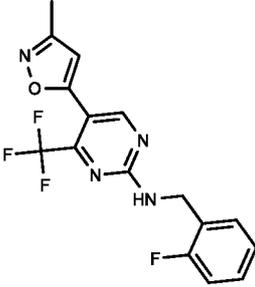
		(ддд, J = 12,9, 9,5, 4,6 Гц, 1H), 1,24 (с, 6H).
5		<sup>1</sup> H ЯМР (600 МГц, CDCl <sub>3</sub> ) δ 8,35 (с, 1H), 6,11 (с, 1H), 5,32 (с, 1H), 3,37–3,18 (м, 1H), 2,35 (с, 3H), 1,48 (с, 9H), 1,31–1,16 (м, 6H).
6		<sup>1</sup> H ЯМР (600 МГц, CDCl <sub>3</sub> ) δ 8,39 (с, 1H), 6,13 (с, 1H), 5,23 (д, J = 6,8 Гц, 1H), 4,14–4,05 (м, 1H), 4,01 (дт, J = 11,9, 3,5 Гц, 1H), 3,56 (тд, J = 11,6, 2,1 Гц, 1H), 3,28 (дт, J = 13,1, 6,5 Гц, 1H), 2,36 (с, 1H), 2,07 (д, J = 11,0 Гц, 1H), 1,59 (кд, J = 11,2, 4,4 Гц, 1H), 1,22 (т, J = 8,6 Гц, 6H).
7		<sup>1</sup> H ЯМР (600 МГц, CDCl <sub>3</sub> ) δ 8,37 (с, 1H), 6,11 (с, 1H), 5,20 (д, J = 6,1 Гц, 1H), 3,95–3,79 (м, 1H), 3,27 (дт, J = 13,1, 6,6 Гц, 1H), 2,35 (с, 3H), 2,06 (дд, J = 12,4, 3,0 Гц, 2H), 1,82–1,73 (м, 2H), 1,65 (дд, J = 9,0, 4,0 Гц, 1H), 1,49–1,39 (м, 2H), 1,33–1,14 (м, 9H).
8		<sup>1</sup> H ЯМР (600 МГц, CDCl <sub>3</sub> ) δ 8,40 (с, 1H), 6,16 (с, 1H), 5,23 (с, 2H), 3,34–3,21 (м, 1H), 2,36 (с, 3H), 1,23 (д, J = 6,7 Гц, 6H).
9		<sup>1</sup> H ЯМР (600 МГц, CDCl <sub>3</sub> ) δ 8,42 (с, 1H), 6,10 (с, 1H), 5,30–5,15 (м, 1H), 3,38–3,19 (м, 1H), 3,08 (с, 3H), 2,35 (с, 3H), 1,94–1,85 (м, 2H), 1,79–1,71 (м, 2H), 1,64 (ддт, J = 20,1, 14,9, 8,3 Гц, 4H), 1,25 (дд, J = 15,3, 6,9 Гц, 6H).

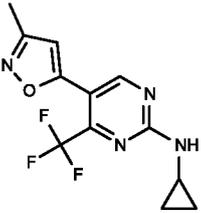
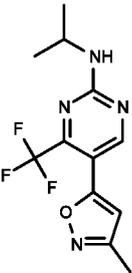
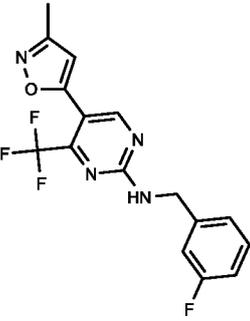
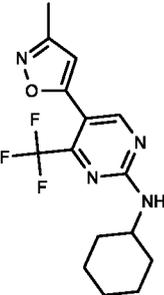
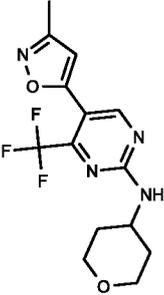
10		$^1\text{H}$ ЯМР (600 МГц, $\text{CDCl}_3$ ) $\delta$ 8,41 (д, $J = 6,0$ Гц, 1H), 6,09 (с, 1H), 3,67 (к, $J = 7,0$ Гц, 4H), 3,34–3,22 (м, 1H), 2,35 (с, 3H), 1,27–1,15 (м, 12H).
11		$^1\text{H}$ ЯМР (600 МГц, $\text{CDCl}_3$ ) $\delta$ 8,39 (с, 1H), 6,12 (с, 1H), 5,27 (с, 1H), 3,57–3,45 (м, 2H), 3,28 (дт, $J = 13,4, 6,7$ Гц, 1H), 2,35 (с, 3H), 1,26 (т, $J = 7,2$ Гц, 3H), 1,22 (т, $J = 8,0$ Гц, 6H).
12		$^1\text{H}$ ЯМР (600 МГц, $\text{CDCl}_3$ ) $\delta$ 8,34 (с, 1H), 6,21 (с, 1H), 5,17 (с, 1H), 4,23 (с, 1H), 2,35 (с, 3H), 2,29 (с, 1H), 2,03 (дт, $J = 12,6, 6,3$ Гц, 2H), 1,77–1,69 (м, 2H), 1,64 (тт, $J = 11,1, 5,4$ Гц, 2H), 1,46 (тд, $J = 13,7, 7,2$ Гц, 2H), 1,22 (с, 2H), 1,00 (дд, $J = 7,6, 3,0$ Гц, 2H).
13		$^1\text{H}$ ЯМР (600 МГц, $\text{CDCl}_3$ ) $\delta$ 8,34 (с, 1H), 6,21 (с, 1H), 5,17 (с, 1H), 4,23 (с, 1H), 2,35 (с, 3H), 2,29 (с, 1H), 2,04 (дт, $J = 12,4, 6,3$ Гц, 2H), 1,76–1,69 (м, 2H), 1,68–1,61 (м, 2H), 1,58 (с, 2H), 1,50–1,41 (м, 2H), 1,22 (с, 2H), 1,00 (дд, $J = 7,7, 3,0$ Гц, 2H).
14		$^1\text{H}$ ЯМР (600 МГц, $\text{CDCl}_3$ ) $\delta$ 8,38 (с, 1H), 6,11 (с, 1H), 5,45 (с, 1H), 4,59–4,43 (м, 1H), 3,27 (дт, $J = 13,3, 6,7$ Гц, 1H), 2,51–2,38 (м, 2H), 2,35 (с, 3H), 2,03–1,88 (м, 2H), 1,85–1,72 (м, 2H), 1,22 (д, $J = 6,6$ Гц, 6H).

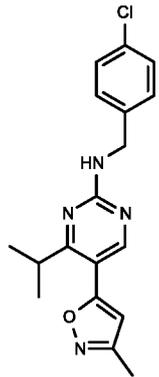
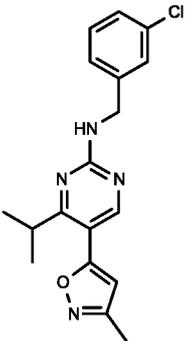
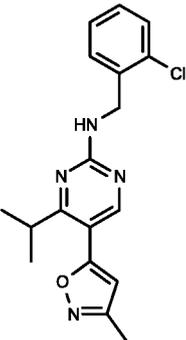
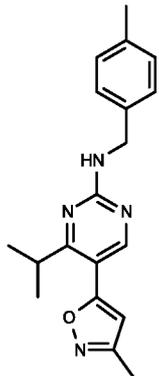
86		$^1\text{H}$ ЯМР (600 МГц, $\text{CDCl}_3$ ) $\delta$ 8,29 (с, 1H), 6,58 (ушир. с, 1H), 6,15 (с, 1H), 6,07 (д, $J = 2,7$ Гц, 1H), 5,70 (ушир. с, 1H), 4,16–4,07 (м, 1H), 3,92 (дд, $J = 14,7, 7,0$ Гц, 1H), 3,78 (дд, $J = 14,5, 7,6$ Гц, 1H), 3,76–3,68 (м, 1H), 3,54 (ушир. с, 1H), 2,37 (с, 3H), 2,30 (с, 3H), 2,05–1,98 (м, 1H), 1,98–1,89 (м, 2H), 1,66 (тд, $J = 15,5, 7,6$ Гц, 1H).
93		$^1\text{H}$ ЯМР (600 МГц, $\text{CDCl}_3$ ) $\delta$ 8,40 (с, 1H), 7,34 (дд, $J = 8,5, 5,5$ Гц, 2H), 7,09–6,93 (м, 2H), 6,13 (с, 1H), 5,64 (с, 1H), 4,65 (д, $J = 6,0$ Гц, 2H), 3,39–3,16 (м, 1H), 2,36 (с, 3H), 1,23 (т, $J = 14,1$ Гц, 6H).
103		$^1\text{H}$ ЯМР (600 МГц, $\text{CDCl}_3$ ) $\delta$ 8,46 (с, 1H), 6,13 (с, 1H), 5,28 (д, $J = 5,9$ Гц, 1H), 4,34 (дд, $J = 13,5, 6,7$ Гц, 1H), 2,80 (д, $J = 7,2$ Гц, 2H), 2,35 (с, 3H), 2,15–2,00 (м, 2H), 1,79–1,71 (м, 2H), 1,70–1,62 (м, 2H), 1,50 (тд, $J = 14,0, 7,5$ Гц, 2H), 1,26 (т, $J = 7,3$ Гц, 3H).
92		$^1\text{H}$ ЯМР (600 МГц, $\text{CDCl}_3$ ) $\delta$ 8,51 (с, 1H), 6,14 (с, 1H), 5,28 (д, $J = 6,7$ Гц, 1H), 4,38–4,30 (м, 1H), 2,51 (с, 3H), 2,35 (с, 3H), 2,07 (тд, $J = 12,4, 6,6$ Гц, 2H), 1,80–1,69 (м, 2H), 1,70–1,61 (м, 2H), 1,53–1,44 (м, 2H).

