

(19)



Евразийское
патентное
ведомство

(21) 202391532 (13) A1

(12) ОПИСАНИЕ ИЗОБРЕТЕНИЯ К ЕВРАЗИЙСКОЙ ЗАЯВКЕ

(43) Дата публикации заявки
2023.07.17

(51) Int. Cl. *A01N 43/80* (2006.01)
C07D 261/04 (2006.01)
C07D 413/10 (2006.01)

(22) Дата подачи заявки
2021.11.17

(54) ГЕРБИЦИДНЫЕ СОЕДИНЕНИЯ

(31) 20209638.4

(32) 2020.11.24

(33) EP

(86) PCT/EP2021/082014

(87) WO 2022/112072 2022.06.02

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

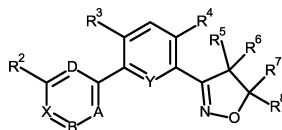
(72) Изобретатель:

Уиттингем Уильям Гай, Уильямс
Джон (GB)

(74) Представитель:

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

(57) Соединения формулы (I)



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

A1

202391532

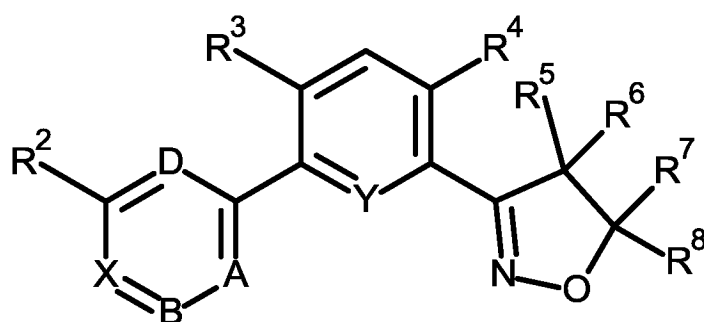
202391532

A1

ГЕРБИЦИДНЫЕ СОЕДИНЕНИЯ

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

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



(I),

где

A выбран из группы, состоящей из C-R¹⁷ и азота;

20 B выбран из группы, состоящей из C-R¹⁸ и азота;

D выбран из группы, состоящей из C-R¹, азота и N⁺-O⁻;

X выбран из группы, состоящей из C-R¹⁹ и азота;

при условии, что не более чем два из A, B, D и X представляют собой азот, а B и X одновременно не представляют собой азот;

25 Y выбран из группы, состоящей из C-H и азота;

R¹ выбран из группы, состоящей из водорода, галогена, циано, нитро, C₁-C₄алкила, C₁-C₄галогеналкила, C₃-C₆циклоалкила, C₁-C₄алкокси-C₁-C₆алкила, C₁-C₄галогеналкокси-C₁-C₆алкила, C₁-C₄алкокси, C₁-C₄галогеналкокси, C₁-C₄алкокси-C₁-

С₄алкокси, С₁-С₄алкилсульфонилокси, С₁-С₄галогеналкилсульфонилокси, С₁-С₄алкилтио, С₁-С₄алкилсульфинила, С₁-С₄алкилсульфонила, С₁-С₄галогеналкилтио, С₁-С₄галогеналкилсульфинила, С₁-С₄галогеналкилсульфонила, amino, С₁-С₄алкиламино, ди(С₁-С₄алкил)амино, С₁-С₄алкилкарбониламино, С₁-С₄алкилкарбонил(С₁-С₄алкил)амино, С₁-С₄алкилоксикарбониламино, аминокарбониламино, С₁-С₄алкиламинокарбониламино, С₁-С₄алкилсульфониламино, С₁-С₄галогеналкилсульфониламино, CO₂R⁹, CONR¹⁰R¹¹, C(=Z)R¹⁵;

R² выбран из группы, состоящей из водорода, галогена, циано, нитро, С₁-С₄алкила, С₁-С₄галогеналкила, С₃-С₆циклоалкила, С₁-С₄алкокси-С₁-С₆алкила, С₁-С₄галогеналкокси-С₁-С₆алкила, С₁-С₄алкокси, С₁-С₄галогеналкокси, С₁-С₄алкокси-С₁-С₄алкокси, С₁-С₄алкилсульфонилокси, С₁-С₄галогеналкилсульфонилокси, С₁-С₄алкилтио, С₁-С₄алкилсульфинила, С₁-С₄алкилсульфонила, С₁-С₄галогеналкилтио, С₁-С₄галогеналкилсульфинила, С₁-С₄галогеналкилсульфонила, amino, С₁-С₄алкиламино, ди(С₁-С₄алкил)амино, С₁-С₄алкилкарбониламино, С₁-С₄алкилкарбонил(С₁-С₄алкил)амино, С₁-С₄алкилоксикарбониламино, аминокарбониламино, С₁-С₄алкиламинокарбониламино, С₁-С₄алкилсульфониламино, С₁-С₄галогеналкилсульфониламино, CO₂R⁹, CONR¹⁰R¹¹, C(=Z)R¹⁵; или

R¹ и R² вместе с атомами углерода, к которым они присоединены, образуют 5- или 6-членное кольцо, которое может быть насыщенным или частично или полностью ненасыщенным, и которое может необязательно содержать один или два гетероатома, выбранные из группы азота, кислорода и серы, и которое может быть замещено 1-4 группами R²⁰; или

R² и R¹⁹ вместе с атомами углерода, к которым они прикреплены, образуют 5- или 6-членное кольцо, которое может быть насыщенным или частично или полностью ненасыщенным, и которое может необязательно содержать один или два гетероатома, выбранные из группы азота, кислорода и серы, и которое может быть замещено 1-4 группами R²⁰;

R³ выбран из группы, состоящей из водорода, галогена, С₁-С₄алкила, С₁-С₄галогеналкила, С₁-С₄алкокси, С₁-С₄галогеналкокси и С₁-С₄алкилсульфонила;

R⁴ выбран из группы, состоящей из водорода, галогена, циано, аминокарбонила, аминотиокарбонила, С₁-С₄алкила, С₁-С₄галогеналкила, С₁-С₄алкокси, С₁-С₄галогеналкокси и С₁-С₄алкилсульфонила;

каждый из R^5 и R^6 независимо выбран из группы, состоящей из водорода, циано, C_1 - C_6 алкила, C_1 - C_6 галогеналкила, C_1 - C_4 алкилсульфонила, CO_2R^9 , $CONR^{10}R^{11}$ и CH_2OR^{12} ;

5 каждый из R^7 и R^8 независимо выбран из группы, состоящей из водорода, циано, C_1 - C_6 алкила, C_1 - C_6 галогеналкила, C_1 - C_4 алкокси, C_1 - C_4 алкилсульфонила, $C(=Z)R^{15}$, CO_2R^9 , $CONR^{10}R^{11}$ и CH_2OR^{12} ;

Z выбран из группы, состоящей из кислорода, NOR^{16} и $NN(R^{16})_2$;

10 R^9 выбран из группы, состоящей из водорода, C_1 - C_{10} алкила, C_1 - C_{10} галогеналкила, C_3 - C_6 алкенила, C_3 - C_6 галогеналкенила, C_3 - C_6 алкинила, C_1 - C_4 алкокси- C_1 - C_6 алкила, C_1 - C_4 галогеналкокси- C_1 - C_6 алкила, C_6 - C_{10} арил- C_1 - C_3 алкила, C_6 - C_{10} арил- C_1 - C_3 алкила, замещенного 1-4 группами R^{13} , гетероарил- C_1 - C_3 алкила и гетероарил- C_1 - C_3 алкила, замещенного 1-3 группами R^{13} ;

R^{10} выбран из группы, состоящей из водорода, C_1 - C_6 алкила и SO_2R^{14} ;

R^{11} выбран из группы, состоящей из водорода и C_1 - C_6 алкила; или

15 R^{10} и R^{11} вместе с атомом азота, к которому они присоединены, образуют 3-6-членное гетероциклическое кольцо, которое необязательно содержит атом кислорода;

20 R^{12} выбран из группы, состоящей из водорода, C_1 - C_4 алкила, C_1 - C_4 галогеналкила, C_1 - C_4 алкилсульфонила, C_1 - C_4 галогеналкилсульфонила, фенилсульфонила, фенилсульфонила, замещенного 1-2 группами R^{13} ; C_1 - C_4 алкилкарбонила, C_1 - C_4 галогеналкилкарбонила, C_6 - C_{10} арилкарбонила, C_6 - C_{10} арилкарбонила, замещенного 1-4 группами R^{13} , гетероарилкарбонила, гетероарилкарбонила, замещенного 1-3 группами R^{13} , C_6 - C_{10} арил- C_1 - C_3 алкилкарбонила, C_6 - C_{10} арил- C_1 - C_3 алкилкарбонила, замещенного 1-4 группами R^{13} , гетероарил- C_1 - C_3 алкилкарбонила и гетероарил- C_1 - C_3 алкилкарбонила, замещенного 1-3 группами R^{13} ;

25 каждая R^{13} независимо выбрана из группы, состоящей из галогена, C_1 - C_4 алкила, C_1 - C_4 галогеналкила, C_1 - C_4 алкокси, C_1 - C_4 галогеналкокси, циано и C_1 - C_4 алкилсульфонила;

R^{14} выбран из группы, состоящей из C_1 - C_4 алкила, C_1 - C_4 галогеналкила и C_1 - C_4 алкил(C_1 - C_4 алкил)амино;

30 R^{15} выбран из группы, состоящей из водорода, C_1 - C_4 алкила и C_1 - C_4 галогеналкила;

каждый R^{16} независимо выбран из группы, состоящей из водорода, C_1 - C_4 алкила, C_1 - C_4 галогеналкила и C_1 - C_4 алкоксикарбонил- C_1 - C_4 алкила;

R^{17} выбран из группы, состоящей из водорода, галогена, циано, нитро, C_1 - C_4 алкила, C_1 - C_4 галогеналкила, C_3 - C_6 циклоалкила, C_1 - C_4 алкокси- C_1 - C_6 алкила, C_1 -

С₄галогеналкокси-С₁-С₆алкила, С₁-С₄алкокси, С₁-С₄галогеналкокси, С₁-С₄алкокси-С₁-С₄алкокси, С₁-С₄алкилсульфонилокси, С₁-С₄галогеналкилсульфонилокси, С₁-С₄алкилтио, С₁-С₄алкилсульфинила, С₁-С₄алкилсульфонила, С₁-С₄галогеналкилтио, С₁-С₄галогеналкилсульфинила, С₁-С₄галогеналкилсульфонила, amino, С₁-С₄алкиламино, ди(С₁-С₄алкил)амино, С₁-С₄алкилкарбониламино, С₁-С₄алкилкарбонил(С₁-С₄алкил)амино, С₁-С₄алкилоксикарбониламино, аминокарбониламино, С₁-С₄алкиламинокарбониламино, С₁-С₄алкилсульфониламино, С₁-С₄галогеналкилсульфониламино, CO₂R⁹, CONR¹⁰R¹¹, C(=Z)R¹⁵;

10 R¹⁸ выбран из группы, состоящей из водорода, галогена, циано, нитро, С₁-С₄алкила, С₁-С₄галогеналкила, С₃-С₆циклоалкила, С₁-С₄алкокси-С₁-С₆алкила, С₁-С₄галогеналкокси-С₁-С₆алкила, С₁-С₄алкокси, С₁-С₄галогеналкокси, С₁-С₄алкокси-С₁-С₄алкокси, С₁-С₄алкилсульфонилокси, С₁-С₄галогеналкилсульфонилокси, С₁-С₄алкилтио, С₁-С₄алкилсульфинила, С₁-С₄алкилсульфонила, С₁-С₄галогеналкилтио, С₁-С₄галогеналкилсульфинила, С₁-С₄галогеналкилсульфонила, amino, С₁-С₄алкиламино, 15 ди(С₁-С₄алкил)амино, С₁-С₄алкилкарбониламино, С₁-С₄алкилкарбонил(С₁-С₄алкил)амино, С₁-С₄алкилоксикарбониламино, аминокарбониламино, С₁-С₄алкиламинокарбониламино, С₁-С₄алкилсульфониламино, С₁-С₄галогеналкилсульфониламино, CO₂R⁹, CONR¹⁰R¹¹, C(=Z)R¹⁵;

20 R¹⁹ выбран из группы, состоящей из водорода, галогена, циано, нитро, С₁-С₄алкила, С₁-С₄галогеналкила, С₃-С₆циклоалкила, С₁-С₄алкокси-С₁-С₆алкила, С₁-С₄галогеналкокси-С₁-С₆алкила, С₁-С₄алкокси, С₁-С₄галогеналкокси, С₁-С₄алкокси-С₁-С₄алкокси, С₁-С₄алкилсульфонилокси, С₁-С₄галогеналкилсульфонилокси, С₁-С₄алкилтио, С₁-С₄алкилсульфинила, С₁-С₄алкилсульфонила, С₁-С₄галогеналкилтио, С₁-С₄галогеналкилсульфинила, С₁-С₄галогеналкилсульфонила, amino, С₁-С₄алкиламино, 25 ди(С₁-С₄алкил)амино, С₁-С₄алкилкарбониламино, С₁-С₄алкилкарбонил(С₁-С₄алкил)амино, С₁-С₄алкилоксикарбониламино, аминокарбониламино, С₁-С₄алкиламинокарбониламино, С₁-С₄алкилсульфониламино, С₁-С₄галогеналкилсульфониламино, CO₂R⁹, CONR¹⁰R¹¹, C(=Z)R¹⁵; R²⁰ выбран из группы, состоящей из галогена, С₁-С₄алкила, С₁-С₄галогеналкила, С₁-С₄алкокси, С₁-С₄галогеналкокси, циано и С₁-С₄алкилсульфонила; и

при условии, что все из R1, R2, R17, R18 и R19 одновременно не представляют собой водород.

В соответствии со вторым аспектом настоящего изобретения представлена агрохимическая композиция, содержащая гербицидно эффективное количество

соединения формулы (I) и агрохимически приемлемый разбавитель или носитель. Такая композиция, предназначенная для применения в сельском хозяйстве, может дополнительно содержать по меньшей мере один дополнительный активный ингредиент.