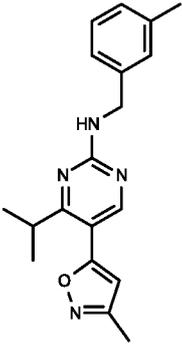
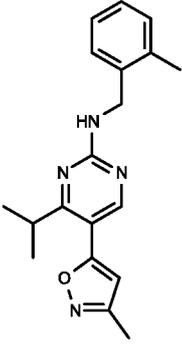
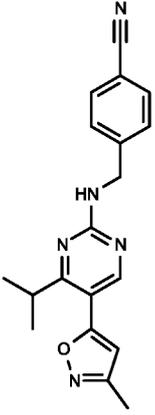
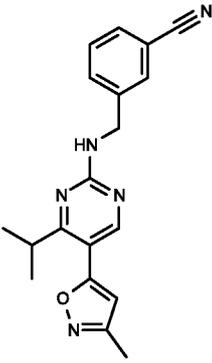
91		<sup>1</sup> H ЯМР (600 МГц, CDCl <sub>3</sub> ) δ 8,76–8,64 (м, 1H), 6,29 (с, 1H), 5,60 (д, J = 18,0 Гц, 1H), 4,43–4,30 (м, 1H), 2,36 (с, 3H), 2,15–2,06 (м, 2H), 1,81–1,72 (м, 2H), 1,72–1,64 (м, 2H), 1,54–1,47 (м, 2H). 428
104		<sup>1</sup> H ЯМР (600 МГц, CDCl <sub>3</sub> ) δ 8,39 (с, 1H), 6,08 (с, 1H), 5,31 (с, 1H), 4,37 (с, 1H), 3,82 (п, J = 8,5 Гц, 1H), 2,45 (д, J = 28,2 Гц, 2H), 2,35 (с, 3H), 2,22 (д, J = 7,5 Гц, 2H), 2,11 (дд, J = 12,1, 5,6 Гц, 2H), 2,01 (дк, J = 17,8, 8,9 Гц, 1H), 1,90 (с, 1H), 1,80–1,72 (м, 2H), 1,71–1,63 (м, 2H), 1,56–1,49 (м, 2H).
105		<sup>1</sup> H ЯМР (600 МГц, CDCl <sub>3</sub> ) δ 8,41 (с, 1H), 7,36 (дд, J = 8,2, 5,5 Гц, 2H), 7,03 (т, J = 8,6 Гц, 2H), 6,09 (д, J = 11,1 Гц, 1H), 5,66 (с, 1H), 4,70 (с, 2H), 3,83 (п, J = 8,3 Гц, 1H), 2,40 (тт, J = 18,1, 9,2 Гц, 2H), 2,35 (с, 3H), 2,25–2,17 (м, 2H), 2,05–1,95 (м, 1H), 1,87 (дд, J = 19,6, 9,6 Гц, 1H).
106		<sup>1</sup> H ЯМР (600 МГц, CDCl <sub>3</sub> ) δ 8,41 (с, 1H), 7,34 (дд, J = 8,4, 5,5 Гц, 2H), 7,04 (дт, J = 17,3, 8,5 Гц, 2H), 6,15 (с, 1H), 5,65 (с, 1H), 4,66 (д, J = 6,0 Гц, 2H), 2,89–2,75 (м, 2H), 2,36 (с, 3H), 1,29–1,20 (м, 3H).

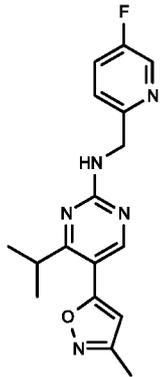
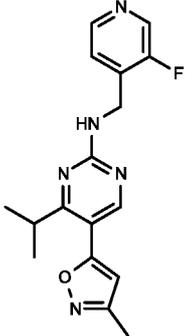
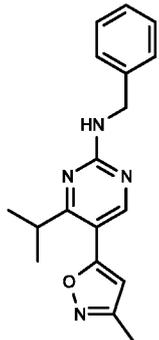
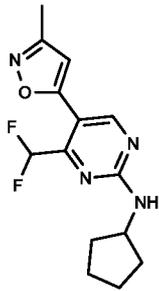
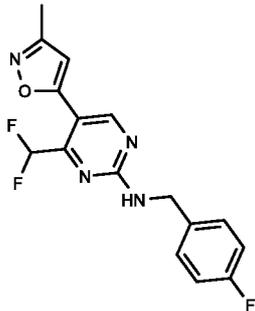
128		$^1\text{H}$ ЯМР (600 МГц, $\text{CDCl}_3$ ) $\delta$ 8,53 (с, 1H), 7,32 (дд, $J = 8,4, 5,5$ Гц, 2H), 7,02 (т, $J = 8,7$ Гц, 2H), 6,16 (с, 1H), 5,61 (с, 1H), 4,66 (д, $J = 6,0$ Гц, 2H), 2,54 (с, 3H), 2,36 (с, 3H).
127		$^1\text{H}$ ЯМР (600 МГц, $\text{CDCl}_3$ ) $\delta$ 8,78 (с, 0,5H), 8,70 (с, 0,5H), 7,34 (с, 2H), 7,09–6,96 (м, 2H), 6,31 (с, 1H), 5,95 (с, 1H), 4,68 (с, 2H), 2,37 (с, 3H). Ротамеры присутствуют.
107		$^1\text{H}$ ЯМР (600 МГц, $\text{CDCl}_3$ ) $\delta$ 8,40 (с, 1H), 6,12 (с, 1H), 5,29 (с, 1H), 3,41 (с, 2H), 3,27 (дт, $J = 13,1, 6,5$ Гц, 1H), 2,35 (с, 3H), 2,23–2,11 (м, 1H), 1,81 (с, 2H), 1,69–1,63 (м, 2H), 1,60–1,53 (м, 2H), 1,31–1,26 (м, 2H), 1,23 (д, $J = 6,5$ Гц, 6H).
87		$^1\text{H}$ ЯМР (600 МГц, $\text{CDCl}_3$ ) $\delta$ 8,38 (с, 1H), 6,12 (с, 1H), 5,25 (с, 1H), 3,50 (т, $J = 5,9$ Гц, 2H), 3,27 (дт, $J = 13,3, 6,5$ Гц, 1H), 2,66–2,53 (м, 1H), 2,35 (с, 3H), 2,10 (с, 2H), 1,97–1,86 (м, 2H), 1,81–1,71 (м, 2H), 1,23 (д, $J = 6,4$ Гц, 6H).
108		$^1\text{H}$ ЯМР (600 МГц, $\text{CDCl}_3$ ) $\delta$ 8,37 (с, 1H), 6,11 (с, 1H), 5,34 (с, 1H), 3,33 (с, 2H), 3,30–3,23 (м, 1H), 2,35 (с, 3H), 1,81 (д, $J = 10,7$ Гц, 2H), 1,77–1,72 (м, 2H), 1,68 (д, $J = 12,1$ Гц, 1H), 1,63–1,59 (м, 1H), 1,27–1,17 (м, 7H), 1,05–0,96 (м, 2H).

109		$^1\text{H}$ ЯМР (600 МГц, $\text{CDCl}_3$ ) $\delta$ 8,38 (с, 1H), 6,12 (с, 1H), 5,37 (с, 1H), 4,00 (дд, $J = 11,3, 3,8$ Гц, 2H), 3,71–3,41 (м, 4H), 3,29–3,27 (м, 1H), 2,35 (с, 3H), 1,89–1,87 (м, 1H), 1,70 (д, $J = 12,2$ Гц, 2H), 1,39 (ддд, $J = 25,1, 12,2, 4,5$ Гц, 2H), 1,28 – 1,24 (м, 6H).
110		$^1\text{H}$ ЯМР (600 МГц, $\text{CDCl}_3$ ) $\delta$ 8,73 (с, 0,5H), 8,69 (с, 0,5H), 6,29 (с, 1H), 5,76 (д, $J = 23,0$ Гц, 1H), 4,63–4,39 (м, 1H), 2,52–2,40 (м, 2H), 2,36 (с, 3H), 2,04–1,87 (м, 2H), 1,78 (дт, $J = 18,8, 10,3$ Гц, 2H). Ротамеры присутствуют.
111		$^1\text{H}$ ЯМР (600 МГц, $\text{CDCl}_3$ ) $\delta$ 8,74 (с, 1H), 8,65 (с, 1H), 8,56 (д, $J = 4,7$ Гц, 1H), 7,71 (с, 1H), 7,28 (дт, $J = 10,4, 5,1$ Гц, 1H), 6,32 (с, 1H), 6,00 (с, 1H), 4,74 (с, 2H), 2,37 (с, 3H).
112		$^1\text{H}$ ЯМР (600 МГц, $\text{CDCl}_3$ ) $\delta$ 8,71 (с, 1H), 6,27 (с, 1H), 5,22 (дд, $J = 16,7, 8,3$ Гц, 1H), 3,11 (с, 3H), 2,35 (с, 3H), 1,98–1,85 (м, 2H), 1,86–1,71 (м, 2H), 1,71–1,57 (м, 4H).
113		$^1\text{H}$ ЯМР (600 МГц, $\text{CDCl}_3$ ) $\delta$ 8,76 (с, 0,5H), 8,68 (с, 0,5H), 7,52–7,34 (м, 1H), 7,28–7,27 (м, 1H), 7,15–6,99 (м, 2H), 6,30 (с, 1H), 6,04 (с, 0,5H), 6,99 (с, 0,5H), 4,76 (с, 2H), 2,36 (с, 3H). Ротамеры присутствуют.

114		$^1\text{H}$ ЯМР (600 МГц, $\text{CDCl}_3$ ) $\delta$ 8,80 (с, 1H), 6,31 (с, 1H), 5,79 (с, 1H), 2,89 (дт, $J = 10,2, 3,3$ Гц, 1H), 2,37 (с, 3H), 0,90 (т, $J = 10,3$ Гц, 2H), 0,64–0,59 (м, 2H). 428
115		$^1\text{H}$ ЯМР (600 МГц, $\text{CDCl}_3$ ) $\delta$ 8,74 (с, 0,5H), 8,67 (с, 0,5H), 6,29 (с, 1H), 5,48 (с, 1H), 4,24 (дг, $J = 13,0, 6,6$ Гц, 1H), 2,36 (с, 3H), 1,29 (д, $J = 6,5$ Гц, 6H). Ротамеры присутствуют.
126		$^1\text{H}$ ЯМР (600 МГц, $\text{CDCl}_3$ ) $\delta$ 8,77 (с, 0,5H), 8,72 (с, 0,5H), 7,32 (дд, $J = 13,9, 7,9$ Гц, 1H), 7,18–7,04 (м, 2H), 6,99 (тд, $J = 8,4, 2,3$ Гц, 1H), 6,32 (с, 1H), 5,99 (с, 1H), 4,72 (с, 2H), 2,37 (с, 3H). Ротамеры присутствуют.
125		$^1\text{H}$ ЯМР (600 МГц, $\text{CDCl}_3$ ) $\delta$ 8,72 (с, 0,5H), 8,66 (с, 0,5H), 6,28 (с, 1H), 5,56 (с, 1H), 4,01–3,81 (м, 1H), 2,36 (с, 3H), 2,05 (дд, $J = 11,9, 3,7$ Гц, 2H), 1,77 (д, $J = 13,1$ Гц, 2H), 1,66 (дд, $J = 9,1, 4,1$ Гц, 1H), 1,50–1,36 (м, 2H), 1,34–1,17 (м, 3H). Ротамеры присутствуют.
116		$^1\text{H}$ ЯМР (600 МГц, $\text{CDCl}_3$ ) $\delta$ 8,74 (с, 0,5H), 8,69 (с, 0,5H), 6,31 (с, 1H), 5,57 (с, 1H), 4,12 (дд, $J = 14,3, 7,1$ Гц, 1H), 4,02 (дд, $J = 8,5, 3,1$ Гц, 2H), 3,55 (дд, $J = 16,6, 6,5$ Гц, 2H), 2,37 (с, 3H), 2,06 (д, $J = 14,0$ Гц, 2H), 1,60 (ддд, $J = 21,6, 10,0, 3,2$ Гц, 2H). Ротамеры присутствуют.

102		$^1\text{H}$ ЯМР (600 МГц, $\text{CDCl}_3$ ) $\delta$ 8,40 (с, 1H), 7,30 (с, 2H), 7,26 (с, 2H), 6,13 (с, 1H), 5,63 (с, 1H), 4,66 (д, $J = 6,1$ Гц, 2H), 3,35–3,20 (м, 1H), 2,36 (с, 3H), 1,21 (д, $J = 6,7$ Гц, 6H).
117		$^1\text{H}$ ЯМР (600 МГц, $\text{CDCl}_3$ ) $\delta$ 8,41 (с, 1H), 7,41 (д, $J = 30,6$ Гц, 1H), 7,28–7,22 (м, 3H), 6,14 (с, 1H), 5,66 (с, 1H), 4,67 (д, $J = 6,2$ Гц, 2H), 3,36–3,19 (м, 1H), 2,36 (с, 3H), 1,21 (д, $J = 6,7$ Гц, 6H).
101		$^1\text{H}$ ЯМР (600 МГц, $\text{CDCl}_3$ ) $\delta$ 8,40 (с, 1H), 7,50–7,45 (м, 1H), 7,38 (дт, $J = 7,6, 4,0$ Гц, 1H), 7,22 (дд, $J = 5,4, 3,7$ Гц, 2H), 6,12 (с, 1H), 5,80 (с, 1H), 4,77 (дд, $J = 14,5, 6,2$ Гц, 2H), 3,37–3,17 (м, 1H), 2,35 (с, 3H), 1,22 (д, $J = 6,7$ Гц, 6H).
100		$^1\text{H}$ ЯМР (600 МГц, $\text{CDCl}_3$ ) $\delta$ 8,40 (с, 1H), 7,27 (д, $J = 6,3$ Гц, 2H), 7,15 (д, $J = 7,7$ Гц, 2H), 6,13 (с, 1H), 5,59 (с, 1H), 4,64 (д, $J = 5,5$ Гц, 2H), 3,28 (дт, $J = 13,2, 6,4$ Гц, 1H), 2,35 (с, 3H), 2,34 (с, 3H), 1,22 (д, $J = 6,6$ Гц, 6H).

99		$^1\text{H}$ ЯМР (600 МГц, $\text{CDCl}_3$ ) $\delta$ 8,40 (с, 1H), 7,20 (дт, $J = 21,5, 7,6$ Гц, 3H), 7,09 (д, $J = 7,4$ Гц, 1H), 6,13 (с, 1H), 5,62 (с, 1H), 4,63 (дд, $J = 22,0, 5,6$ Гц, 2H), 3,28 (дк, $J = 13,2, 6,5$ Гц, 1H), 2,36 (с, 3H), 2,35 (с, 3H), 1,23 (д, $J = 6,7$ Гц, 6H). 428
98		$^1\text{H}$ ЯМР (600 МГц, $\text{CDCl}_3$ ) $\delta$ 8,40 (с, 1H), 7,33 (д, $J = 7,0$ Гц, 1H), 7,23–7,16 (м, 3H), 6,13 (с, 1H), 5,46 (с, 1H), 4,67 (с, 2H), 3,29 (дт, $J = 13,4, 6,6$ Гц, 1H), 2,39 (с, 3H), 2,36 (с, 3H), 1,23 (д, $J = 6,6$ Гц, 6H).
118		$^1\text{H}$ ЯМР (600 МГц, $\text{CDCl}_3$ ) $\delta$ 8,41 (с, 1H), 7,63 (д, $J = 8,2$ Гц, 2H), 7,47 (д, $J = 8,1$ Гц, 2H), 6,14 (с, 1H), 5,72 (с, 1H), 4,75 (д, $J = 6,3$ Гц, 2H), 3,27 (дт, $J = 13,4, 6,7$ Гц, 1H), 2,36 (с, 3H), 1,17 (с, 6H).
97		$^1\text{H}$ ЯМР (600 МГц, $\text{CDCl}_3$ ) $\delta$ 8,41 (с, 1H), 7,68 (с, 1H), 7,61 (д, $J = 7,8$ Гц, 1H), 7,56 (д, $J = 7,6$ Гц, 1H), 7,44 (т, $J = 7,7$ Гц, 1H), 6,15 (с, 1H), 5,76 (с, 1H), 4,72 (д, $J = 6,3$ Гц, 2H), 3,38–3,17 (м, 1H), 2,36 (с, 3H), 1,23 (дд, $J = 47,6, 11,6$ Гц, 6H).

96		$^1\text{H}$ ЯМР (600 МГц, $\text{CDCl}_3$ ) $\delta$ 8,44–8,43 (м, 2H), 7,38–7,34 (м, 2H), 6,22 (с, 1H), 6,14 (с, 1H), 4,78 (д, $J = 5,6$ Гц, 2H), 3,36–3,19 (м, 1H), 2,36 (с, 3H), 1,21 (д, $J = 6,2$ Гц, 6H).
95		$^1\text{H}$ ЯМР (600 МГц, $\text{CDCl}_3$ ) $\delta$ 8,44 (с, 1H), 8,42 (с, 1H), 8,35 (д, $J = 4,7$ Гц, 1H), 7,34 (т, $J = 5,4$ Гц, 1H), 6,14 (с, 1H), 5,75 (с, 1H), 4,78 (д, $J = 6,4$ Гц, 2H), 3,27 (дт, $J = 13,3, 6,6$ Гц, 1H), 2,36 (с, 3H), 1,18 (с, 6H).
94		$^1\text{H}$ ЯМР (600 МГц, $\text{CDCl}_3$ ) $\delta$ 8,40 (с, 1H), 7,40–7,33 (м, 4H), 7,29–7,28 (м, 1H), 6,13 (с, 1H), 5,67 (с, 1H), 4,70 (д, $J = 5,8$ Гц, 2H), 3,36–3,18 (м, 1H), 2,36 (с, 3H), 1,22 (д, $J = 6,7$ Гц, 6H).
119		$^1\text{H}$ ЯМР (600 МГц, $\text{CDCl}_3$ ) $\delta$ 8,71 (с, 1H), 6,64 (т, $J = 54,0$ Гц, 1H), 6,31 (с, 1H), 5,58 (с, 1H), 4,36 (дд, $J = 13,6, 6,8$ Гц, 1H), 2,36 (с, 3H), 2,09 (д, $J = 6,0$ Гц, 2H), 1,75 (дд, $J = 14,3, 7,6$ Гц, 2H), 1,70–1,63 (м, 2H), 1,53–1,47 (м, 2H).
120		$^1\text{H}$ ЯМР (600 МГц, $\text{CDCl}_3$ ) $\delta$ 8,73 (с, 1H), 7,34 (с, 2H), 7,10–6,98 (м, 2H), 6,65 (т, $J = 53,9$ Гц, 1H), 6,34 (с, 1H), 5,88 (с, 1H), 4,68 (д, $J = 6,0$ Гц, 2H), 2,37 (с, 3H).