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

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

В соответствии с пятым аспектом настоящего изобретения представлен способ получения соединений формулы (I).

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

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

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

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

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

Применяемый в данном документе термин "C₁-C₆алкокси" относится к радикалу формулы -OR_a, где R_a представляет собой C₁-C₆алкильный радикал, который в целом
30 определен выше. C₁-C₄алкокси следует истолковывать соответствующим образом. Примеры C₁-C₄алкокси включают без ограничения метокси, этокси, пропокси, изопропокси и *трет*-бутокси.

Применяемый в данном документе термин "C₁-C₆галогеналкил" относится к C₁-C₆алкильному радикалу, который в целом определен выше, замещенному одним или

несколькими одинаковыми или различными атомами галогена. C₁-C₄галогеналкил следует истолковывать соответствующим образом. Примеры C₁-C₆галогеналкила включают без ограничения хлорметил, фторметил, фторэтил, дифторметил, трифторметил и 2,2,2-трифторэтил.

5 Применяемый в данном документе термин "C₂-C₆алкенил" относится к группе, представляющей собой углеводородный радикал с прямой или разветвленной цепью, состоящей исключительно из атомов углерода и водорода, содержащей по меньшей мере одну двойную связь, которая может находиться либо в (*E*)-, либо в (*Z*)-конфигурации, содержащей от двух до шести атомов углерода, которая присоединена к
10 остальной части молекулы одинарной связью. C₂-C₄алкенил следует истолковывать соответствующим образом. Примеры C₂-C₆алкенила включают без ограничения проп-1-енил, аллил(проп-2-енил) и бут-1-енил.

 Применяемый в данном документе термин "C₂-C₆галогеналкенил" относится к C₂-C₆алкенильному радикалу, который в целом определен выше, замещенному одним или
15 несколькими одинаковыми или различными атомами галогена. Примеры C₂-C₆галогеналкенила включают без ограничения хлорэтилен, фторэтилен, 1,1-дифторэтилен, 1,1-дихлорэтилен и 1,1,2-трихлорэтилен.

 Применяемый в данном документе термин "C₂-C₆алкинил" относится к группе, представляющей собой углеводородный радикал с прямой или разветвленной цепью, состоящей исключительно из атомов углерода и водорода, содержащей по меньшей мере одну тройную связь, содержащей от двух до шести атомов углерода, и которая присоединена к
20 остальной части молекулы посредством одинарной связи. C₂-C₄алкинил следует истолковывать соответствующим образом. Примеры C₂-C₆алкинила включают без ограничения, проп-1-инил, пропаргил (проп-2-инил) и бут-1-инил.

25 Применяемый в данном документе термин "C₁-C₆галогеналкокси" относится к C₁-C₆алкоксигруппе, определенной выше, замещенной одним или несколькими одинаковыми или различными атомами галогена. C₁-C₄галогеналкокси следует истолковывать соответствующим образом. Примеры C₁-C₆галогеналкокси включают без ограничения фторметокси, дифторметокси, фторэтокси, трифторметокси и
30 трифторэтокси.

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

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

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

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

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

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

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

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

25 Применяемый в данном документе термин "аминокарбонил" относится к радикалу формулы -C(O)NH₂.

Применяемый в данном документе термин "аминотиокарбонил" относится к радикалу формулы -C(S)NH₂.

30 Применяемый в данном документе термин "C₃-C₆циклоалкил" относится к стабильному моноциклическому кольцевому радикалу, который является насыщенным или частично ненасыщенным и содержит от 3 до 6 атомов углерода. C₃-C₄циклоалкил следует истолковывать соответствующим образом. Примеры C₃-C₆циклоалкила включают без ограничения циклопропил, циклобутил, циклопентил и циклогексил.

Применяемый в данном документе термин "C₃-C₆галогенциклоалкил" относится к C₃-C₆циклоалкильному радикалу, который в целом определен выше, замещенному

одним или несколькими одинаковыми или различными атомами галогена. C₃-C₄галогенциклоалкил следует истолковывать соответствующим образом.

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

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

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

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

Наличие одного или нескольких возможных асимметричных атомов углерода в соединении формулы (I) означает, что соединения могут встречаться в хиральных изомерных формах, т.е. энантиомерных или диастереомерных формах. Также атропоизомеры могут возникать в результате ограниченного вращения вокруг одинарной связи. Предполагается, что формула (I) включает все такие возможные изомерные формы и их смеси. Настоящее изобретение включает все такие возможные изомерные формы соединения формулы (I) и их смеси. Аналогичным образом предполагается, что формула (I) включает все возможные таутомеры (включая лактам-лактимную таутомерию и кето-енольную таутомерию), если они присутствуют.

Настоящее изобретение включает все возможные таутомерные формы соединения формулы (I). Аналогично, в случае дизамещенных алкенов, они могут быть представлены в *E*- или *Z*-форме или в виде смесей обоих в любой пропорции. Настоящее изобретение включает все такие возможные изомерные формы соединения формулы (I) и их смеси.

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

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

тетраметиламмоний, тетраметилфосфоний, тетрапропиламмоний,
 тетрапропилфосфоний, трибутилсульфоний, трибутилсульфоксоний,
 триэтилсульфоний, триэтилсульфоксоний, триметилсульфоний,
 триметилсульфоксоний, трипропилсульфоний и трипропилсульфоксоний.

5 В следующем перечне представлены определения, включающие
 предпочтительные определения для заместителей А, В, D, X, Y, Z, R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶,
 R⁷, R⁸, R⁹, R¹⁰, R¹¹, R¹², R¹³, R¹⁴, R¹⁵, R¹⁶, R¹⁷, R¹⁸, R¹⁹ и R²⁰ со ссылкой на соединения
 формулы (I) в соответствии с настоящим изобретением. Применительно к любому из
 10 этих заместителей любое из определений, приведенных ниже, может комбинироваться
 с любым определением любого другого заместителя, приведенным ниже или в других
 частях данного документа.

Предпочтительно А выбран из группы, состоящей из C-R¹⁷ и азота, более
 предпочтительно азота;

15 предпочтительно В выбран из группы, состоящей из C-R¹⁸ и азота, более
 предпочтительно C-R¹⁸;

предпочтительно D выбран из группы, состоящей из C-R¹ и N⁺-O⁻, более
 предпочтительно C-R¹;

предпочтительно X выбран из группы, состоящей из C-R¹⁹ и азота, более
 предпочтительно C-R¹⁹;

20 предпочтительно при условии, что не более чем один из А, В и X представляет
 собой азот, более предпочтительно при условии, что один из А, В и X представляет
 собой азот, еще более предпочтительно при условии, что один из А, В, D и X
 представляет собой азот;

Предпочтительно Y представляет собой C-H.

25 Предпочтительно R¹ выбран из группы, состоящей из водорода, галогена, C₁-
 C₄алкила, C₁-C₄галогеналкила, C₁-C₄алкокси, C₁-C₄галогеналкокси, более
 предпочтительно водорода, фтора, хлора, C₁-C₂алкила, C₁-C₂галогеналкила, наиболее
 предпочтительно водорода, фтора, хлора, метила и трифторметила.

30 Предпочтительно R² выбран из группы, состоящей из водорода, галогена, C₁-
 C₄алкила, C₁-C₄галогеналкила, C₁-C₄алкокси, C₁-C₄галогеналкокси, более
 предпочтительно водорода, фтора, хлора, C₁-C₂алкила, C₁-C₂галогеналкила, наиболее
 предпочтительно водорода, фтора, хлора, метила и трифторметила; или

предпочтительно R^2 и R^{19} вместе с атомами углерода, к которым они присоединены, образуют 5-членное насыщенное кольцо, необязательно содержащее один или два атома кислорода и которое может быть замещено 1-2 группами R^{20} .

5 Предпочтительно R^3 выбран из группы, состоящей из водорода, хлора и фтора, более предпочтительно хлора и фтора.

Предпочтительно R^4 выбран из группы, состоящей из водорода, хлора, циано и аминотиокарбонила, более предпочтительно хлора, циано и аминотиокарбонила, наиболее предпочтительно хлора.

10 Предпочтительно каждый из R^5 и R^6 независимо выбран из группы, состоящей из водорода, C_1 - C_4 алкила, CO_2R^9 и CH_2OR^{12} , более предпочтительно водорода и C_1 - C_2 алкила, наиболее предпочтительно водорода.

15 Предпочтительно каждый из R^7 и R^8 независимо выбран из группы, состоящей из водорода, C_1 - C_4 алкила, C_1 - C_6 галогеналкила, CO_2R^9 , $CONR^{10}R^{11}$ и CH_2OR^{12} . Более предпочтительно R^7 выбран из группы, состоящей из CO_2R^9 , $CONR^{10}R^{11}$ и CH_2OR^{12} , наиболее предпочтительно CO_2R^9 . Более предпочтительно R^8 выбран из группы, состоящей из водорода и C_1 - C_4 алкила, наиболее предпочтительно метила.

20 Предпочтительно R^9 выбран из группы, состоящей из водорода, C_1 - C_4 алкила, C_1 - C_4 галогеналкила, C_1 - C_2 алкокси- C_1 - C_2 алкила, фенил C_1 - C_2 алкила и фенил C_1 - C_2 алкила, замещенного 1-2 группами R^{13} , более предпочтительно водорода, C_1 - C_4 алкила, C_1 - C_2 алкокси- C_1 - C_2 алкила и фенил C_1 - C_2 алкила, наиболее предпочтительно водорода, C_1 - C_4 алкила и фенил C_1 - C_2 алкила.

Предпочтительно R^{10} выбран из группы, состоящей из водорода и SO_2R^{14} , более предпочтительно SO_2R^{14} .

Предпочтительно R^{11} представляет собой водород.

25 Предпочтительно R^{12} выбран из группы, состоящей из водорода, C_1 - C_2 алкила, C_1 - C_2 алкилсульфонила, C_1 - C_2 галогеналкилсульфонила, C_1 - C_4 алкилкарбонила, фенилкарбонила, фенилкарбонила, замещенного 1-2 группами R^{13} , фенил C_1 - C_2 алкилкарбонила и фенил C_1 - C_2 алкилкарбонила, замещенного 1-2 группами R^{13} более предпочтительно C_1 - C_2 алкилсульфонила, C_1 - C_2 галогеналкилсульфонила и C_1 - C_4 алкилкарбонила.

Предпочтительно R^{13} выбран из группы, состоящей из галогена, C_1 - C_4 алкила, C_1 - C_4 галогеналкила, C_1 - C_4 алкокси, C_1 - C_4 галогеналкокси, циано и C_1 - C_4 алкилсульфонила.

Предпочтительно R^{14} выбран из группы, состоящей из C_1 - C_4 алкила и C_1 - C_4 алкил(C_1 - C_4 алкил)амино, более предпочтительно метила и изопропил(метил)амино.

Предпочтительно R^{17} выбран из группы, состоящей из водорода, галогена, C_1 - C_4 алкила, C_1 - C_4 галогеналкила, C_1 - C_4 алкокси, C_1 - C_4 галогеналкокси, более предпочтительно водорода, фтора, хлора, C_1 - C_2 алкила, C_1 - C_2 галогеналкила, наиболее предпочтительно водорода, фтора, хлора, метила и трифторметила.

5 Предпочтительно R^{18} выбран из группы, состоящей из водорода, галогена, C_1 - C_4 алкила, C_1 - C_4 галогеналкила, C_1 - C_4 алкокси, C_1 - C_4 галогеналкокси, более предпочтительно водорода, фтора, хлора, C_1 - C_2 алкила, C_1 - C_2 галогеналкила, наиболее предпочтительно водорода, фтора, хлора, метила и трифторметила.

10 Предпочтительно R^{19} выбран из группы, состоящей из водорода, галогена, C_1 - C_4 алкила, C_1 - C_4 галогеналкила, C_1 - C_4 алкокси, C_1 - C_4 галогеналкокси, более предпочтительно водорода, фтора, хлора, C_1 - C_2 алкила, C_1 - C_2 галогеналкила, наиболее предпочтительно водорода, фтора, хлора, метила и трифторметила.

Предпочтительно R^{20} представляет собой галоген, более предпочтительно фтор.

15 В вариантах осуществления, где два из А, В, D и X представляют собой азот, предпочтительно В представляет собой азот. В вариантах осуществления, где один из А, В, D и X представляет собой азот, предпочтительно А представляет собой азот. Первой предпочтительной подгруппой соединений является подгруппа, в которой:

А представляет собой азот;

В представляет собой $C-R^{18}$;

20 D представляет собой $C-R^1$;

Х представляет собой $C-R^{19}$;

У представляет собой $C-H$;

R^1 выбран из группы, состоящей из водорода, фтора, хлора, C_1 - C_2 алкила и C_1 - C_2 галогеналкила;

25 R^2 выбран из группы, состоящей из водорода, фтора, хлора, C_1 - C_2 алкила и C_1 - C_2 галогеналкила;

R^3 выбран из группы, состоящей из водорода, хлора и фтора;

R^4 выбран из группы, состоящей из хлора, циано и аминотиокарбонила;

30 каждый из R^5 и R^6 независимо выбран из группы, состоящей из водорода и C_1 - C_2 алкила;

R^7 выбран из группы, состоящей из CO_2R^9 , $CONR^{10}R^{11}$ и CH_2OR^{12} ;

R^8 выбран из группы, состоящей из водорода и C_1 - C_4 алкила;

R^9 выбран из группы, состоящей из водорода, C_1 - C_4 алкила, C_1 - C_2 алкокси- C_1 - C_2 алкила и фенил- C_1 - C_2 алкила;

R^{10} представляет собой SO_2R^{14} ;

R^{11} представляет собой водород.

R^{12} выбран из группы, состоящей из C_1 - C_2 алкилсульфонила, C_1 - C_2 галогеналкилсульфонила и C_1 - C_4 алкилкарбонила;

5 R^{14} выбран из группы, состоящей из метила и изопропил(метил)амино;

R^{18} выбран из группы, состоящей из водорода, фтора, хлора, C_1 - C_2 алкила и C_1 - C_2 галогеналкила;

R^{19} выбран из группы, состоящей из водорода, фтора, хлора, C_1 - C_2 алкила и C_1 - C_2 галогеналкила.

10 Первой более предпочтительной подгруппой соединений является подгруппа, в которой:

A представляет собой азот;

B представляет собой $C-R^{18}$;

D представляет собой $C-R^1$;

15 X представляет собой $C-R^{19}$;

Y представляет собой C-H;

R^1 выбран из группы, состоящей из водорода, фтора, хлора, метила и трифторметила;

R^2 выбран из группы, состоящей из водорода, фтора, хлора, метила и трифторметила;

R^3 выбран из группы, состоящей из хлора и фтора;

20 R^4 представляет собой хлор;

каждый из R^5 и R^6 представляет собой водород;

R^7 представляет собой CO_2R^9 ;

R^8 представляет собой метил;

R^9 выбран из группы, состоящей из водорода, C_1 - C_4 алкила и фенил C_1 - C_2 алкила;

25 R^{18} выбран из группы, состоящей из водорода, фтора, хлора, метила и трифторметила;

R^{19} выбран из группы, состоящей из водорода, фтора, хлора, метила и трифторметила.

Второй предпочтительной подгруппой соединений является подгруппа, в которой:

A представляет собой $C-R^{17}$;

30 B представляет собой азот;

D представляет собой $C-R^1$;

X представляет собой $C-R^{19}$;

Y представляет собой C-H;

- R^1 выбран из группы, состоящей из водорода, фтора, хлора, C_1 - C_2 алкила и C_1 - C_2 галогеналкила;
- R^2 и R^{19} вместе с атомами углерода, к которым они присоединены, образуют 5- или 6-членное кольцо, которое содержит один или два гетероатома, выбранных из группы азота, кислорода и серы, и которое замещено 1-4 группами R^{20} ;
- 5 R^3 выбран из группы, состоящей из водорода, хлора и фтора;
- R^4 выбран из группы, состоящей из хлора, циано и аминотиокарбонила;
- каждый из R^5 и R^6 независимо выбран из группы, состоящей из водорода и C_1 - C_2 алкила;
- 10 R^7 выбран из группы, состоящей из CO_2R^9 , $CONR^{10}R^{11}$ и CH_2OR^{12} ;
- R^8 выбран из группы, состоящей из водорода и C_1 - C_4 алкила;
- R^9 выбран из группы, состоящей из водорода, C_1 - C_4 алкила, C_1 - C_2 алкокси- C_1 - C_2 алкила и фенил- C_1 - C_2 алкила;
- R^{10} представляет собой SO_2R^{14} ;
- 15 R^{11} представляет собой водород.
- R^{12} выбран из группы, состоящей из C_1 - C_2 алкилсульфонила, C_1 - C_2 галогеналкилсульфонила и C_1 - C_4 алкилкарбонила;
- R^{14} выбран из группы, состоящей из метила и изопропил(метил)амино;
- R^{18} выбран из группы, состоящей из водорода, фтора, хлора, C_1 - C_2 алкила и C_1 - C_2 галогеналкила;
- 20 R^{20} выбран из группы, состоящей из галогена, C_1 - C_4 алкила, C_1 - C_4 галогеналкила, C_1 - C_4 алкокси, C_1 - C_4 галогеналкокси, циано и C_1 - C_4 алкилсульфонила.
- Второй более предпочтительной подгруппой соединений является подгруппа, в которой:
- 25 А представляет собой $C-R^{17}$;
- В представляет собой азот;
- Д представляет собой $C-R^1$;
- Х представляет собой $C-R^{19}$;
- У представляет собой $C-H$;
- 30 R^1 выбран из группы, состоящей из водорода, фтора, хлора, метила и трифторметила;
- R^2 и R^{19} вместе с атомами углерода, к которым они присоединены, образуют насыщенное 5-членное кольцо, которое содержит один или два атома кислорода и которое замещено 1-3 группами R^{20} ;
- R^3 выбран из группы, состоящей из хлора и фтора;

R^4 представляет собой хлор;

каждый из R^5 и R^6 представляет собой водород;

R^7 представляет собой CO_2R^9 ;

R^8 представляет собой метил;

5 R^9 выбран из группы, состоящей из водорода, C_1 - C_4 алкила и фенил C_1 - C_2 алкила;

R^{18} выбран из группы, состоящей из водорода, фтора, хлора, метила и трифторметила;

R^{20} представляет собой галоген.

Третьей предпочтительной подгруппой соединений является подгруппа, в которой:

10 А представляет собой $C-R^{17}$;

В представляет собой азот;

Д представляет собой $C-R^1$;

Х представляет собой $C-R^{19}$;

У представляет собой $C-H$;

15 R^1 и R^2 вместе с атомами углерода, к которым они присоединены, образуют 5- или 6-членное кольцо, которое содержит один или два гетероатома, выбранных из группы азота, кислорода и серы, и которое замещено 1-4 группами R^{20} ;

R^3 выбран из группы, состоящей из водорода, хлора и фтора;

R^4 выбран из группы, состоящей из хлора, циано и аминотиокарбонила;

20 каждый из R^5 и R^6 независимо выбран из группы, состоящей из водорода и C_1 - C_2 алкила;

R^7 выбран из группы, состоящей из CO_2R^9 , $CONR^{10}R^{11}$ и CH_2OR^{12} ;

R^8 выбран из группы, состоящей из водорода и C_1 - C_4 алкила;

25 R^9 выбран из группы, состоящей из водорода, C_1 - C_4 алкила, C_1 - C_2 алкокси- C_1 - C_2 алкила и фенил C_1 - C_2 алкила;

R^{10} представляет собой SO_2R^{14} ;

R^{11} представляет собой водород.

R^{12} выбран из группы, состоящей из C_1 - C_2 алкилсульфонила, C_1 - C_2 галогеналкилсульфонила и C_1 - C_4 алкилкарбонила;

30 R^{14} выбран из группы, состоящей из метила и изопропил(метил)амино;

R^{18} выбран из группы, состоящей из водорода, фтора, хлора, C_1 - C_2 алкила и C_1 - C_2 галогеналкила;

R^{19} выбран из группы, состоящей из водорода, фтора, хлора, C_1 - C_2 алкила и C_1 - C_2 галогеналкила;

R^{20} выбран из группы, состоящей из галогена, C_1 - C_4 алкила, C_1 - C_4 галогеналкила, C_1 - C_4 алкокси, C_1 - C_4 галогеналкокси, циано и C_1 - C_4 алкилсульфонила.

Третьей более предпочтительной подгруппой соединений является подгруппа, в которой:

- 5 А представляет собой $C-R^{17}$;
 В представляет собой азот;
 D представляет собой $C-R^1$;
 X представляет собой $C-R^{19}$;
 Y представляет собой C-H;
- 10 R^1 и R^2 вместе с атомами углерода, к которым они присоединены, образуют насыщенное 5-членное кольцо, которое содержит один или два атома кислорода и которое замещено 1-3 группами R^{20} ;
 R^3 выбран из группы, состоящей из хлора и фтора;
 R^4 представляет собой хлор;
- 15 каждый из R^5 и R^6 представляет собой водород;
 R^7 представляет собой CO_2R^9 ;
 R^8 представляет собой метил;
 R^9 выбран из группы, состоящей из водорода, C_1 - C_4 алкила и фенил C_1 - C_2 алкила;
 R^{18} выбран из группы, состоящей из водорода, фтора, хлора, метила и трифторметила;
- 20 R^{19} выбран из группы, состоящей из водорода, фтора, хлора, метила и трифторметила;
 R^{20} представляет собой галоген.

Таблица примеров

В таблице 1 ниже раскрыты 840 конкретных соединений формулы (I), обозначенных как соединения под номерами от 1-1 до 1-840 соответственно, где Y представляет собой C-H, R^4 представляет собой хлор, R^5 и R^6 представляют собой водород, и R^8 представляет собой метил.

Таблица 1

Номер соединения	A	B	X	D	R^2	R^3	R^7
1-1	CCl	CH	CCF ₃	CH	H	H	CO ₂ H
1-2	CCl	CH	CCF ₃	CH	H	H	CO ₂ Me
1-3	CCl	CH	CCF ₃	CH	H	H	CO ₂ Et
1-4	CCl	CH	CCF ₃	CH	H	H	CO ₂ CH ₂ Ph
1-5	CCl	CH	CCF ₃	CH	H	F	CO ₂ H

Номер соединения	A	B	X	D	R ²	R ³	R ⁷
1-6	CCl	CH	CCF ₃	CH	H	F	CO ₂ Me
1-7	CCl	CH	CCF ₃	CH	H	F	CO ₂ Et
1-8	CCl	CH	CCF ₃	CH	H	F	CO ₂ CH ₂ Ph
1-9	CCl	CH	CCF ₃	CH	H	Cl	CO ₂ H
1-10	CCl	CH	CCF ₃	CH	H	Cl	CO ₂ Me
1-11	CCl	CH	CCF ₃	CH	H	Cl	CO ₂ Et
1-12	CCl	CH	CCF ₃	CH	H	Cl	CO ₂ CH ₂ Ph
1-13	CCl	CH	CH	CH	H	H	CO ₂ H
1-14	CCl	CH	CH	CH	H	H	CO ₂ Me
1-15	CCl	CH	CH	CH	H	H	CO ₂ Et
1-16	CCl	CH	CH	CH	H	H	CO ₂ CH ₂ Ph
1-17	CCl	CH	CH	CH	H	F	CO ₂ H
1-18	CCl	CH	CH	CH	H	F	CO ₂ Me
1-19	CCl	CH	CH	CH	H	F	CO ₂ Et
1-20	CCl	CH	CH	CH	H	F	CO ₂ CH ₂ Ph
1-21	CCl	CH	CH	CH	H	Cl	CO ₂ H
1-22	CCl	CH	CH	CH	H	Cl	CO ₂ Me
1-23	CCl	CH	CH	CH	H	Cl	CO ₂ Et
1-24	CCl	CH	CH	CH	H	Cl	CO ₂ CH ₂ Ph
1-25	CCl	CH	CMe	CH	H	H	CO ₂ H
1-26	CCl	CH	CMe	CH	H	H	CO ₂ Me
1-27	CCl	CH	CMe	CH	H	H	CO ₂ Et
1-28	CCl	CH	CMe	CH	H	H	CO ₂ CH ₂ Ph
1-29	CCl	CH	CMe	CH	H	F	CO ₂ H
1-30	CCl	CH	CMe	CH	H	F	CO ₂ Me
1-31	CCl	CH	CMe	CH	H	F	CO ₂ Et
1-32	CCl	CH	CMe	CH	H	F	CO ₂ CH ₂ Ph
1-33	CCl	CH	CMe	CH	H	Cl	CO ₂ H
1-34	CCl	CH	CMe	CH	H	Cl	CO ₂ Me

Номер соединения	A	B	X	D	R ²	R ³	R ⁷
1-35	CCl	CH	CMe	CH	H	Cl	CO ₂ Et
1-36	CCl	CH	CMe	CH	H	Cl	CO ₂ CH ₂ Ph
1-37	N	CCF ₃	CH	CH	H	H	CO ₂ H
1-38	N	CCF ₃	CH	CH	H	H	CO ₂ Me
1-39	N	CCF ₃	CH	CH	H	H	CO ₂ Et
1-40	N	CCF ₃	CH	CH	H	H	CO ₂ CH ₂ Ph
1-41	N	CCF ₃	CH	CH	H	F	CO ₂ H
1-42	N	CCF ₃	CH	CH	H	F	CO ₂ Me
1-43	N	CCF ₃	CH	CH	H	F	CO ₂ Et
1-44	N	CCF ₃	CH	CH	H	F	CO ₂ CH ₂ Ph
1-45	N	CCF ₃	CH	CH	H	Cl	CO ₂ H
1-46	N	CCF ₃	CH	CH	H	Cl	CO ₂ Me
1-47	N	CCF ₃	CH	CH	H	Cl	CO ₂ Et
1-48	N	CCF ₃	CH	CH	H	Cl	CO ₂ CH ₂ Ph
1-49	N	CCl	CH	CH	H	H	CO ₂ H
1-50	N	CCl	CH	CH	H	H	CO ₂ Me
1-51	N	CCl	CH	CH	H	H	CO ₂ Et
1-52	N	CCl	CH	CH	H	H	CO ₂ CH ₂ Ph
1-53	N	CCl	CH	CH	H	F	CO ₂ H
1-54	N	CCl	CH	CH	H	F	CO ₂ Me
1-55	N	CCl	CH	CH	H	F	CO ₂ Et
1-56	N	CCl	CH	CH	H	F	CO ₂ CH ₂ Ph
1-57	N	CCl	CH	CH	H	Cl	CO ₂ H
1-58	N	CCl	CH	CH	H	Cl	CO ₂ Me
1-59	N	CCl	CH	CH	H	Cl	CO ₂ Et
1-60	N	CCl	CH	CH	H	Cl	CO ₂ CH ₂ Ph
1-61	N	CCl	CH	CH	CF ₃	H	CO ₂ H
1-62	N	CCl	CH	CH	CF ₃	H	CO ₂ Me
1-63	N	CCl	CH	CH	CF ₃	H	CO ₂ Et