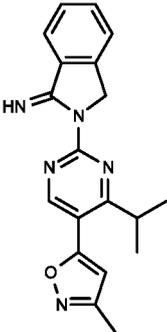
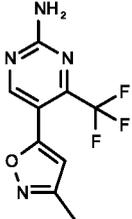
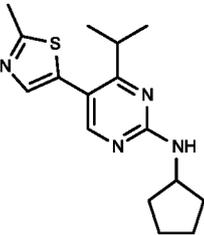
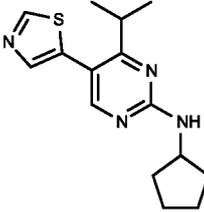
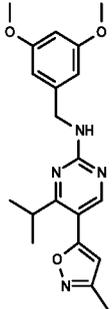
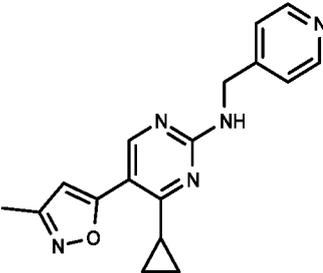
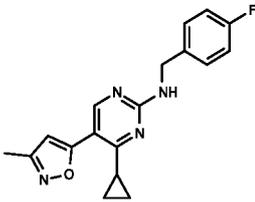
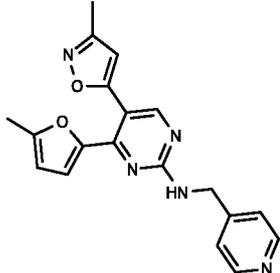
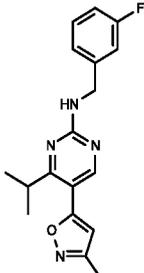
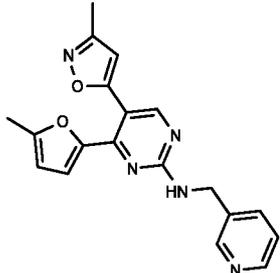
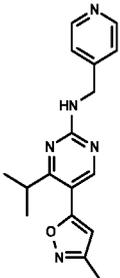
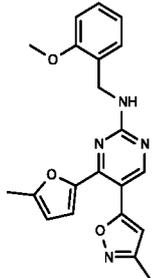
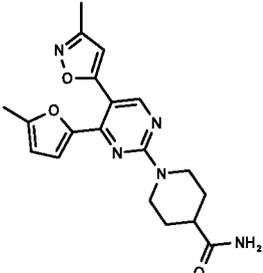
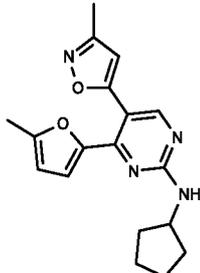
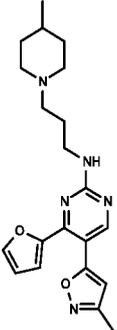
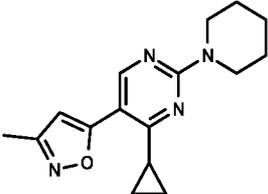
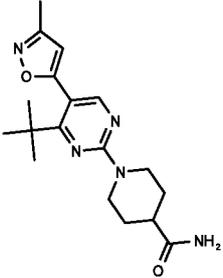
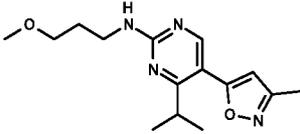
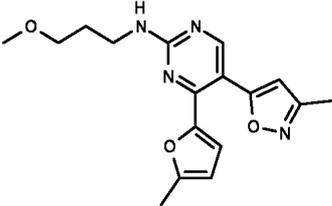
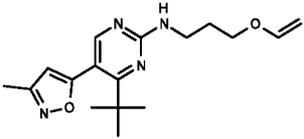
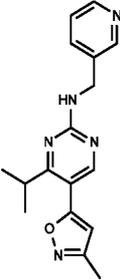
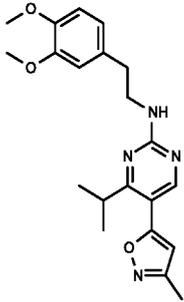
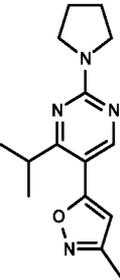
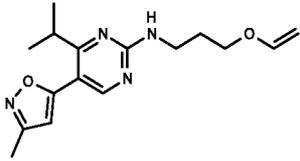
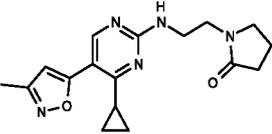
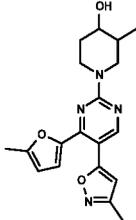
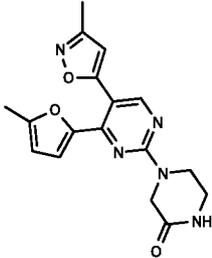
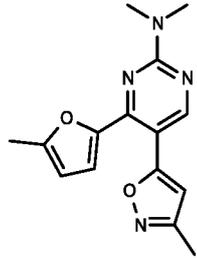
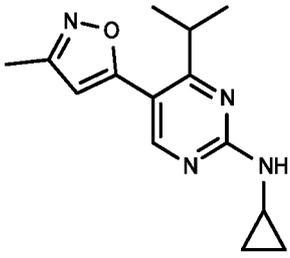
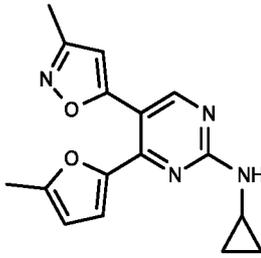
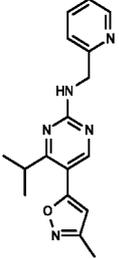
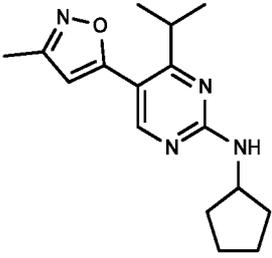
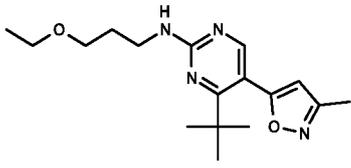
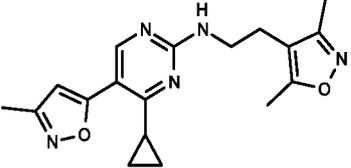
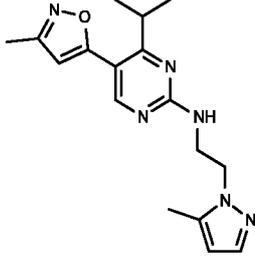
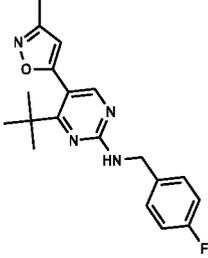
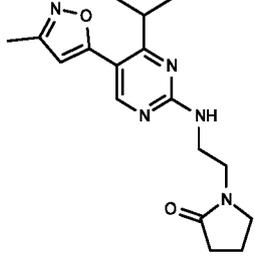
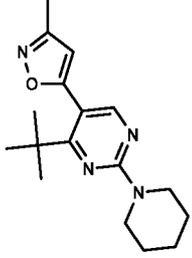
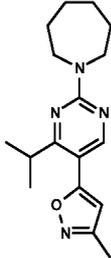
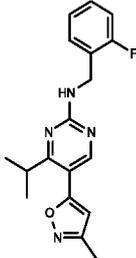
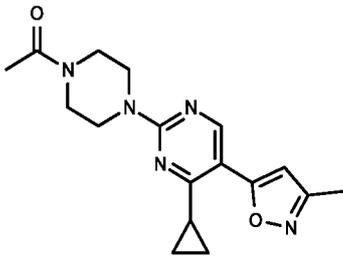
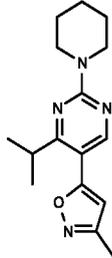
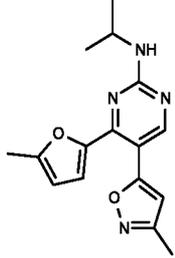
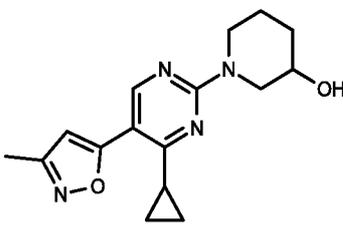
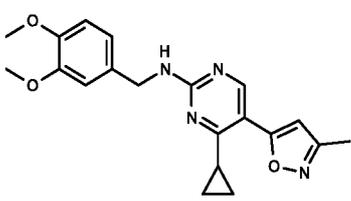
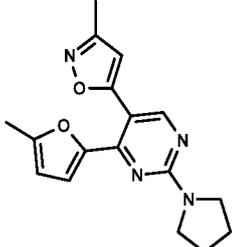
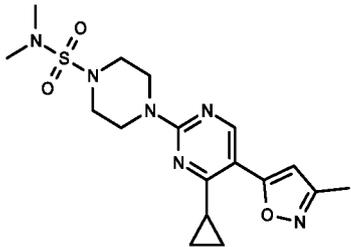
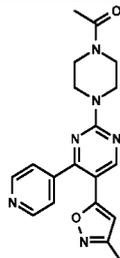
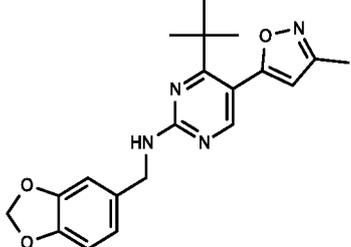
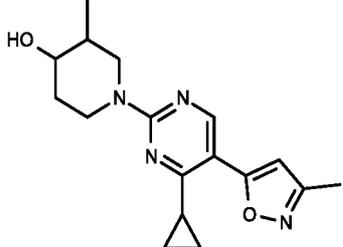
121		$^1\text{H}$ ЯМР (600 МГц, $\text{CDCl}_3$ ) $\delta$ 10,39 (с, 1H), 8,72 (с, 1H), 8,10–7,94 (м, 1H), 7,59–7,52 (м, 1H), 7,51–7,46 (м, 2H), 6,30 (с, 1H), 5,11 (с, 2H), 3,57–3,35 (м, 1H), 2,40 (с, 3H), 1,37 (д, $J = 6,7$ Гц, 6H).
122		$^1\text{H}$ ЯМР (600 МГц, $\text{CDCl}_3$ ) $\delta$ 8,75 (с, 1H), 6,33 (с, 1H), 5,68–5,49 (м, 2H), 2,37 (с, 3H).
123		$^1\text{H}$ ЯМР (400 МГц, ДМСО) $\delta$ 8,13 (с, 1H), 7,54 (с, 1H), 7,33 (с, 1H), 4,22–4,12 (м, 1H), 3,13–3,02 (м, 1H), 2,67 (с, 3H), 1,96–1,84 (м, 2H), 1,73–1,63 (м, 2H), 1,57–1,46 (м, 4H), 1,13 (д, $J = 6,8$ Гц, 6H).
124		$^1\text{H}$ ЯМР (400 МГц, ДМСО) $\delta$ 9,16 (с, 1H), 8,17 (с, 1H), 7,85 (с, 1H), 7,38 (с, 1H), 4,21–4,14 (м, 1H), 3,09–3,02 (м, 1H), 1,96–1,87 (м, 2H), 1,72–1,65 (м, 2H), 1,56–1,49 (м, 4H), 1,14 (д, $J = 6,8$ Гц, 6H).

Таблица 2. Дополнительные примеры соединений согласно изобретению

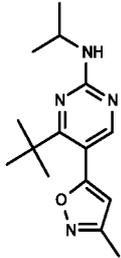
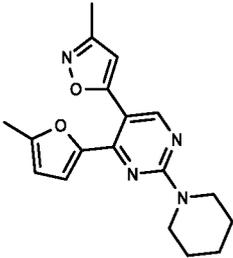
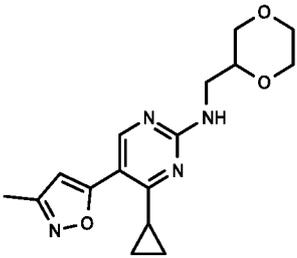
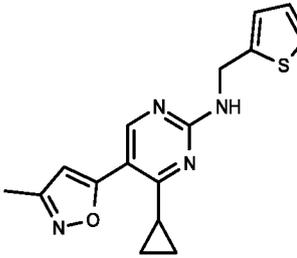
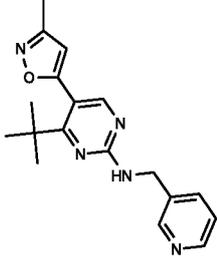
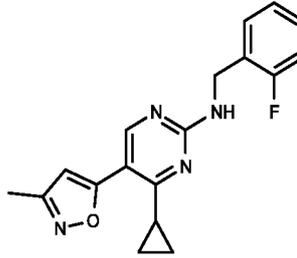
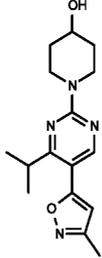
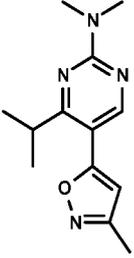
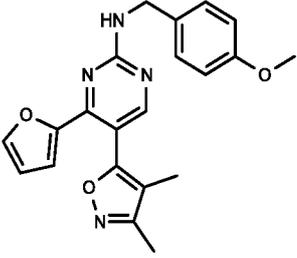
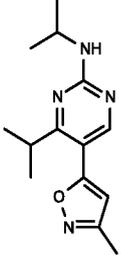
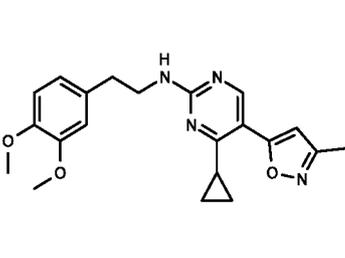
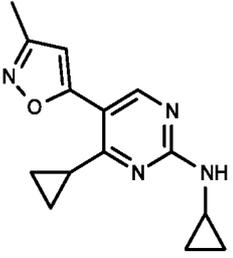
Соединение	Структура	Соединение	Структура
15		20	
16		21	
17		22	
18		23	
19		24	

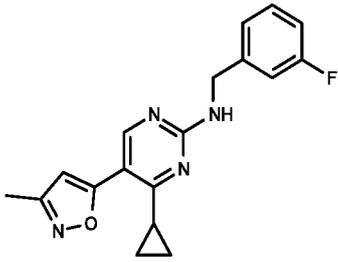
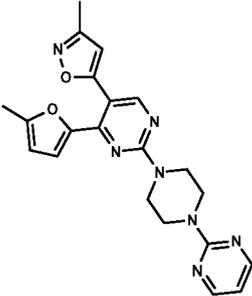
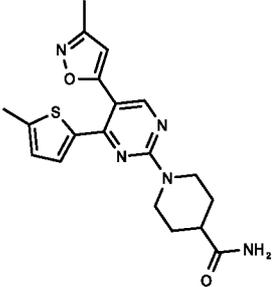
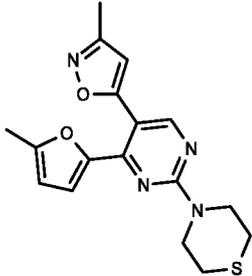
25		31	
26		32	
27		33	
28		34	
29		35	
30		36	

37		43	
38		44	
39		45	
40		46	
41		47	
42		48	

49		55	
50		56	
51		57	
52		58	
53		59	
54		60	

61		67	
62		68	
63		69	
64		70	
65		71	
66		72	

73		79	
74		80	
75		81	
76		82	
77		83	
78		84	

85		89	
88		90	

### Биологические примеры

В супесчаной почвенной смеси выращивали семена различных подопытных видов: *Lolium multiflorum* (LOLMU), *Amaranthus retroflexus* (AMARE), *Echinochloa crus-galli* (ECHCG), *Veronica persica* (VERPE), *Glycine max* (GLXMA), *Oryza sativa* (ORYSA), *Zea mays* (ZEAMX), spring wheat (TRZAS), *Ipomoea hederacea* (IPOHE), *Ipomoea purpurea* (PHBPU), *Stellaria media* (STEME), *Solanum nigrum* (SOLNI), *Digitaria sanguinalis* (DIGSA), *Setaria italica* (SETIT), *Alopecurus myosuroides* (ALOMY) и *Avena fatua* (AVEFA).

После посева, на стадии роста BBCH 12–14 (после появления всходов), растения опрыскивали водным раствором для опрыскивания, полученным из состава технического активного ингредиента в растворе ацетон/вода (50:50), содержащего 0,5% Твин 20 (полиоксиэтиленсорбитанмонолаурат, CAS RN 9005-64-5). Испытуемые соединения применяли в требуемой концентрации действующего вещества, выраженной в г/га. Затем растения выращивали в теплице при контролируемых условиях окружающей среды и регулярно поливали по мере необходимости. Через  $14 \pm 1$  день после применения (для послевсходового испытания) испытание оценивали путем определения процента повреждения, нанесенного растениям по сравнению с контрольными делянками. Биологические активности для послевсходовых испытаний показаны ниже (таблица 3 и таблица 4) в % визуального повреждения.

Таблица 3. Визуальное повреждение, нанесенное растениям в результате послевсходового испытания рядом соединений.