Номер соединения	A	B	X	D	R ²	R ³	R ⁷
1-64	N	CCl	CH	CH	CF ₃	H	CO ₂ CH ₂ Ph
1-65	N	CCl	CH	CH	CF ₃	F	CO ₂ H
1-66	N	CCl	CH	CH	CF ₃	F	CO ₂ Me
1-67	N	CCl	CH	CH	CF ₃	F	CO ₂ Et
1-68	N	CCl	CH	CH	CF ₃	F	CO ₂ CH ₂ Ph
1-69	N	CCl	CH	CH	CF ₃	Cl	CO ₂ H
1-70	N	CCl	CH	CH	CF ₃	Cl	CO ₂ Me
1-71	N	CCl	CH	CH	CF ₃	Cl	CO ₂ Et
1-72	N	CCl	CH	CH	CF ₃	Cl	CO ₂ CH ₂ Ph
1-73	N	CH	CCF ₃	CH	H	H	CO ₂ H
1-74	N	CH	CCF ₃	CH	H	H	CO ₂ Me
1-75	N	CH	CCF ₃	CH	H	H	CO ₂ Et
1-76	N	CH	CCF ₃	CH	H	H	CO ₂ CH ₂ Ph
1-77	N	CH	CCF ₃	CH	H	F	CO ₂ H
1-78	N	CH	CCF ₃	CH	H	F	CO ₂ Me
1-79	N	CH	CCF ₃	CH	H	F	CO ₂ Et
1-80	N	CH	CCF ₃	CH	H	F	CO ₂ CH ₂ Ph
1-81	N	CH	CCF ₃	CH	H	Cl	CO ₂ H
1-82	N	CH	CCF ₃	CH	H	Cl	CO ₂ Me
1-83	N	CH	CCF ₃	CH	H	Cl	CO ₂ Et
1-84	N	CH	CCF ₃	CH	H	Cl	CO ₂ CH ₂ Ph
1-85	N	CH	CCF ₃	CF	H	H	CO ₂ H
1-86	N	CH	CCF ₃	CF	H	H	CO ₂ Me
1-87	N	CH	CCF ₃	CF	H	H	CO ₂ Et
1-88	N	CH	CCF ₃	CF	H	H	CO ₂ CH ₂ Ph
1-89	N	CH	CCF ₃	CF	H	F	CO ₂ H
1-90	N	CH	CCF ₃	CF	H	F	CO ₂ Me
1-91	N	CH	CCF ₃	CF	H	F	CO ₂ Et
1-92	N	CH	CCF ₃	CF	H	F	CO ₂ CH ₂ Ph

Номер соединения	A	B	X	D	R ²	R ³	R ⁷
1-93	N	CH	CCF ₃	CF	H	Cl	CO ₂ H
1-94	N	CH	CCF ₃	CF	H	Cl	CO ₂ Me
1-95	N	CH	CCF ₃	CF	H	Cl	CO ₂ Et
1-96	N	CH	CCF ₃	CF	H	Cl	CO ₂ CH ₂ Ph
1-97	N	CH	CCF ₃	CCl	H	H	CO ₂ H
1-98	N	CH	CCF ₃	CCl	H	H	CO ₂ Me
1-99	N	CH	CCF ₃	CCl	H	H	CO ₂ Et
1-100	N	CH	CCF ₃	CCl	H	H	CO ₂ CH ₂ Ph
1-101	N	CH	CCF ₃	CCl	H	F	CO ₂ H
1-102	N	CH	CCF ₃	CCl	H	F	CO ₂ Me
1-103	N	CH	CCF ₃	CCl	H	F	CO ₂ Et
1-104	N	CH	CCF ₃	CCl	H	F	CO ₂ CH ₂ Ph
1-105	N	CH	CCF ₃	CCl	H	Cl	CO ₂ H
1-106	N	CH	CCF ₃	CCl	H	Cl	CO ₂ Me
1-107	N	CH	CCF ₃	CCl	H	Cl	CO ₂ Et
1-108	N	CH	CCF ₃	CCl	H	Cl	CO ₂ CH ₂ Ph
1-109	N	CH	CCl	CCl	H	H	CO ₂ H
1-110	N	CH	CCl	CCl	H	H	CO ₂ Me
1-111	N	CH	CCl	CCl	H	H	CO ₂ Et
1-112	N	CH	CCl	CCl	H	H	CO ₂ CH ₂ Ph
1-113	N	CH	CCl	CCl	H	F	CO ₂ H
1-114	N	CH	CCl	CCl	H	F	CO ₂ Me
1-115	N	CH	CCl	CCl	H	F	CO ₂ Et
1-116	N	CH	CCl	CCl	H	F	CO ₂ CH ₂ Ph
1-117	N	CH	CCl	CCl	H	Cl	CO ₂ H
1-118	N	CH	CCl	CCl	H	Cl	CO ₂ Me
1-119	N	CH	CCl	CCl	H	Cl	CO ₂ Et
1-120	N	CH	CCl	CCl	H	Cl	CO ₂ CH ₂ Ph
1-121	N	CH	CH	CCl	H	H	CO ₂ H

Номер соединения	A	B	X	D	R ²	R ³	R ⁷
1-122	N	CH	CH	CCl	H	H	CO ₂ Me
1-123	N	CH	CH	CCl	H	H	CO ₂ Et
1-124	N	CH	CH	CCl	H	H	CO ₂ CH ₂ Ph
1-125	N	CH	CH	CCl	H	F	CO ₂ H
1-126	N	CH	CH	CCl	H	F	CO ₂ Me
1-127	N	CH	CH	CCl	H	F	CO ₂ Et
1-128	N	CH	CH	CCl	H	F	CO ₂ CH ₂ Ph
1-129	N	CH	CH	CCl	H	Cl	CO ₂ H
1-130	N	CH	CH	CCl	H	Cl	CO ₂ Me
1-131	N	CH	CH	CCl	H	Cl	CO ₂ Et
1-132	N	CH	CH	CCl	H	Cl	CO ₂ CH ₂ Ph
1-133	N	CH	CH	CH	H	H	CO ₂ H
1-134	N	CH	CH	CH	H	H	CO ₂ Me
1-135	N	CH	CH	CH	H	H	CO ₂ Et
1-136	N	CH	CH	CH	H	H	CO ₂ CH ₂ Ph
1-137	N	CH	CH	CH	H	F	CO ₂ H
1-138	N	CH	CH	CH	H	F	CO ₂ Me
1-139	N	CH	CH	CH	H	F	CO ₂ Et
1-140	N	CH	CH	CH	H	F	CO ₂ CH ₂ Ph
1-141	N	CH	CH	CH	H	Cl	CO ₂ H
1-142	N	CH	CH	CH	H	Cl	CO ₂ Me
1-143	N	CH	CH	CH	H	Cl	CO ₂ Et
1-144	N	CH	CH	CH	H	Cl	CO ₂ CH ₂ Ph
1-145	N	CH	CMe	CMe	H	H	CO ₂ H
1-146	N	CH	CMe	CMe	H	H	CO ₂ Me
1-147	N	CH	CMe	CMe	H	H	CO ₂ Et
1-148	N	CH	CMe	CMe	H	H	CO ₂ CH ₂ Ph
1-149	N	CH	CMe	CMe	H	F	CO ₂ H
1-150	N	CH	CMe	CMe	H	F	CO ₂ Me

Номер соединения	A	B	X	D	R ²	R ³	R ⁷
1-151	N	CH	CMe	CMe	H	F	CO ₂ Et
1-152	N	CH	CMe	CMe	H	F	CO ₂ CH ₂ Ph
1-153	N	CH	CMe	CMe	H	Cl	CO ₂ H
1-154	N	CH	CMe	CMe	H	Cl	CO ₂ Me
1-155	N	CH	CMe	CMe	H	Cl	CO ₂ Et
1-156	N	CH	CMe	CMe	H	Cl	CO ₂ CH ₂ Ph
1-157	N	CH	CMe	CH	H	H	CO ₂ H
1-158	N	CH	CMe	CH	H	H	CO ₂ Me
1-159	N	CH	CMe	CH	H	H	CO ₂ Et
1-160	N	CH	CMe	CH	H	H	CO ₂ CH ₂ Ph
1-161	N	CH	CMe	CH	H	F	CO ₂ H
1-162	N	CH	CMe	CH	H	F	CO ₂ Me
1-163	N	CH	CMe	CH	H	F	CO ₂ Et
1-164	N	CH	CMe	CH	H	F	CO ₂ CH ₂ Ph
1-165	N	CH	CMe	CH	H	Cl	CO ₂ H
1-166	N	CH	CMe	CH	H	Cl	CO ₂ Me
1-167	N	CH	CMe	CH	H	Cl	CO ₂ Et
1-168	N	CH	CMe	CH	H	Cl	CO ₂ CH ₂ Ph
1-169	N	CH	CMe	CCl	H	H	CO ₂ H
1-170	N	CH	CMe	CCl	H	H	CO ₂ Me
1-171	N	CH	CMe	CCl	H	H	CO ₂ Et
1-172	N	CH	CMe	CCl	H	H	CO ₂ CH ₂ Ph
1-173	N	CH	CMe	CCl	H	F	CO ₂ H
1-174	N	CH	CMe	CCl	H	F	CO ₂ Me
1-175	N	CH	CMe	CCl	H	F	CO ₂ Et
1-176	N	CH	CMe	CCl	H	F	CO ₂ CH ₂ Ph
1-177	N	CH	CMe	CCl	H	Cl	CO ₂ H
1-178	N	CH	CMe	CCl	H	Cl	CO ₂ Me
1-179	N	CH	CMe	CCl	H	Cl	CO ₂ Et

Номер соединения	A	B	X	D	R ²	R ³	R ⁷
1-180	N	CH	CMe	CCl	H	Cl	CO ₂ CH ₂ Ph
1-181	N	CH	CMe	CF	H	H	CO ₂ H
1-182	N	CH	CMe	CF	H	H	CO ₂ Me
1-183	N	CH	CMe	CF	H	H	CO ₂ Et
1-184	N	CH	CMe	CF	H	H	CO ₂ CH ₂ Ph
1-185	N	CH	CMe	CF	H	F	CO ₂ H
1-186	N	CH	CMe	CF	H	F	CO ₂ Me
1-187	N	CH	CMe	CF	H	F	CO ₂ Et
1-188	N	CH	CMe	CF	H	F	CO ₂ CH ₂ Ph
1-189	N	CH	CMe	CF	H	Cl	CO ₂ H
1-190	N	CH	CMe	CF	H	Cl	CO ₂ Me
1-191	N	CH	CMe	CF	H	Cl	CO ₂ Et
1-192	N	CH	CMe	CF	H	Cl	CO ₂ CH ₂ Ph
1-193	CF	N	CH	CH	Cl	H	CO ₂ H
1-194	CF	N	CH	CH	Cl	H	CO ₂ Me
1-195	CF	N	CH	CH	Cl	H	CO ₂ Et
1-196	CF	N	CH	CH	Cl	H	CO ₂ CH ₂ Ph
1-197	CF	N	CH	CH	Cl	F	CO ₂ H
1-198	CF	N	CH	CH	Cl	F	CO ₂ Me
1-199	CF	N	CH	CH	Cl	F	CO ₂ Et
1-200	CF	N	CH	CH	Cl	F	CO ₂ CH ₂ Ph
1-201	CF	N	CH	CH	Cl	Cl	CO ₂ H
1-202	CF	N	CH	CH	Cl	Cl	CO ₂ Me
1-203	CF	N	CH	CH	Cl	Cl	CO ₂ Et
1-204	CF	N	CH	CH	Cl	Cl	CO ₂ CH ₂ Ph
1-205	CF	N	CH	CH	H	H	CO ₂ H
1-206	CF	N	CH	CH	H	H	CO ₂ Me
1-207	CF	N	CH	CH	H	H	CO ₂ Et
1-208	CF	N	CH	CH	H	H	CO ₂ CH ₂ Ph

Номер соединения	A	B	X	D	R ²	R ³	R ⁷
1-209	CF	N	CH	CH	H	F	CO ₂ H
1-210	CF	N	CH	CH	H	F	CO ₂ Me
1-211	CF	N	CH	CH	H	F	CO ₂ Et
1-212	CF	N	CH	CH	H	F	CO ₂ CH ₂ Ph
1-213	CF	N	CH	CH	H	Cl	CO ₂ H
1-214	CF	N	CH	CH	H	Cl	CO ₂ Me
1-215	CF	N	CH	CH	H	Cl	CO ₂ Et
1-216	CF	N	CH	CH	H	Cl	CO ₂ CH ₂ Ph
1-217	CF	N	CH	CH	Me	H	CO ₂ H
1-218	CF	N	CH	CH	Me	H	CO ₂ Me
1-219	CF	N	CH	CH	Me	H	CO ₂ Et
1-220	CF	N	CH	CH	Me	H	CO ₂ CH ₂ Ph
1-221	CF	N	CH	CH	Me	F	CO ₂ H
1-222	CF	N	CH	CH	Me	F	CO ₂ Me
1-223	CF	N	CH	CH	Me	F	CO ₂ Et
1-224	CF	N	CH	CH	Me	F	CO ₂ CH ₂ Ph
1-225	CF	N	CH	CH	Me	Cl	CO ₂ H
1-226	CF	N	CH	CH	Me	Cl	CO ₂ Me
1-227	CF	N	CH	CH	Me	Cl	CO ₂ Et
1-228	CF	N	CH	CH	Me	Cl	CO ₂ CH ₂ Ph
1-229	CF	N	CH	CH	CF ₃	H	CO ₂ H
1-230	CF	N	CH	CH	CF ₃	H	CO ₂ Me
1-231	CF	N	CH	CH	CF ₃	H	CO ₂ Et
1-232	CF	N	CH	CH	CF ₃	H	CO ₂ CH ₂ Ph
1-233	CF	N	CH	CH	CF ₃	F	CO ₂ H
1-234	CF	N	CH	CH	CF ₃	F	CO ₂ Me
1-235	CF	N	CH	CH	CF ₃	F	CO ₂ Et
1-236	CF	N	CH	CH	CF ₃	F	CO ₂ CH ₂ Ph
1-237	CF	N	CH	CH	CF ₃	Cl	CO ₂ H