№	Норма расхода, г/га	LOLMU, % визуального повреждения	ЕЧСГГ, % визуального повреждения	VERPE, % визуального повреждения	AMARE, % визуального повреждения
15	1000	0	30	100	60
16	500	0	40	95	95
17	1000	0	80	100	100
18	1000	60	30	99	90
19	1000	0	20	0	70
20	500	0	0	30	80
21	500	0	20	90	50
22	500	0	50	60	60
1	500	0	50	90	70
23	500	0	50	80	70
24	500	0	70	0	50
25	500	0	30	0	30
14	500	50	100	100	100
26	500	0	30	60	0
27	500	0	20	50	70
28	500	0	70	98	90
29	500	0	50	50	0
30	500	0	70	0	60
31	500	0	30	0	70
32	500	0	100	90	90
33	500	0	70	0	80
34	500	30	80	100	70
35	500	0	60	98	0
36	500	0	30	0	30
37	500	0	0	0	50
38	500	50	60	100	100
39	500	0	20	80	70
40	500	0	30	0	70
41	500	30	60	50	95
42	500	10	50	60	70
43	500	40	60	0	50
44	500	30	20	20	70
2	500	40	10	0	30
45	500	70	100	100	100
46	500	60	70	50	90
47	500	0	50	80	40
48	500	70	10	0	20
49	500	0	60	30	50
50	500	0	50	0	60
51	500	0	70	0	0
52	500	40	70	70	80
53	500	20	50	0	20
54	500	5	40	99	40
55	500	40	70	99	100
56	500	10	0	0	70
57	500	0	50	0	70
58	500	20	10	0	0
59	500	50	0	90	0
60	500	70	30	60	60
61	500	0	0	0	60
62	500	40	50	70	70

63	500	30	50	0	70
64	500	30	60	0	60
65	500	0	30	0	60
66	500	60	20	70	70
67	500	20	40	50	60
68	500	0	0	0	80
69	500	0	0	60	50
70	500	0	20	0	80
71	500	0	60	40	90
72	500	0	30	0	90
73	500	40	70	0	70
74	500	70	80	90	100
75	500	70	40	90	98
76	500	0	30	0	80
77	500	70	80	70	70
78	500	40	80	99	95
79	500	30	60	0	90
80	500	30	80	60	60
81	500	30	80	80	98
6	250	20	98	100	100
7	250	20	100	100	100
82	250	30	70	20	0
83	250	50	100	100	98
10	250	0	30	0	0
11	250	0	80	70	100
84	250	70	100	100	80
12	250	30	90	100	100
13	250	80	100	100	100
85	250	40	100	100	100
86	1000	0	0	70	0
82	250	30	70	20	0
10	250	0	30	0	0
11	250	0	80	70	100
12	250	30	90	100	100
87	125	30	80	70	50
1	125	0	0	0	0
88	125	0	20	0	20
89	125	5	0	5	0
90	125	0	30	40	30
91	125	80	95	99	90
92	125	60	50	70	90
3	125	0	60	10	60
4	125	0	50	98	95
5	125	60	70	100	100
6	125	50	90	90	60
7	125	20	80	60	80
83	125	40	70	70	95
9	125	60	60	80	95
93	125	60	80	100	100
84	125	50	90	60	60
13	125	40	80	70	80
85	125	30	80	50	95
94	62	10	80	0	60
95	62	30	60	60	30
96	62	0	40	50	50
97	62	20	70	70	50
98	62	0	70	80	60
99	62	30	70	80	60

100	62	0	80	95	80
101	62	0	70	40	50
102	62	20	80	80	98
102	125	40	80	100	100
103	125	20	30	60	70
104	125	0	0	60	40
105	125	0	0	50	30
106	125	0	30	95	90
107	125	0	50	50	30
108	125	0	20	50	50
109	125	0	0	70	40
110	125	40	0	0	0
111	125	10	0	0	0
112	125	20	0	0	20
113	125	0	20	0	30
114	125	0	20	70	0
115	125	0	0	60	20
116	125	0	0	95	0
117	125	30	70	70	70
118	125	0	20	95	80
119	125	0	0	0	50
120	125	0	20	40	30
121	125	0	20	0	30
122	125	0	0	0	20
123	62	0	0	50	0
124	62	0	0	0	10
125	125	20	50	0	70
126	125	0	70	100	95
127	125	0	60	98	100
128	125	30	30	95	95

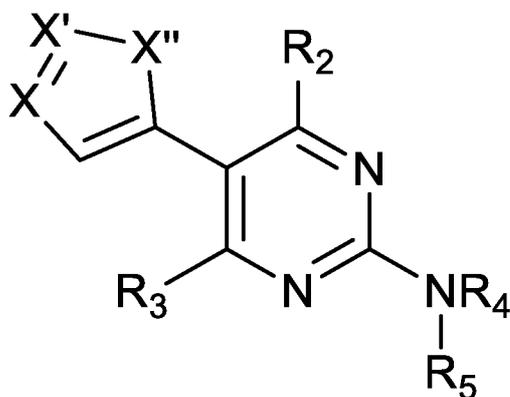
Таблица 4. Визуальное повреждение, нанесенное растениям в результате послевсходового испытания рядом соединений.

№ соединения	Норма расхода (г/га)	GLXMA, % визуального	ORYSA, % визуального	ZEAMX, % визуального	TRZAS, % визуального	AMARE, % визуального	IPONE, % визуального	РНВРУ, % визуального	STEME, % визуального	VERPE, % визуального	SOLNI, % визуального	DIGSA, % визуального	ECHCG, % визуального	SETIT, % визуального	LOLMU, % визуального	АЛОМУ, % визуального	AVEFA, % визуального
20	125	30	50	20	0	0	0	НИ	0	50	НИ						
20	250	20	60	50	0	0	0	НИ	30	60	НИ						
20	500	40	30	50	30	50	0	НИ	40	70	НИ						
20	1000	50	60	40	20	90	30	НИ	95	90	НИ						
45	125	20	50	0	0	95	0	50	100	100	98	80	70	50	40	50	0
45	250	50	99	0	30	90	50	70	100	100	100	70	80	80	60	70	40
45	500	40	90	70	30	100	40	70	100	100	100	95	80	95	90	50	60
45	1000	50	80	40	40	100	60	70	100	100	100	98	90	95	100	80	70
16	125	50	60	60	30	100	40	80	100	100	98	90	80	0	98	70	50
16	250	40	90	60	30	100	80	95	100	100	99	80	70	30	90	80	60

16	500	70	70	50	50	100	100	90	100	100	100	90	60	30	100	80	60
16	1000	50	60	70	50	100	100	90	100	100	100	90	90	60	95	80	60

## ФОРМУЛА ИЗОБРЕТЕНИЯ

1. Применение соединения общей формулы (I) или его приемлемой для сельского хозяйства соли в качестве агрохимиката:



(I)

где

**X** выбран из N, CR<sub>1</sub>;

**X'** выбран из N, CR<sub>1A</sub>;

**X''** выбран из O и S;

**R<sub>1</sub>** и **R<sub>1A</sub>** независимо выбраны из группы, состоящей из водорода, CN, нитро, галида, OR<sub>6</sub>, SR<sub>6</sub>, NR<sub>6</sub>R<sub>7</sub>, NR<sub>6</sub>OR<sub>7</sub>, NR<sub>6</sub>NR<sub>7</sub>R<sub>8</sub>, ONR<sub>6</sub>R<sub>7</sub>, ON(=CR<sub>6</sub>), R<sub>20</sub>, OR<sub>20</sub>, SR<sub>20</sub>, NR<sub>6</sub>R<sub>20</sub>, C<sub>1-6</sub> алкила, C<sub>2-6</sub> алкенила, C<sub>2-6</sub> алкинила, C<sub>3-10</sub> циклоалкила, C<sub>3-10</sub> гетероциклоалкила, C<sub>3-10</sub> циклоалкенила, C<sub>3-10</sub> гетероциклоалкенила, C<sub>6-20</sub> арила, C<sub>5-20</sub> гетероарила, любой из которых необязательно замещен;

**R<sub>2</sub>** выбран из водорода, CN, нитро, галида, OR<sub>6</sub>, SR<sub>6</sub>, NR<sub>6</sub>R<sub>7</sub>, NR<sub>6</sub>OR<sub>7</sub>, NR<sub>6</sub>NR<sub>7</sub>R<sub>8</sub>, ONR<sub>6</sub>R<sub>7</sub>, ON(=CR<sub>6</sub>), R<sub>20</sub>, OR<sub>20</sub>, SR<sub>20</sub>, NR<sub>6</sub>R<sub>20</sub>, C<sub>1-6</sub> алкила, C<sub>2-6</sub> алкенила, C<sub>2-6</sub> алкинила, C<sub>3-10</sub> циклоалкила, C<sub>3-10</sub> гетероциклоалкила, C<sub>3-10</sub> циклоалкенила, C<sub>3-10</sub> гетероциклоалкенила, C<sub>6-20</sub> арила, C<sub>5-20</sub> гетероарила, любой из которых необязательно замещен;

**R<sub>3</sub>** выбран из H, галида и C<sub>1-6</sub> алкила, которые необязательно замещены;

**R<sub>4</sub>** и **R<sub>5</sub>** независимо выбраны из H, C<sub>1-6</sub> алкила, C<sub>2-6</sub> алкенила, C<sub>2-6</sub> алкинила, C<sub>3-10</sub> циклоалкила, C<sub>3-10</sub> гетероциклоалкила, C<sub>3-10</sub> циклоалкенила, C<sub>3-10</sub> гетероциклоалкенила, C<sub>6-20</sub> арила, C<sub>5-20</sub> гетероарила, которые могут быть необязательно замещены; причем **R<sub>4</sub>** может независимо или вместе с **R<sub>5</sub>** образовывать C<sub>3-10</sub> циклоалкил, C<sub>3-10</sub> гетероциклоалкил, C<sub>3-10</sub> циклоалкенил, C<sub>3-10</sub> гетероциклоалкенил, C<sub>6-10</sub> арил или C<sub>5-10</sub> гетероарил, которые необязательно замещены;