Номер соединения	A	B	X	D	R ²	R ³	R ⁷
1-238	CF	N	CH	CH	CF ₃	Cl	CO ₂ Me
1-239	CF	N	CH	CH	CF ₃	Cl	CO ₂ Et
1-240	CF	N	CH	CH	CF ₃	Cl	CO ₂ CH ₂ Ph
1-241	CH	N	CH	CH	H	H	CO ₂ H
1-242	CH	N	CH	CH	H	H	CO ₂ Me
1-243	CH	N	CH	CH	H	H	CO ₂ Et
1-244	CH	N	CH	CH	H	H	CO ₂ CH ₂ Ph
1-245	CH	N	CH	CH	H	F	CO ₂ H
1-246	CH	N	CH	CH	H	F	CO ₂ Me
1-247	CH	N	CH	CH	H	F	CO ₂ Et
1-248	CH	N	CH	CH	H	F	CO ₂ CH ₂ Ph
1-249	CH	N	CH	CH	H	Cl	CO ₂ H
1-250	CH	N	CH	CH	H	Cl	CO ₂ Me
1-251	CH	N	CH	CH	H	Cl	CO ₂ Et
1-252	CH	N	CH	CH	H	Cl	CO ₂ CH ₂ Ph
1-253	CH	N	CH	COMe	H	H	CO ₂ H
1-254	CH	N	CH	COMe	H	H	CO ₂ Me
1-255	CH	N	CH	COMe	H	H	CO ₂ Et
1-256	CH	N	CH	COMe	H	H	CO ₂ CH ₂ Ph
1-257	CH	N	CH	COMe	H	F	CO ₂ H
1-258	CH	N	CH	COMe	H	F	CO ₂ Me
1-259	CH	N	CH	COMe	H	F	CO ₂ Et
1-260	CH	N	CH	COMe	H	F	CO ₂ CH ₂ Ph
1-261	CH	N	CH	COMe	H	Cl	CO ₂ H
1-262	CH	N	CH	COMe	H	Cl	CO ₂ Me
1-263	CH	N	CH	COMe	H	Cl	CO ₂ Et
1-264	CH	N	CH	COMe	H	Cl	CO ₂ CH ₂ Ph
1-265	CH	N	CH	CH	Cl	H	CO ₂ H
1-266	CH	N	CH	CH	Cl	H	CO ₂ Me

Номер соединения	A	B	X	D	R ²	R ³	R ⁷
1-267	CH	N	CH	CH	Cl	H	CO ₂ Et
1-268	CH	N	CH	CH	Cl	H	CO ₂ CH ₂ Ph
1-269	CH	N	CH	CH	Cl	F	CO ₂ H
1-270	CH	N	CH	CH	Cl	F	CO ₂ Me
1-271	CH	N	CH	CH	Cl	F	CO ₂ Et
1-272	CH	N	CH	CH	Cl	F	CO ₂ CH ₂ Ph
1-273	CH	N	CH	CH	Cl	Cl	CO ₂ H
1-274	CH	N	CH	CH	Cl	Cl	CO ₂ Me
1-275	CH	N	CH	CH	Cl	Cl	CO ₂ Et
1-276	CH	N	CH	CH	Cl	Cl	CO ₂ CH ₂ Ph
1-277	CH	N	CMe	CH	H	H	CO ₂ H
1-278	CH	N	CMe	CH	H	H	CO ₂ Me
1-279	CH	N	CMe	CH	H	H	CO ₂ Et
1-280	CH	N	CMe	CH	H	H	CO ₂ CH ₂ Ph
1-281	CH	N	CMe	CH	H	F	CO ₂ H
1-282	CH	N	CMe	CH	H	F	CO ₂ Me
1-283	CH	N	CMe	CH	H	F	CO ₂ Et
1-284	CH	N	CMe	CH	H	F	CO ₂ CH ₂ Ph
1-285	CH	N	CMe	CH	H	Cl	CO ₂ H
1-286	CH	N	CMe	CH	H	Cl	CO ₂ Me
1-287	CH	N	CMe	CH	H	Cl	CO ₂ Et
1-288	CH	N	CMe	CH	H	Cl	CO ₂ CH ₂ Ph
1-289	CH	CF	N	CH	H	H	CO ₂ H
1-290	CH	CF	N	CH	H	H	CO ₂ Me
1-291	CH	CF	N	CH	H	H	CO ₂ Et
1-292	CH	CF	N	CH	H	H	CO ₂ CH ₂ Ph
1-293	CH	CF	N	CH	H	F	CO ₂ H
1-294	CH	CF	N	CH	H	F	CO ₂ Me
1-295	CH	CF	N	CH	H	F	CO ₂ Et

Номер соединения	A	B	X	D	R ²	R ³	R ⁷
1-296	CH	CF	N	CH	H	F	CO ₂ CH ₂ Ph
1-297	CH	CF	N	CH	H	Cl	CO ₂ H
1-298	CH	CF	N	CH	H	Cl	CO ₂ Me
1-299	CH	CF	N	CH	H	Cl	CO ₂ Et
1-300	CH	CF	N	CH	H	Cl	CO ₂ CH ₂ Ph
1-301	CCF ₃	CH	N	CCl	H	H	CO ₂ H
1-302	CCF ₃	CH	N	CCl	H	H	CO ₂ Me
1-303	CCF ₃	CH	N	CCl	H	H	CO ₂ Et
1-304	CCF ₃	CH	N	CCl	H	H	CO ₂ CH ₂ Ph
1-305	CCF ₃	CH	N	CCl	H	F	CO ₂ H
1-306	CCF ₃	CH	N	CCl	H	F	CO ₂ Me
1-307	CCF ₃	CH	N	CCl	H	F	CO ₂ Et
1-308	CCF ₃	CH	N	CCl	H	F	CO ₂ CH ₂ Ph
1-309	CCF ₃	CH	N	CCl	H	Cl	CO ₂ H
1-310	CCF ₃	CH	N	CCl	H	Cl	CO ₂ Me
1-311	CCF ₃	CH	N	CCl	H	Cl	CO ₂ Et
1-312	CCF ₃	CH	N	CCl	H	Cl	CO ₂ CH ₂ Ph
1-313	N	CH	CH	CH	CF ₃	H	CO ₂ H
1-314	N	CH	CH	CH	CF ₃	H	CO ₂ Me
1-315	N	CH	CH	CH	CF ₃	H	CO ₂ Et
1-316	N	CH	CH	CH	CF ₃	H	CO ₂ CH ₂ Ph
1-317	N	CH	CH	CH	CF ₃	F	CO ₂ H
1-318	N	CH	CH	CH	CF ₃	F	CO ₂ Me
1-319	N	CH	CH	CH	CF ₃	F	CO ₂ Et
1-320	N	CH	CH	CH	CF ₃	F	CO ₂ CH ₂ Ph
1-321	N	CH	CH	CH	CF ₃	Cl	CO ₂ H
1-322	N	CH	CH	CH	CF ₃	Cl	CO ₂ Me
1-323	N	CH	CH	CH	CF ₃	Cl	CO ₂ Et
1-324	N	CH	CH	CH	CF ₃	Cl	CO ₂ CH ₂ Ph

Номер соединения	A	B	X	D	R ²	R ³	R ⁷
1-325	N	CH	CF	CCl	H	H	CO ₂ H
1-326	N	CH	CF	CCl	H	H	CO ₂ Me
1-327	N	CH	CF	CCl	H	H	CO ₂ Et
1-328	N	CH	CF	CCl	H	H	CO ₂ CH ₂ Ph
1-329	N	CH	CF	CCl	H	F	CO ₂ H
1-330	N	CH	CF	CCl	H	F	CO ₂ Me
1-331	N	CH	CF	CCl	H	F	CO ₂ Et
1-332	N	CH	CF	CCl	H	F	CO ₂ CH ₂ Ph
1-333	N	CH	CF	CCl	H	Cl	CO ₂ H
1-334	N	CH	CF	CCl	H	Cl	CO ₂ Me
1-335	N	CH	CF	CCl	H	Cl	CO ₂ Et
1-336	N	CH	CF	CCl	H	Cl	CO ₂ CH ₂ Ph
1-337	N	CH	CCl	CCF ₃	H	H	CO ₂ H
1-338	N	CH	CCl	CCF ₃	H	H	CO ₂ Me
1-339	N	CH	CCl	CCF ₃	H	H	CO ₂ Et
1-340	N	CH	CCl	CCF ₃	H	H	CO ₂ CH ₂ Ph
1-341	N	CH	CCl	CCF ₃	H	F	CO ₂ H
1-342	N	CH	CCl	CCF ₃	H	F	CO ₂ Me
1-343	N	CH	CCl	CCF ₃	H	F	CO ₂ Et
1-344	N	CH	CCl	CCF ₃	H	F	CO ₂ CH ₂ Ph
1-345	N	CH	CCl	CCF ₃	H	Cl	CO ₂ H
1-346	N	CH	CCl	CCF ₃	H	Cl	CO ₂ Me
1-347	N	CH	CCl	CCF ₃	H	Cl	CO ₂ Et
1-348	N	CH	CCl	CCF ₃	H	Cl	CO ₂ CH ₂ Ph
1-349	N	CH	CNO ₂	CCl	H	H	CO ₂ H
1-350	N	CH	CNO ₂	CCl	H	H	CO ₂ Me
1-351	N	CH	CNO ₂	CCl	H	H	CO ₂ Et
1-352	N	CH	CNO ₂	CCl	H	H	CO ₂ CH ₂ Ph
1-353	N	CH	CNO ₂	CCl	H	F	CO ₂ H

Номер соединения	A	B	X	D	R ²	R ³	R ⁷
1-354	N	CH	CNO ₂	CCl	H	F	CO ₂ Me
1-355	N	CH	CNO ₂	CCl	H	F	CO ₂ Et
1-356	N	CH	CNO ₂	CCl	H	F	CO ₂ CH ₂ Ph
1-357	N	CH	CNO ₂	CCl	H	Cl	CO ₂ H
1-358	N	CH	CNO ₂	CCl	H	Cl	CO ₂ Me
1-359	N	CH	CNO ₂	CCl	H	Cl	CO ₂ Et
1-360	N	CH	CNO ₂	CCl	H	Cl	CO ₂ CH ₂ Ph
1-361	N	CF	CH	CH	Me	H	CO ₂ H
1-362	N	CF	CH	CH	Me	H	CO ₂ Me
1-363	N	CF	CH	CH	Me	H	CO ₂ Et
1-364	N	CF	CH	CH	Me	H	CO ₂ CH ₂ Ph
1-365	N	CF	CH	CH	Me	F	CO ₂ H
1-366	N	CF	CH	CH	Me	F	CO ₂ Me
1-367	N	CF	CH	CH	Me	F	CO ₂ Et
1-368	N	CF	CH	CH	Me	F	CO ₂ CH ₂ Ph
1-369	N	CF	CH	CH	Me	Cl	CO ₂ H
1-370	N	CF	CH	CH	Me	Cl	CO ₂ Me
1-371	N	CF	CH	CH	Me	Cl	CO ₂ Et
1-372	N	CF	CH	CH	Me	Cl	CO ₂ CH ₂ Ph
1-373	CH	N	CH	CH	OMe	H	CO ₂ H
1-374	CH	N	CH	CH	OMe	H	CO ₂ Me
1-375	CH	N	CH	CH	OMe	H	CO ₂ Et
1-376	CH	N	CH	CH	OMe	H	CO ₂ CH ₂ Ph
1-377	CH	N	CH	CH	OMe	F	CO ₂ H
1-378	CH	N	CH	CH	OMe	F	CO ₂ Me
1-379	CH	N	CH	CH	OMe	F	CO ₂ Et
1-380	CH	N	CH	CH	OMe	F	CO ₂ CH ₂ Ph
1-381	CH	N	CH	CH	OMe	Cl	CO ₂ H
1-382	CH	N	CH	CH	OMe	Cl	CO ₂ Me

Номер соединения	A	B	X	D	R ²	R ³	R ⁷
1-383	CH	N	CH	CH	OMe	Cl	CO ₂ Et
1-384	CH	N	CH	CH	OMe	Cl	CO ₂ CH ₂ Ph
1-385	CH	N	CF	CH	F	H	CO ₂ H
1-386	CH	N	CF	CH	F	H	CO ₂ Me
1-387	CH	N	CF	CH	F	H	CO ₂ Et
1-388	CH	N	CF	CH	F	H	CO ₂ CH ₂ Ph
1-389	CH	N	CF	CH	F	F	CO ₂ H
1-390	CH	N	CF	CH	F	F	CO ₂ Me
1-391	CH	N	CF	CH	F	F	CO ₂ Et
1-392	CH	N	CF	CH	F	F	CO ₂ CH ₂ Ph
1-393	CH	N	CF	CH	F	Cl	CO ₂ H
1-394	CH	N	CF	CH	F	Cl	CO ₂ Me
1-395	CH	N	CF	CH	F	Cl	CO ₂ Et
1-396	CH	N	CF	CH	F	Cl	CO ₂ CH ₂ Ph
1-397	CH	N	CF	CH	Cl	H	CO ₂ H
1-398	CH	N	CF	CH	Cl	H	CO ₂ Me
1-399	CH	N	CF	CH	Cl	H	CO ₂ Et
1-400	CH	N	CF	CH	Cl	H	CO ₂ CH ₂ Ph
1-401	CH	N	CF	CH	Cl	F	CO ₂ H
1-402	CH	N	CF	CH	Cl	F	CO ₂ Me
1-403	CH	N	CF	CH	Cl	F	CO ₂ Et
1-404	CH	N	CF	CH	Cl	F	CO ₂ CH ₂ Ph
1-405	CH	N	CF	CH	Cl	Cl	CO ₂ H
1-406	CH	N	CF	CH	Cl	Cl	CO ₂ Me
1-407	CH	N	CF	CH	Cl	Cl	CO ₂ Et
1-408	CH	N	CF	CH	Cl	Cl	CO ₂ CH ₂ Ph
1-409	CH	N	CF	CH	OMe	H	CO ₂ H
1-410	CH	N	CF	CH	OMe	H	CO ₂ Me
1-411	CH	N	CF	CH	OMe	H	CO ₂ Et

Номер соединения	A	B	X	D	R ²	R ³	R ⁷
1-412	CH	N	CF	CH	OMe	H	CO ₂ CH ₂ Ph
1-413	CH	N	CF	CH	OMe	F	CO ₂ H
1-414	CH	N	CF	CH	OMe	F	CO ₂ Me
1-415	CH	N	CF	CH	OMe	F	CO ₂ Et
1-416	CH	N	CF	CH	OMe	F	CO ₂ CH ₂ Ph
1-417	CH	N	CF	CH	OMe	Cl	CO ₂ H
1-418	CH	N	CF	CH	OMe	Cl	CO ₂ Me
1-419	CH	N	CF	CH	OMe	Cl	CO ₂ Et
1-420	CH	N	CF	CH	OMe	Cl	CO ₂ CH ₂ Ph
1-421	CH	N	CCl	CH	Cl	H	CO ₂ H
1-422	CH	N	CCl	CH	Cl	H	CO ₂ Me
1-423	CH	N	CCl	CH	Cl	H	CO ₂ Et
1-424	CH	N	CCl	CH	Cl	H	CO ₂ CH ₂ Ph
1-425	CH	N	CCl	CH	Cl	F	CO ₂ H
1-426	CH	N	CCl	CH	Cl	F	CO ₂ Me
1-427	CH	N	CCl	CH	Cl	F	CO ₂ Et
1-428	CH	N	CCl	CH	Cl	F	CO ₂ CH ₂ Ph
1-429	CH	N	CCl	CH	Cl	Cl	CO ₂ H
1-430	CH	N	CCl	CH	Cl	Cl	CO ₂ Me
1-431	CH	N	CCl	CH	Cl	Cl	CO ₂ Et
1-432	CH	N	CCl	CH	Cl	Cl	CO ₂ CH ₂ Ph
1-433	CH	N	C(CH=CHCH=CH) c R ²	CH	(CH=CHCH=CH) c X	H	CO ₂ H
1-434	CH	N	C(CH=CHCH=CH) c R ²	CH	(CH=CHCH=CH) c X	H	CO ₂ Me
1-435	CH	N	C(CH=CHCH=CH) c R ²	CH	(CH=CHCH=CH) c X	H	CO ₂ Et
1-436	CH	N	C(CH=CHCH=CH) c R ²	CH	(CH=CHCH=CH) c X	H	CO ₂ CH ₂ Ph
1-437	CH	N	C(CH=CHCH=CH) c R ²	CH	(CH=CHCH=CH) c X	F	CO ₂ H
1-438	CH	N	C(CH=CHCH=CH) c R ²	CH	(CH=CHCH=CH) c X	F	CO ₂ Me

Номер соединения	A	B	X	D	R ²	R ³	R ⁷
1-439	CH	N	$C(CH=CHCH=CH)$ c R ²	CH	$(CH=CHCH=CH)$ c X	F	CO ₂ Et
1-440	CH	N	$C(CH=CHCH=CH)$ c R ²	CH	$(CH=CHCH=CH)$ c X	F	CO ₂ CH ₂ Ph
1-441	CH	N	$C(CH=CHCH=CH)$ c R ²	CH	$(CH=CHCH=CH)$ c X	Cl	CO ₂ H
1-442	CH	N	$C(CH=CHCH=CH)$ c R ²	CH	$(CH=CHCH=CH)$ c X	Cl	CO ₂ Me
1-443	CH	N	$C(CH=CHCH=CH)$ c R ²	CH	$(CH=CHCH=CH)$ c X	Cl	CO ₂ Et
1-444	CH	N	$C(CH=CHCH=CH)$ c R ²	CH	$(CH=CHCH=CH)$ c X	Cl	CO ₂ CH ₂ Ph
1-445	CH	N	$C(OCF_2O)$ c R ²	CH	(OCF_2O) c X	H	CO ₂ H
1-446	CH	N	$C(OCF_2O)$ c R ²	CH	(OCF_2O) c X	H	CO ₂ Me
1-447	CH	N	$C(OCF_2O)$ c R ²	CH	(OCF_2O) c X	H	CO ₂ Et
1-448	CH	N	$C(OCF_2O)$ c R ²	CH	(OCF_2O) c X	H	CO ₂ CH ₂ Ph
1-449	CH	N	$C(OCF_2O)$ c R ²	CH	(OCF_2O) c X	F	CO ₂ H
1-450	CH	N	$C(OCF_2O)$ c R ²	CH	(OCF_2O) c X	F	CO ₂ Me
1-451	CH	N	$C(OCF_2O)$ c R ²	CH	(OCF_2O) c X	F	CO ₂ Et
1-452	CH	N	$C(OCF_2O)$ c R ²	CH	(OCF_2O) c X	F	CO ₂ CH ₂ Ph
1-453	CH	N	$C(OCF_2O)$ c R ²	CH	(OCF_2O) c X	Cl	CO ₂ H
1-454	CH	N	$C(OCF_2O)$ c R ²	CH	(OCF_2O) c X	Cl	CO ₂ Me
1-455	CH	N	$C(OCF_2O)$ c R ²	CH	(OCF_2O) c X	Cl	CO ₂ Et
1-456	CH	N	$C(OCF_2O)$ c R ²	CH	(OCF_2O) c X	Cl	CO ₂ CH ₂ Ph
1-457	CF	N	CMe	CH	H	H	CO ₂ H
1-458	CF	N	CMe	CH	H	H	CO ₂ Me
1-459	CF	N	CMe	CH	H	H	CO ₂ Et
1-460	CF	N	CMe	CH	H	H	CO ₂ CH ₂ Ph
1-461	CF	N	CMe	CH	H	F	CO ₂ H
1-462	CF	N	CMe	CH	H	F	CO ₂ Me

Номер соединения	A	B	X	D	R ²	R ³	R ⁷
1-463	CF	N	CMe	CH	H	F	CO ₂ Et
1-464	CF	N	CMe	CH	H	F	CO ₂ CH ₂ Ph
1-465	CF	N	CMe	CH	H	Cl	CO ₂ H
1-466	CF	N	CMe	CH	H	Cl	CO ₂ Me
1-467	CF	N	CMe	CH	H	Cl	CO ₂ Et
1-468	CF	N	CMe	CH	H	Cl	CO ₂ CH ₂ Ph
1-469	CCl	N	CH	CH	F	H	CO ₂ H
1-470	CCl	N	CH	CH	F	H	CO ₂ Me
1-471	CCl	N	CH	CH	F	H	CO ₂ Et
1-472	CCl	N	CH	CH	F	H	CO ₂ CH ₂ Ph
1-473	CCl	N	CH	CH	F	F	CO ₂ H
1-474	CCl	N	CH	CH	F	F	CO ₂ Me
1-475	CCl	N	CH	CH	F	F	CO ₂ Et
1-476	CCl	N	CH	CH	F	F	CO ₂ CH ₂ Ph
1-477	CCl	N	CH	CH	F	Cl	CO ₂ H
1-478	CCl	N	CH	CH	F	Cl	CO ₂ Me
1-479	CCl	N	CH	CH	F	Cl	CO ₂ Et
1-480	CCl	N	CH	CH	F	Cl	CO ₂ CH ₂ Ph
1-481	CH	CH	N	CH	H	H	CO ₂ H
1-482	CH	CH	N	CH	H	H	CO ₂ Me
1-483	CH	CH	N	CH	H	H	CO ₂ Et
1-484	CH	CH	N	CH	H	H	CO ₂ CH ₂ Ph
1-485	CH	CH	N	CH	H	F	CO ₂ H
1-486	CH	CH	N	CH	H	F	CO ₂ Me
1-487	CH	CH	N	CH	H	F	CO ₂ Et
1-488	CH	CH	N	CH	H	F	CO ₂ CH ₂ Ph
1-489	CH	CH	N	CH	H	Cl	CO ₂ H
1-490	CH	CH	N	CH	H	Cl	CO ₂ Me
1-491	CH	CH	N	CH	H	Cl	CO ₂ Et

Номер соединения	A	B	X	D	R ²	R ³	R ⁷
1-492	CH	CH	N	CH	H	Cl	CO ₂ CH ₂ Ph
1-493	CH	CCF ₃	N	CH	H	H	CO ₂ H
1-494	CH	CCF ₃	N	CH	H	H	CO ₂ Me
1-495	CH	CCF ₃	N	CH	H	H	CO ₂ Et
1-496	CH	CCF ₃	N	CH	H	H	CO ₂ CH ₂ Ph
1-497	CH	CCF ₃	N	CH	H	F	CO ₂ H
1-498	CH	CCF ₃	N	CH	H	F	CO ₂ Me
1-499	CH	CCF ₃	N	CH	H	F	CO ₂ Et
1-500	CH	CCF ₃	N	CH	H	F	CO ₂ CH ₂ Ph
1-501	CH	CCF ₃	N	CH	H	Cl	CO ₂ H
1-502	CH	CCF ₃	N	CH	H	Cl	CO ₂ Me
1-503	CH	CCF ₃	N	CH	H	Cl	CO ₂ Et
1-504	CH	CCF ₃	N	CH	H	Cl	CO ₂ CH ₂ Ph
1-505	CH	CCl	N	COMe	H	H	CO ₂ H
1-506	CH	CCl	N	COMe	H	H	CO ₂ Me
1-507	CH	CCl	N	COMe	H	H	CO ₂ Et
1-508	CH	CCl	N	COMe	H	H	CO ₂ CH ₂ Ph
1-509	CH	CCl	N	COMe	H	F	CO ₂ H
1-510	CH	CCl	N	COMe	H	F	CO ₂ Me
1-511	CH	CCl	N	COMe	H	F	CO ₂ Et
1-512	CH	CCl	N	COMe	H	F	CO ₂ CH ₂ Ph
1-513	CH	CCl	N	COMe	H	Cl	CO ₂ H
1-514	CH	CCl	N	COMe	H	Cl	CO ₂ Me
1-515	CH	CCl	N	COMe	H	Cl	CO ₂ Et
1-516	CH	CCl	N	COMe	H	Cl	CO ₂ CH ₂ Ph
1-517	CH	CCl	N	CH	OMe	H	CO ₂ H
1-518	CH	CCl	N	CH	OMe	H	CO ₂ Me
1-519	CH	CCl	N	CH	OMe	H	CO ₂ Et
1-520	CH	CCl	N	CH	OMe	H	CO ₂ CH ₂ Ph

Номер соединения	A	B	X	D	R ²	R ³	R ⁷
1-521	CH	CCl	N	CH	OMe	F	CO ₂ H
1-522	CH	CCl	N	CH	OMe	F	CO ₂ Me
1-523	CH	CCl	N	CH	OMe	F	CO ₂ Et
1-524	CH	CCl	N	CH	OMe	F	CO ₂ CH ₂ Ph
1-525	CH	CCl	N	CH	OMe	Cl	CO ₂ H
1-526	CH	CCl	N	CH	OMe	Cl	CO ₂ Me
1-527	CH	CCl	N	CH	OMe	Cl	CO ₂ Et
1-528	CH	CCl	N	CH	OMe	Cl	CO ₂ CH ₂ Ph
1-529	CCl	CCl	N	CH	H	H	CO ₂ H
1-530	CCl	CCl	N	CH	H	H	CO ₂ Me
1-531	CCl	CCl	N	CH	H	H	CO ₂ Et
1-532	CCl	CCl	N	CH	H	H	CO ₂ CH ₂ Ph
1-533	CCl	CCl	N	CH	H	F	CO ₂ H
1-534	CCl	CCl	N	CH	H	F	CO ₂ Me
1-535	CCl	CCl	N	CH	H	F	CO ₂ Et
1-536	CCl	CCl	N	CH	H	F	CO ₂ CH ₂ Ph
1-537	CCl	CCl	N	CH	H	Cl	CO ₂ H
1-538	CCl	CCl	N	CH	H	Cl	CO ₂ Me
1-539	CCl	CCl	N	CH	H	Cl	CO ₂ Et
1-540	CCl	CCl	N	CH	H	Cl	CO ₂ CH ₂ Ph
1-541	N	CH	CF	CF	H	H	CO ₂ H
1-542	N	CH	CF	CF	H	H	CO ₂ Me
1-543	N	CH	CF	CF	H	H	CO ₂ Et
1-544	N	CH	CF	CF	H	H	CO ₂ CH ₂ Ph
1-545	N	CH	CF	CF	H	F	CO ₂ H
1-546	N	CH	CF	CF	H	F	CO ₂ Me
1-547	N	CH	CF	CF	H	F	CO ₂ Et
1-548	N	CH	CF	CF	H	F	CO ₂ CH ₂ Ph
1-549	N	CH	CF	CF	H	Cl	CO ₂ H

Номер соединения	A	B	X	D	R ²	R ³	R ⁷
1-550	N	CH	CF	CF	H	Cl	CO ₂ Me
1-551	N	CH	CF	CF	H	Cl	CO ₂ Et
1-552	N	CH	CF	CF	H	Cl	CO ₂ CH ₂ Ph
1-553	N	CH	CBr	CCl	H	H	CO ₂ H
1-554	N	CH	CBr	CCl	H	H	CO ₂ Me
1-555	N	CH	CBr	CCl	H	H	CO ₂ Et
1-556	N	CH	CBr	CCl	H	H	CO ₂ CH ₂ Ph
1-557	N	CH	CBr	CCl	H	F	CO ₂ H
1-558	N	CH	CBr	CCl	H	F	CO ₂ Me
1-559	N	CH	CBr	CCl	H	F	CO ₂ Et
1-560	N	CH	CBr	CCl	H	F	CO ₂ CH ₂ Ph
1-561	N	CH	CBr	CCl	H	Cl	CO ₂ H
1-562	N	CH	CBr	CCl	H	Cl	CO ₂ Me
1-563	N	CH	CBr	CCl	H	Cl	CO ₂ Et
1-564	N	CH	CBr	CCl	H	Cl	CO ₂ CH ₂ Ph
1-565	N	CH	CCF ₃	CBr	H	H	CO ₂ H
1-566	N	CH	CCF ₃	CBr	H	H	CO ₂ Me
1-567	N	CH	CCF ₃	CBr	H	H	CO ₂ Et
1-568	N	CH	CCF ₃	CBr	H	H	CO ₂ CH ₂ Ph
1-569	N	CH	CCF ₃	CBr	H	F	CO ₂ H
1-570	N	CH	CCF ₃	CBr	H	F	CO ₂ Me
1-571	N	CH	CCF ₃	CBr	H	F	CO ₂ Et
1-572	N	CH	CCF ₃	CBr	H	F	CO ₂ CH ₂ Ph
1-573	N	CH	CCF ₃	CBr	H	Cl	CO ₂ H
1-574	N	CH	CCF ₃	CBr	H	Cl	CO ₂ Me
1-575	N	CH	CCF ₃	CBr	H	Cl	CO ₂ Et
1-576	N	CH	CCF ₃	CBr	H	Cl	CO ₂ CH ₂ Ph
1-577	N	CH	CCHF ₂	CCl	H	H	CO ₂ H
1-578	N	CH	CCHF ₂	CCl	H	H	CO ₂ Me