**R<sub>6</sub>**, **R<sub>7</sub>** и **R<sub>8</sub>** независимо выбраны из группы, состоящей из H, C<sub>1-6</sub> алкила, C<sub>2-6</sub> алкенила, C<sub>2-6</sub> алкинила, C<sub>3-10</sub> циклоалкила, C<sub>3-10</sub> гетероциклоалкила, C<sub>3-10</sub> циклоалкенила, C<sub>3-10</sub> гетероциклоалкенила, C<sub>6-20</sub> арила, C<sub>5-20</sub> гетероарила, которые могут быть необязательно замещены; причем **R<sub>6</sub>** может независимо или вместе с **R<sub>7</sub>** образовывать C<sub>3-10</sub> циклоалкил, C<sub>3-10</sub> гетероциклоалкил, C<sub>3-10</sub> циклоалкенил, C<sub>3-10</sub> гетероциклоалкенил, C<sub>6-10</sub> арил или C<sub>5-10</sub> гетероарил, которые необязательно замещены;

**R<sub>20</sub>** выбран из

C(=O)R<sub>6</sub>,

C(=O)OR<sub>6</sub>, C(=O)NR<sub>6</sub>R<sub>7</sub>, C(=O)NR<sub>6</sub>C(=O)R<sub>7</sub>, C(=O)C(=O)R<sub>6</sub>, C(=O)C(=O)OR<sub>6</sub>,  
C(=O)C(=O)NR<sub>6</sub>R<sub>7</sub>, C(=O)NR<sub>7</sub>S(=O)OR<sub>6</sub>, C(=O)NR<sub>6</sub>OR<sub>7</sub>, (C=O)SR<sub>6</sub>,

S(=O)R<sub>6</sub>, S(=O)<sub>2</sub>R<sub>6</sub>, S(=O)OR<sub>6</sub>, S(=O)<sub>2</sub>OR<sub>6</sub>, S(=O)NR<sub>6</sub>R<sub>7</sub>, S(=O)<sub>2</sub>NR<sub>6</sub>R<sub>7</sub>,

S(=O)<sub>2</sub>NR<sub>7</sub>COR<sub>6</sub>, S(=O)(=NR<sub>8</sub>)NR<sub>6</sub>R<sub>7</sub>, S(=O)(=NR<sub>6</sub>)R<sub>7</sub>, S(=NR<sub>6</sub>)R<sub>7</sub>,

SC(=O)R<sub>6</sub>, SC(=O)OR<sub>6</sub>, SC(=O)NR<sub>6</sub>R<sub>7</sub>,

C(=S)R<sub>6</sub>, C(=S)OR<sub>6</sub>, C(=S)NR<sub>6</sub>R<sub>7</sub>,

CR<sub>7</sub>(=NR<sub>6</sub>), CR<sub>7</sub>(=N-OR<sub>6</sub>), COR<sub>7</sub>(=N-OR<sub>6</sub>), CNR<sub>7</sub>R<sub>8</sub>(=N-OR<sub>6</sub>), CR<sub>8</sub>(=N-NR<sub>7</sub>R<sub>6</sub>).

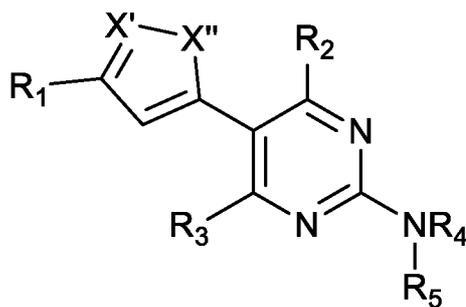
2. Применение по п. 1, в котором R<sub>1</sub> и R<sub>1A</sub> оба отличны от водорода.

3. Применение по п. 1 или 2, в котором R<sub>1</sub> выбран из CN, нитро, галида, OR<sub>6</sub>, SR<sub>6</sub>, NR<sub>6</sub>R<sub>7</sub>, NR<sub>6</sub>OR<sub>7</sub>, NR<sub>6</sub>NR<sub>7</sub>R<sub>8</sub>, ONR<sub>6</sub>R<sub>7</sub>, ON(=CR<sub>6</sub>), R<sub>20</sub>, OR<sub>20</sub>, SR<sub>20</sub>, NR<sub>6</sub>R<sub>20</sub>, C<sub>1-6</sub> алкила, C<sub>2-6</sub> алкенила, C<sub>2-6</sub> алкинила, C<sub>3-10</sub> циклоалкила, C<sub>3-10</sub> гетероциклоалкила, C<sub>3-10</sub> циклоалкенила, C<sub>3-10</sub> гетероциклоалкенила, C<sub>6-20</sub> арила, C<sub>5-20</sub> гетероарила, любой из которых необязательно замещен.

4. Применение по любому из пп. 1–3, в котором R<sub>1</sub> и R<sub>1A</sub> независимо выбраны из группы, состоящей из CN, нитро, галида, OR<sub>6</sub>, SR<sub>6</sub>, NR<sub>6</sub>R<sub>7</sub>, NR<sub>6</sub>OR<sub>7</sub>, NR<sub>6</sub>NR<sub>7</sub>R<sub>8</sub>, ONR<sub>6</sub>R<sub>7</sub>, ON(=CR<sub>6</sub>), R<sub>20</sub>, OR<sub>20</sub>, SR<sub>20</sub>, NR<sub>6</sub>R<sub>20</sub>, C<sub>1-6</sub> алкила, C<sub>2-6</sub> алкенила, C<sub>2-6</sub> алкинила, C<sub>3-10</sub> циклоалкила, C<sub>3-10</sub> гетероциклоалкила, C<sub>3-10</sub> циклоалкенила, C<sub>3-10</sub> гетероциклоалкенила, C<sub>6-20</sub> арила, C<sub>5-20</sub> гетероарила, любой из которых необязательно замещен.

5. Применение по любому из пп. 0–4, в котором необязательные заместители выбраны из одного или более из CN, нитро, галогена, OR<sub>6</sub>, SR<sub>6</sub>, NR<sub>6</sub>R<sub>7</sub>, NR<sub>6</sub>OR<sub>7</sub>, NR<sub>6</sub>NR<sub>7</sub>R<sub>8</sub>, R<sub>20</sub>, OR<sub>20</sub>, SR<sub>20</sub>, NR<sub>6</sub>R<sub>20</sub>, C<sub>1-6</sub> алкила, C<sub>3-10</sub> циклоалкила, C<sub>3-10</sub> гетероциклоалкила, C<sub>3-10</sub> циклоалкенила, C<sub>3-10</sub> гетероциклоалкенила, C<sub>6-20</sub> арила, C<sub>5-20</sub> гетероарила, C<sub>2-6</sub> алкенила и C<sub>2-6</sub> алкинила, которые сами необязательно замещены.

6. Применение по п. 1 или 0, которое представляет собой соединение общей формулы (II):



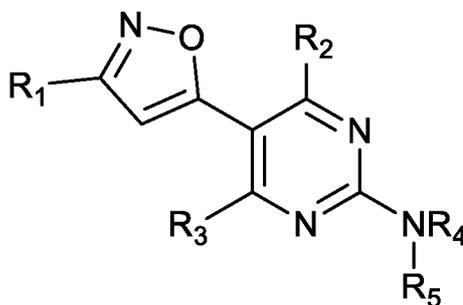
(II)

где

каждый из  $R_1$ ,  $R_2$ ,  $R_3$ ,  $R_4$  и  $R_5$  определен согласно п. 1;

$X'$  выбран из N и  $CR_{1A}$ , и  $X''$  выбран из O или S.

7. Применение по любому из пп. 0–0, в котором  $X'$  представляет собой N, и  $X''$  представляет собой O, причем соединение имеет общую формулу (III):



(III)

где

каждый из  $R_1$ ,  $R_2$ ,  $R_3$ ,  $R_4$  и  $R_5$  определен согласно п. 1.

8. Применение по любому предыдущему пункту, в котором  $R_1$  и  $R_{1A}$  (при наличии) независимо выбраны из  $C_{1-6}$  алкила,  $C_{3-6}$  циклоалкила,  $C_{1-6}$  галоалкила и галида, причем предпочтительно  $R_1$  или  $R_{1A}$  представляет собой метил.

9. Применение по любому предыдущему пункту, в котором  $R_2$  выбран из  $C_{1-6}$  алкила,  $C_{3-6}$  циклоалкила и галида, причем предпочтительно  $R_2$  представляет собой *i*-пропил, *t*-бутил или циклопропил.

10. Применение по любому предыдущему пункту, в котором  $R_3$  выбран из галида, водорода и  $C_{1-4}$  алкила, причем предпочтительно  $R_3$  представляет собой F, Cl или H.

11. Применение по любому предыдущему пункту, в котором  $R_4$  и  $R_5$  представляют собой H.

12. Применение по любому предыдущему пункту, в котором  $R_4$ , когда он отличен от H, выбран из  $C_{1-6}$  алкила,  $C_{3-10}$  циклоалкила,  $C_{3-10}$  гетероциклоалкила,  $C_{6-20}$  арила,  $C_{5-20}$  гетероарила, любой из которых необязательно замещен;

или в котором предпочтительно  $R_4$  имеет формулу  $-(CH_2)_n-Y$ ,

где  $n$  — целое число в диапазоне 0–4, и  $Y$  выбран из  $C_{1-6}$  алкила,  $C_{3-10}$  циклоалкила,  $C_{3-10}$  гетероциклоалкила,  $C_{6-20}$  арила,  $C_{5-20}$  гетероарила, любой из которых обязательно замещен;

и необязательные заместители предпочтительно выбраны из одного или более из следующего: галид, OH,  $C_{1-6}$  алкокси (предпочтительно OMe) и CN.