Номер соединения	A	B	X	D	R ²	R ³	R ⁷
1-579	N	CH	CCHF ₂	CCl	H	H	CO ₂ Et
1-580	N	CH	CCHF ₂	CCl	H	H	CO ₂ CH ₂ Ph
1-581	N	CH	CCHF ₂	CCl	H	F	CO ₂ H
1-582	N	CH	CCHF ₂	CCl	H	F	CO ₂ Me
1-583	N	CH	CCHF ₂	CCl	H	F	CO ₂ Et
1-584	N	CH	CCHF ₂	CCl	H	F	CO ₂ CH ₂ Ph
1-585	N	CH	CCHF ₂	CCl	H	Cl	CO ₂ H
1-586	N	CH	CCHF ₂	CCl	H	Cl	CO ₂ Me
1-587	N	CH	CCHF ₂	CCl	H	Cl	CO ₂ Et
1-588	N	CH	CCHF ₂	CCl	H	Cl	CO ₂ CH ₂ Ph
1-589	N	CH	CCF ₂ Me	CCl	H	H	CO ₂ H
1-590	N	CH	CCF ₂ Me	CCl	H	H	CO ₂ Me
1-591	N	CH	CCF ₂ Me	CCl	H	H	CO ₂ Et
1-592	N	CH	CCF ₂ Me	CCl	H	H	CO ₂ CH ₂ Ph
1-593	N	CH	CCF ₂ Me	CCl	H	F	CO ₂ H
1-594	N	CH	CCF ₂ Me	CCl	H	F	CO ₂ Me
1-595	N	CH	CCF ₂ Me	CCl	H	F	CO ₂ Et
1-596	N	CH	CCF ₂ Me	CCl	H	F	CO ₂ CH ₂ Ph
1-597	N	CH	CCF ₂ Me	CCl	H	Cl	CO ₂ H
1-598	N	CH	CCF ₂ Me	CCl	H	Cl	CO ₂ Me
1-599	N	CH	CCF ₂ Me	CCl	H	Cl	CO ₂ Et
1-600	N	CH	CCF ₂ Me	CCl	H	Cl	CO ₂ CH ₂ Ph
1-601	N	CH	CCN	CCl	H	H	CO ₂ H
1-602	N	CH	CCN	CCl	H	H	CO ₂ Me
1-603	N	CH	CCN	CCl	H	H	CO ₂ Et
1-604	N	CH	CCN	CCl	H	H	CO ₂ CH ₂ Ph
1-605	N	CH	CCN	CCl	H	F	CO ₂ H
1-606	N	CH	CCN	CCl	H	F	CO ₂ Me
1-607	N	CH	CCN	CCl	H	F	CO ₂ Et

Номер соединения	A	B	X	D	R ²	R ³	R ⁷
1-608	N	CH	CCN	CCl	H	F	CO ₂ CH ₂ Ph
1-609	N	CH	CCN	CCl	H	Cl	CO ₂ H
1-610	N	CH	CCN	CCl	H	Cl	CO ₂ Me
1-611	N	CH	CCN	CCl	H	Cl	CO ₂ Et
1-612	N	CH	CCN	CCl	H	Cl	CO ₂ CH ₂ Ph
1-613	N	CH	COCHF ₂	CCl	H	H	CO ₂ H
1-614	N	CH	COCHF ₂	CCl	H	H	CO ₂ Me
1-615	N	CH	COCHF ₂	CCl	H	H	CO ₂ Et
1-616	N	CH	COCHF ₂	CCl	H	H	CO ₂ CH ₂ Ph
1-617	N	CH	COCHF ₂	CCl	H	F	CO ₂ H
1-618	N	CH	COCHF ₂	CCl	H	F	CO ₂ Me
1-619	N	CH	COCHF ₂	CCl	H	F	CO ₂ Et
1-620	N	CH	COCHF ₂	CCl	H	F	CO ₂ CH ₂ Ph
1-621	N	CH	COCHF ₂	CCl	H	Cl	CO ₂ H
1-622	N	CH	COCHF ₂	CCl	H	Cl	CO ₂ Me
1-623	N	CH	COCHF ₂	CCl	H	Cl	CO ₂ Et
1-624	N	CH	COCHF ₂	CCl	H	Cl	CO ₂ CH ₂ Ph
1-625	N	CH	CCOMe	CCl	H	H	CO ₂ H
1-626	N	CH	CCOMe	CCl	H	H	CO ₂ Me
1-627	N	CH	CCOMe	CCl	H	H	CO ₂ Et
1-628	N	CH	CCOMe	CCl	H	H	CO ₂ CH ₂ Ph
1-629	N	CH	CCOMe	CCl	H	F	CO ₂ H
1-630	N	CH	CCOMe	CCl	H	F	CO ₂ Me
1-631	N	CH	CCOMe	CCl	H	F	CO ₂ Et
1-632	N	CH	CCOMe	CCl	H	F	CO ₂ CH ₂ Ph
1-633	N	CH	CCOMe	CCl	H	Cl	CO ₂ H
1-634	N	CH	CCOMe	CCl	H	Cl	CO ₂ Me
1-635	N	CH	CCOMe	CCl	H	Cl	CO ₂ Et
1-636	N	CH	CCOMe	CCl	H	Cl	CO ₂ CH ₂ Ph

Номер соединения	A	B	X	D	R ²	R ³	R ⁷
1-637	N	CH	CSO ₂ Me	CCl	H	H	CO ₂ H
1-638	N	CH	CSO ₂ Me	CCl	H	H	CO ₂ Me
1-639	N	CH	CSO ₂ Me	CCl	H	H	CO ₂ Et
1-640	N	CH	CSO ₂ Me	CCl	H	H	CO ₂ CH ₂ Ph
1-641	N	CH	CSO ₂ Me	CCl	H	F	CO ₂ H
1-642	N	CH	CSO ₂ Me	CCl	H	F	CO ₂ Me
1-643	N	CH	CSO ₂ Me	CCl	H	F	CO ₂ Et
1-644	N	CH	CSO ₂ Me	CCl	H	F	CO ₂ CH ₂ Ph
1-645	N	CH	CSO ₂ Me	CCl	H	Cl	CO ₂ H
1-646	N	CH	CSO ₂ Me	CCl	H	Cl	CO ₂ Me
1-647	N	CH	CSO ₂ Me	CCl	H	Cl	CO ₂ Et
1-648	N	CH	CSO ₂ Me	CCl	H	Cl	CO ₂ CH ₂ Ph
1-649	CCl	N	CCF ₃	CH	H	H	CO ₂ H
1-650	CCl	N	CCF ₃	CH	H	H	CO ₂ Me
1-651	CCl	N	CCF ₃	CH	H	H	CO ₂ Et
1-652	CCl	N	CCF ₃	CH	H	H	CO ₂ CH ₂ Ph
1-653	CCl	N	CCF ₃	CH	H	F	CO ₂ H
1-654	CCl	N	CCF ₃	CH	H	F	CO ₂ Me
1-655	CCl	N	CCF ₃	CH	H	F	CO ₂ Et
1-656	CCl	N	CCF ₃	CH	H	F	CO ₂ CH ₂ Ph
1-657	CCl	N	CCF ₃	CH	H	Cl	CO ₂ H
1-658	CCl	N	CCF ₃	CH	H	Cl	CO ₂ Me
1-659	CCl	N	CCF ₃	CH	H	Cl	CO ₂ Et
1-660	CCl	N	CCF ₃	CH	H	Cl	CO ₂ CH ₂ Ph
1-661	CCl	CH	CCF ₃	NO	H	H	CO ₂ H
1-662	CCl	CH	CCF ₃	NO	H	H	CO ₂ Me
1-663	CCl	CH	CCF ₃	NO	H	H	CO ₂ Et
1-664	CCl	CH	CCF ₃	NO	H	H	CO ₂ CH ₂ Ph
1-665	CCl	CH	CCF ₃	NO	H	F	CO ₂ H

Номер соединения	A	B	X	D	R ²	R ³	R ⁷
1-666	CCl	CH	CCF ₃	NO	H	F	CO ₂ Me
1-667	CCl	CH	CCF ₃	NO	H	F	CO ₂ Et
1-668	CCl	CH	CCF ₃	NO	H	F	CO ₂ CH ₂ Ph
1-669	CCl	CH	CCF ₃	NO	H	Cl	CO ₂ H
1-670	CCl	CH	CCF ₃	NO	H	Cl	CO ₂ Me
1-671	CCl	CH	CCF ₃	NO	H	Cl	CO ₂ Et
1-672	CCl	CH	CCF ₃	NO	H	Cl	CO ₂ CH ₂ Ph
1-673	N	N	CCl	CH	H	H	CO ₂ H
1-674	N	N	CCl	CH	H	H	CO ₂ Me
1-675	N	N	CCl	CH	H	H	CO ₂ Et
1-676	N	N	CCl	CH	H	H	CO ₂ CH ₂ Ph
1-677	N	N	CCl	CH	H	F	CO ₂ H
1-678	N	N	CCl	CH	H	F	CO ₂ Me
1-679	N	N	CCl	CH	H	F	CO ₂ Et
1-680	N	N	CCl	CH	H	F	CO ₂ CH ₂ Ph
1-681	N	N	CCl	CH	H	Cl	CO ₂ H
1-682	N	N	CCl	CH	H	Cl	CO ₂ Me
1-683	N	N	CCl	CH	H	Cl	CO ₂ Et
1-684	N	N	CCl	CH	H	Cl	CO ₂ CH ₂ Ph
1-685	N	N	CCl	CCl	H	H	CO ₂ H
1-686	N	N	CCl	CCl	H	H	CO ₂ Me
1-687	N	N	CCl	CCl	H	H	CO ₂ Et
1-688	N	N	CCl	CCl	H	H	CO ₂ CH ₂ Ph
1-689	N	N	CCl	CCl	H	F	CO ₂ H
1-690	N	N	CCl	CCl	H	F	CO ₂ Me
1-691	N	N	CCl	CCl	H	F	CO ₂ Et
1-692	N	N	CCl	CCl	H	F	CO ₂ CH ₂ Ph
1-693	N	N	CCl	CCl	H	Cl	CO ₂ H
1-694	N	N	CCl	CCl	H	Cl	CO ₂ Me

Номер соединения	A	B	X	D	R ²	R ³	R ⁷
1-695	N	N	CCl	CCl	H	Cl	CO ₂ Et
1-696	N	N	CCl	CCl	H	Cl	CO ₂ CH ₂ Ph
1-697	N	N	COMe	CH	H	H	CO ₂ H
1-698	N	N	COMe	CH	H	H	CO ₂ Me
1-699	N	N	COMe	CH	H	H	CO ₂ Et
1-700	N	N	COMe	CH	H	H	CO ₂ CH ₂ Ph
1-701	N	N	COMe	CH	H	F	CO ₂ H
1-702	N	N	COMe	CH	H	F	CO ₂ Me
1-703	N	N	COMe	CH	H	F	CO ₂ Et
1-704	N	N	COMe	CH	H	F	CO ₂ CH ₂ Ph
1-705	N	N	COMe	CH	H	Cl	CO ₂ H
1-706	N	N	COMe	CH	H	Cl	CO ₂ Me
1-707	N	N	COMe	CH	H	Cl	CO ₂ Et
1-708	N	N	COMe	CH	H	Cl	CO ₂ CH ₂ Ph
1-709	N	N	CCF ₃	CBr	H	H	CO ₂ H
1-710	N	N	CCF ₃	CBr	H	H	CO ₂ Me
1-711	N	N	CCF ₃	CBr	H	H	CO ₂ Et
1-712	N	N	CCF ₃	CBr	H	H	CO ₂ CH ₂ Ph
1-713	N	N	CCF ₃	CBr	H	F	CO ₂ H
1-714	N	N	CCF ₃	CBr	H	F	CO ₂ Me
1-715	N	N	CCF ₃	CBr	H	F	CO ₂ Et
1-716	N	N	CCF ₃	CBr	H	F	CO ₂ CH ₂ Ph
1-717	N	N	CCF ₃	CBr	H	Cl	CO ₂ H
1-718	N	N	CCF ₃	CBr	H	Cl	CO ₂ Me
1-719	N	N	CCF ₃	CBr	H	Cl	CO ₂ Et
1-720	N	N	CCF ₃	CBr	H	Cl	CO ₂ CH ₂ Ph
1-721	CH	N	CH	N	CF ₃	H	CO ₂ H
1-722	CH	N	CH	N	CF ₃	H	CO ₂ Me
1-723	CH	N	CH	N	CF ₃	H	CO ₂ Et

Номер соединения	A	B	X	D	R ²	R ³	R ⁷
1-724	CH	N	CH	N	CF ₃	H	CO ₂ CH ₂ Ph
1-725	CH	N	CH	N	CF ₃	F	CO ₂ H
1-726	CH	N	CH	N	CF ₃	F	CO ₂ Me
1-727	CH	N	CH	N	CF ₃	F	CO ₂ Et
1-728	CH	N	CH	N	CF ₃	F	CO ₂ CH ₂ Ph
1-729	CH	N	CH	N	CF ₃	Cl	CO ₂ H
1-730	CH	N	CH	N	CF ₃	Cl	CO ₂ Me
1-731	CH	N	CH	N	CF ₃	Cl	CO ₂ Et
1-732	CH	N	CH	N	CF ₃	Cl	CO ₂ CH ₂ Ph
1-733	CH	N	CMe	N	H	H	CO ₂ H
1-734	CH	N	CMe	N	H	H	CO ₂ Me
1-735	CH	N	CMe	N	H	H	CO ₂ Et
1-736	CH	N	CMe	N	H	H	CO ₂ CH ₂ Ph
1-737	CH	N	CMe	N	H	F	CO ₂ H
1-738	CH	N	CMe	N	H	F	CO ₂ Me
1-739	CH	N	CMe	N	H	F	CO ₂ Et
1-740	CH	N	CMe	N	H	F	CO ₂ CH ₂ Ph
1-741	CH	N	CMe	N	H	Cl	CO ₂ H
1-742	CH	N	CMe	N	H	Cl	CO ₂ Me
1-743	CH	N	CMe	N	H	Cl	CO ₂ Et
1-744	CH	N	CMe	N	H	Cl	CO ₂ CH ₂ Ph
1-745	CH	N	CCF ₃	N	H	H	CO ₂ H
1-746	CH	N	CCF ₃	N	H	H	CO ₂ Me
1-747	CH	N	CCF ₃	N	H	H	CO ₂ Et
1-748	CH	N	CCF ₃	N	H	H	CO ₂ CH ₂ Ph
1-749	CH	N	CCF ₃	N	H	F	CO ₂ H
1-750	CH	N	CCF ₃	N	H	F	CO ₂ Me
1-751	CH	N	CCF ₃	N	H	F	CO ₂ Et
1-752	CH	N	CCF ₃	N	H	F	CO ₂ CH ₂ Ph

Номер соединения	A	B	X	D	R ²	R ³	R ⁷
1-753	CH	N	CCF ₃	N	H	Cl	CO ₂ H
1-754	CH	N	CCF ₃	N	H	Cl	CO ₂ Me
1-755	CH	N	CCF ₃	N	H	Cl	CO ₂ Et
1-756	CH	N	CCF ₃	N	H	Cl	CO ₂ CH ₂ Ph
1-757	CH	N	C(CH=CHC(CF ₃)=CH) c R ²	N	(CH=C(CF ₃)CH=CH) c X	H	CO ₂ H
1-758	CH	N	C(CH=CHC(CF ₃)=CH) c R ²	N	(CH=C(CF ₃)CH=CH) c X	H	CO ₂ Me
1-759	CH	N	C(CH=CHC(CF ₃)=CH) c R ²	N	(CH=C(CF ₃)CH=CH) c X	H	CO ₂ Et
1-760	CH	N	C(CH=CHC(CF ₃)=CH) c R ²	N	(CH=C(CF ₃)CH=CH) c X	H	CO ₂ CH ₂ Ph
1-761	CH	N	C(CH=CHC(CF ₃)=CH) c R ²	N	(CH=C(CF ₃)CH=CH) c X	F	CO ₂ H
1-762	CH	N	C(CH=CHC(CF ₃)=CH) c R ²	N	(CH=C(CF ₃)CH=CH) c X	F	CO ₂ Me
1-763	CH	N	C(CH=CHC(CF ₃)=CH) c R ²	N	(CH=C(CF ₃)CH=CH) c X	F	CO ₂ Et
1-764	CH	N	C(CH=CHC(CF ₃)=CH) c R ²	N	(CH=C(CF ₃)CH=CH) c X	F	CO ₂ CH ₂ Ph
1-765	CH	N	C(CH=CHC(CF ₃)=CH) c R ²	N	(CH=C(CF ₃)CH=CH) c X	Cl	CO ₂ H
1-766	CH	N	C(CH=CHC(CF ₃)=CH) c R ²	N	(CH=C(CF ₃)CH=CH) c X	Cl	CO ₂ Me
1-767	CH	N	C(CH=CHC(CF ₃)=CH) c R ²	N	(CH=C(CF ₃)CH=CH) c X	Cl	CO ₂ Et
1-768	CH	N	C(CH=CHC(CF ₃)=CH) c R ²	N	(CH=C(CF ₃)CH=CH) c X	Cl	CO ₂ CH ₂ Ph
1-769	CMe	N	CH	N	H	H	CO ₂ H
1-770	CMe	N	CH	N	H	H	CO ₂ Me
1-771	CMe	N	CH	N	H	H	CO ₂ Et
1-772	CMe	N	CH	N	H	H	CO ₂ CH ₂ Ph
1-773	CMe	N	CH	N	H	F	CO ₂ H
1-774	CMe	N	CH	N	H	F	CO ₂ Me
1-775	CMe	N	CH	N	H	F	CO ₂ Et
1-776	CMe	N	CH	N	H	F	CO ₂ CH ₂ Ph
1-777	CMe	N	CH	N	H	Cl	CO ₂ H
1-778	CMe	N	CH	N	H	Cl	CO ₂ Me
1-779	CMe	N	CH	N	H	Cl	CO ₂ Et
1-780	CMe	N	CH	N	H	Cl	CO ₂ CH ₂ Ph
1-781	CMe	N	CH	N	Me	H	CO ₂ H

Номер соединения	A	B	X	D	R ²	R ³	R ⁷
1-782	CMe	N	CH	N	Me	H	CO ₂ Me
1-783	CMe	N	CH	N	Me	H	CO ₂ Et
1-784	CMe	N	CH	N	Me	H	CO ₂ CH ₂ Ph
1-785	CMe	N	CH	N	Me	F	CO ₂ H
1-786	CMe	N	CH	N	Me	F	CO ₂ Me
1-787	CMe	N	CH	N	Me	F	CO ₂ Et
1-788	CMe	N	CH	N	Me	F	CO ₂ CH ₂ Ph
1-789	CMe	N	CH	N	Me	Cl	CO ₂ H
1-790	CMe	N	CH	N	Me	Cl	CO ₂ Me
1-791	CMe	N	CH	N	Me	Cl	CO ₂ Et
1-792	CMe	N	CH	N	Me	Cl	CO ₂ CH ₂ Ph
1-793	CMe	N	CCF ₃	N	H	H	CO ₂ H
1-794	CMe	N	CCF ₃	N	H	H	CO ₂ Me
1-795	CMe	N	CCF ₃	N	H	H	CO ₂ Et
1-796	CMe	N	CCF ₃	N	H	H	CO ₂ CH ₂ Ph
1-797	CMe	N	CCF ₃	N	H	F	CO ₂ H
1-798	CMe	N	CCF ₃	N	H	F	CO ₂ Me
1-799	CMe	N	CCF ₃	N	H	F	CO ₂ Et
1-800	CMe	N	CCF ₃	N	H	F	CO ₂ CH ₂ Ph
1-801	CMe	N	CCF ₃	N	H	Cl	CO ₂ H
1-802	CMe	N	CCF ₃	N	H	Cl	CO ₂ Me
1-803	CMe	N	CCF ₃	N	H	Cl	CO ₂ Et
1-804	CMe	N	CCF ₃	N	H	Cl	CO ₂ CH ₂ Ph
1-805	CCl	N	CCF ₃	N	H	H	CO ₂ H
1-806	CCl	N	CCF ₃	N	H	H	CO ₂ Me
1-807	CCl	N	CCF ₃	N	H	H	CO ₂ Et
1-808	CCl	N	CCF ₃	N	H	H	CO ₂ CH ₂ Ph
1-809	CCl	N	CCF ₃	N	H	F	CO ₂ H
1-810	CCl	N	CCF ₃	N	H	F	CO ₂ Me

Номер соединения	A	B	X	D	R ²	R ³	R ⁷
1-811	CCl	N	CCF ₃	N	H	F	CO ₂ Et
1-812	CCl	N	CCF ₃	N	H	F	CO ₂ CH ₂ Ph
1-813	CCl	N	CCF ₃	N	H	Cl	CO ₂ H
1-814	CCl	N	CCF ₃	N	H	Cl	CO ₂ Me
1-815	CCl	N	CCF ₃	N	H	Cl	CO ₂ Et
1-816	CCl	N	CCF ₃	N	H	Cl	CO ₂ CH ₂ Ph
1-817	CCF ₃	N	CH	N	H	H	CO ₂ H
1-818	CCF ₃	N	CH	N	H	H	CO ₂ Me
1-819	CCF ₃	N	CH	N	H	H	CO ₂ Et
1-820	CCF ₃	N	CH	N	H	H	CO ₂ CH ₂ Ph
1-821	CCF ₃	N	CH	N	H	F	CO ₂ H
1-822	CCF ₃	N	CH	N	H	F	CO ₂ Me
1-823	CCF ₃	N	CH	N	H	F	CO ₂ Et
1-824	CCF ₃	N	CH	N	H	F	CO ₂ CH ₂ Ph
1-825	CCF ₃	N	CH	N	H	Cl	CO ₂ H
1-826	CCF ₃	N	CH	N	H	Cl	CO ₂ Me
1-827	CCF ₃	N	CH	N	H	Cl	CO ₂ Et
1-828	CCF ₃	N	CH	N	H	Cl	CO ₂ CH ₂ Ph
1-829	CBr	N	CH	CH	CF ₃	H	CO ₂ H
1-830	CBr	N	CH	CH	CF ₃	H	CO ₂ Me
1-831	CBr	N	CH	CH	CF ₃	H	CO ₂ Et
1-832	CBr	N	CH	CH	CF ₃	H	CO ₂ CH ₂ Ph
1-833	CBr	N	CH	CH	CF ₃	F	CO ₂ H
1-834	CBr	N	CH	CH	CF ₃	F	CO ₂ Me
1-835	CBr	N	CH	CH	CF ₃	F	CO ₂ Et
1-836	CBr	N	CH	CH	CF ₃	F	CO ₂ CH ₂ Ph
1-837	CBr	N	CH	CH	CF ₃	Cl	CO ₂ H
1-838	CBr	N	CH	CH	CF ₃	Cl	CO ₂ Me
1-839	CBr	N	CH	CH	CF ₃	Cl	CO ₂ Et

Номер соединения	A	B	X	D	R ²	R ³	R ⁷
1-840	CBr	N	CH	CH	CF ₃	Cl	CO ₂ CH ₂ Ph

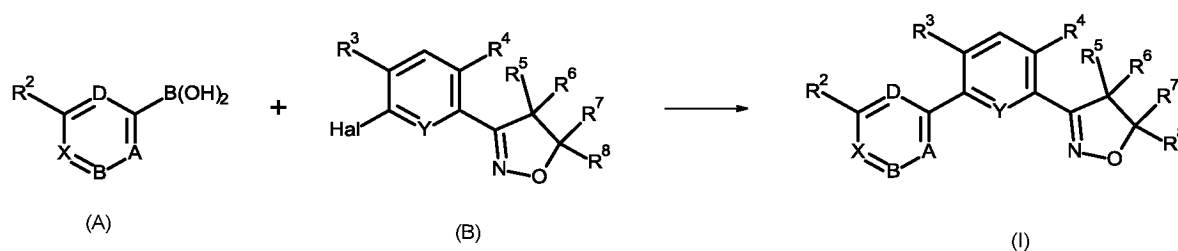
840 соединений формулы (I), где Y представляет собой C-H, R⁴ представляет собой циано, R⁵ и R⁶ представляют собой водород, R⁸ представляет собой метил, и значения A, B, X, D, R², R³ и R⁷ являются такими, как указано в таблице 1 для соединений от 1-1 до 1-840, обозначены как соединения под номерами от 2-1 до 2-840 соответственно,

840 соединений формулы (I), где Y представляет собой N, R⁴ представляет собой хлор, R⁵ и R⁶ представляют собой водород, R⁸ представляет собой метил, и значения A, B, X, D, R², R³ и R⁷ являются такими, как указано в таблице 1 для соединений от 1-1 до 1-840, обозначены как соединения под номерами от 3-1 до 3-840 соответственно.

Соединения по настоящему изобретению могут быть получены с помощью методик, известных специалисту в области органической химии. Общие способы получения соединений формулы (I) описаны ниже. Если в тексте не указано иное, то заместители A, B, D, X, Y, Z, R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶, R⁷, R⁸, R⁹, R¹⁰, R¹¹, R¹², R¹³, R¹⁴, R¹⁵, R¹⁶, R¹⁷, R¹⁸, R¹⁹ и R²⁰ являются такими, как определено выше в данном документе. Исходные материалы, используемые для получения соединений по настоящему изобретению, могут быть приобретены у обычных коммерческих поставщиков или могут быть получены с помощью известных способов. Исходные материалы, а также промежуточные продукты могут быть очищены перед использованием на следующей стадии с помощью известных из уровня техники методик, таких как хроматография, кристаллизация, перегонка и фильтрация.

Соединения формулы (I) могут быть получены из соединений формулы (A) и соединений формулы (B), как показано на схеме реакции 1.

Схема реакции 1



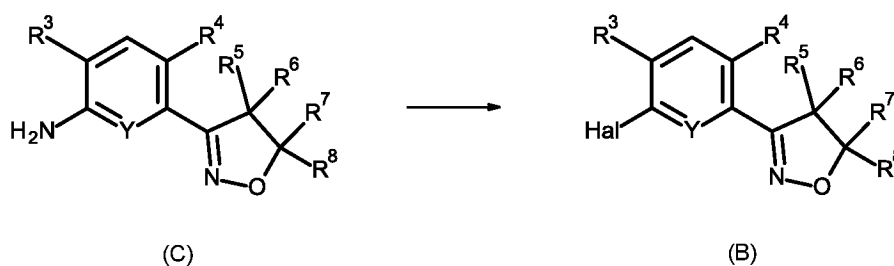
Например, смесь соединения формулы (A) и соединения формулы (B), где Hal представляет атом галогена, например атом хлора, брома или йода, может быть обработана металлическим катализатором, таким как ацетат палладия, необязательно в

присутствии подходящего лиганда, такого как фосфиновый лиганд, например S-Phos, или предварительно образованным комплексом металла и лиганда, таким как $dprf$ дихлорид палладия, и основанием, таким как ацетат калия, в подходящем растворителе, таком как диоксан.

5 Бороновые кислоты (или соответствующие сложные боронатные эфиры) формулы (A) являются доступными или могут быть получены с помощью способов, широко известных в литературе.

Соединения формулы (B) могут быть получены из анилинов формулы (C), как показано на схеме реакции 2.