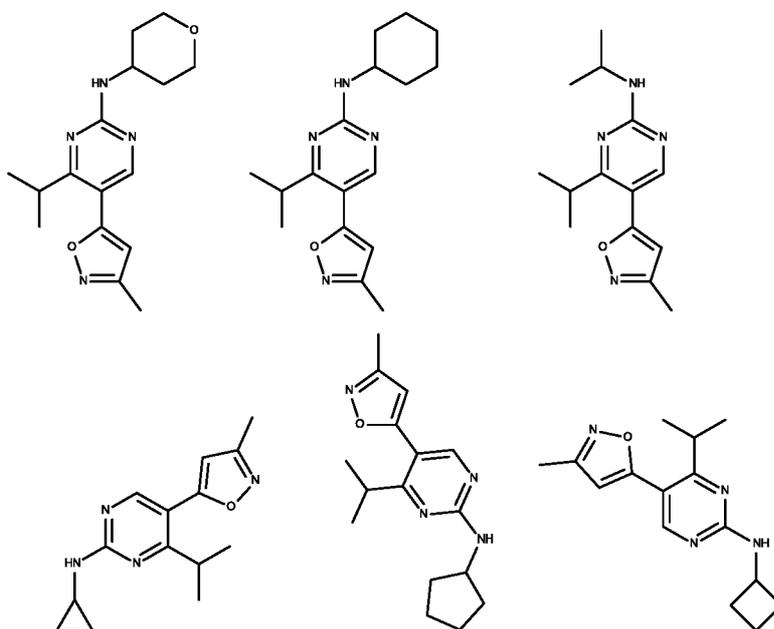
13. Применение по п. 12, в котором  $R_4$  имеет формулу  $-(CH_2)_n-Y$ , где  $n$  — целое число в диапазоне 0–4, и  $Y$  выбран из  $C_{3-10}$  циклоалкила или  $C_{3-10}$  гетероциклоалкила, которые обязательно замещены; причем предпочтительно  $Y$  выбран из циклопропила, циклобутила, циклопентила, циклогексила, диоксана и морфолина.

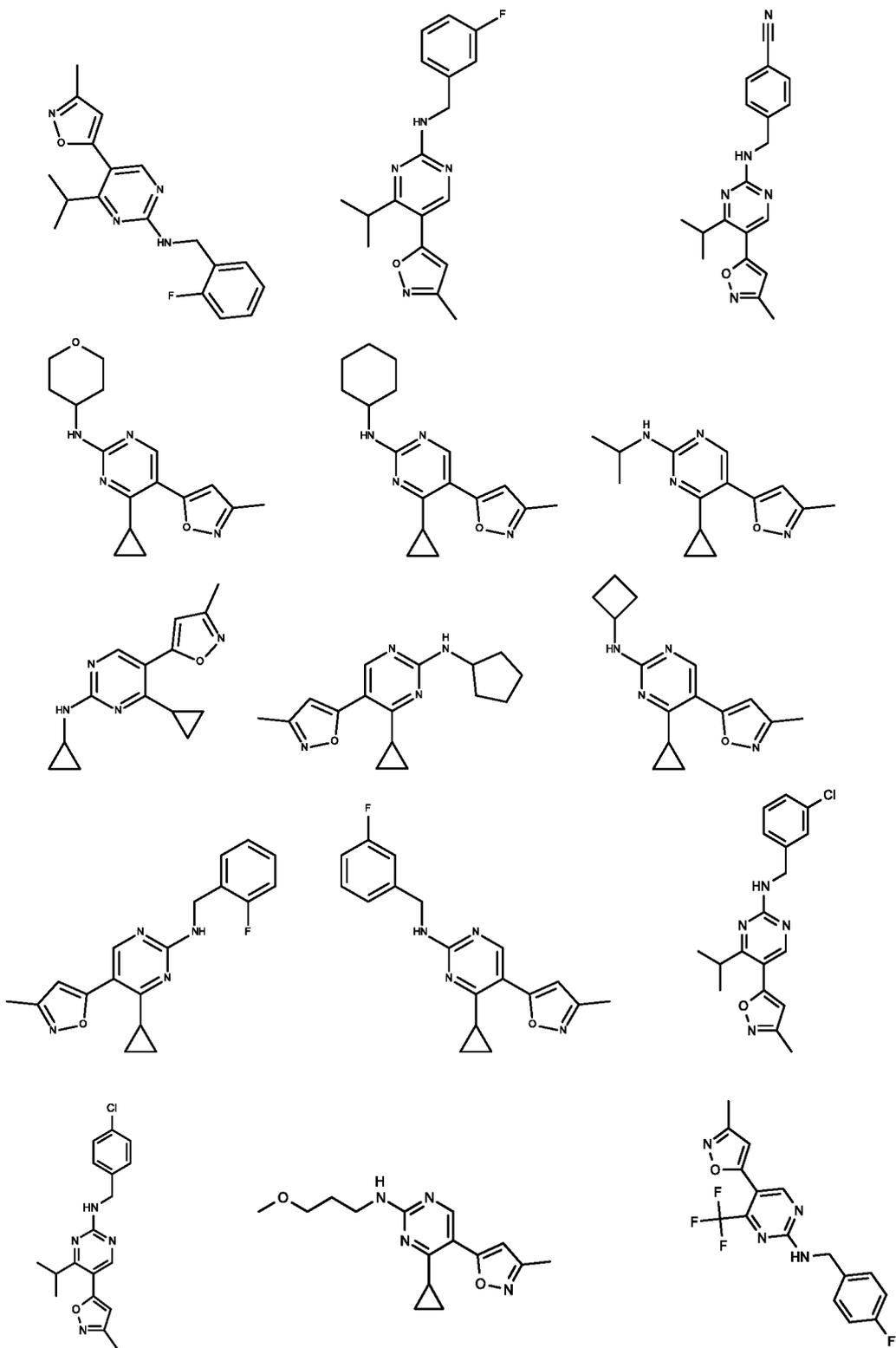
14. Применение по п. 12, в котором  $R_4$  имеет формулу  $-(CH_2)_n-Y$ , где  $n$  — целое число в диапазоне 0–4, и  $Y$  выбран из  $C_{6-20}$  арила или  $C_{5-20}$  гетероарила, которые обязательно замещены, причем предпочтительно  $Y$  представляет собой фенил, пиридин или пиримидин.

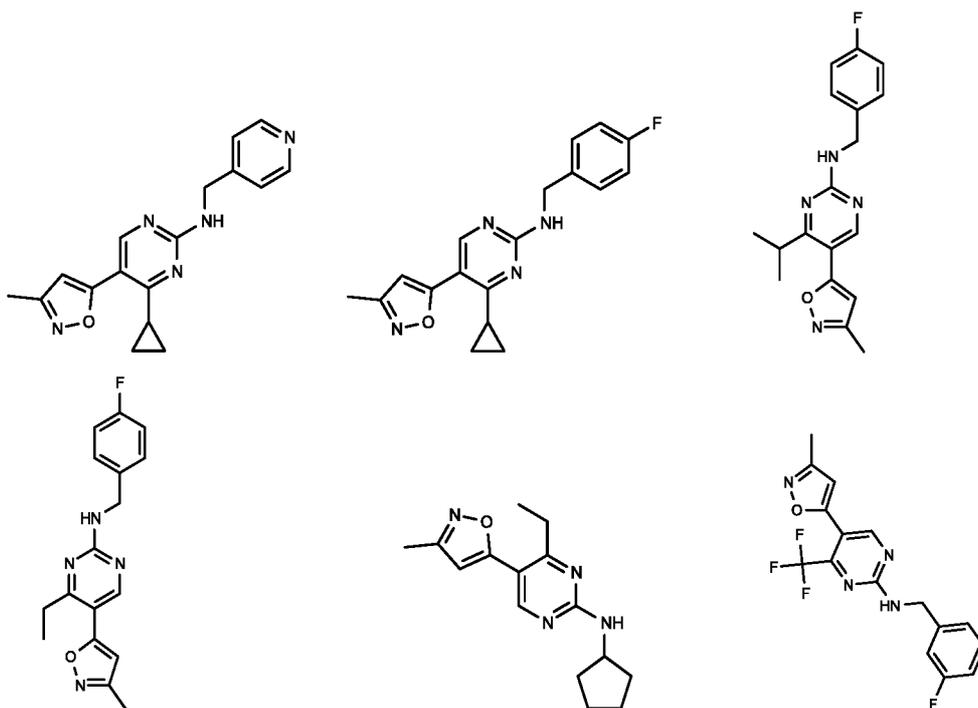
15. Применение по п. 14, в котором арил или гетероарил замещен, предпочтительно галидом.

16. Применение по любому из пп. 12–15, в котором  $n = 0$  или 1.

17. Применение по п. 1, в котором соединение выбрано из следующих формул:







18. Применение по любому предыдущему пункту в качестве гербицида.

19. Агрехимическая композиция, содержащая соединение, которое определено в любом предыдущем пункте, и приемлемый для сельского хозяйства адъювант для приготовления состава.

20. Композиция по п. 19, дополнительно содержащая по меньшей мере один дополнительный пестицид.

21. Композиция по п. 20, в которой по меньшей мере один дополнительный пестицид представляет собой гербицид или антидот гербицидов.

22. Композиция по любому из пп. 19–21, которая представляет собой гербицидную композицию.

23. Способ борьбы с сорняками в месте произрастания, включающий применение в месте произрастания подавляющего сорняки количества композиции по любому из пп. 19–22.

24. Соединение, выбранное из следующих формул:

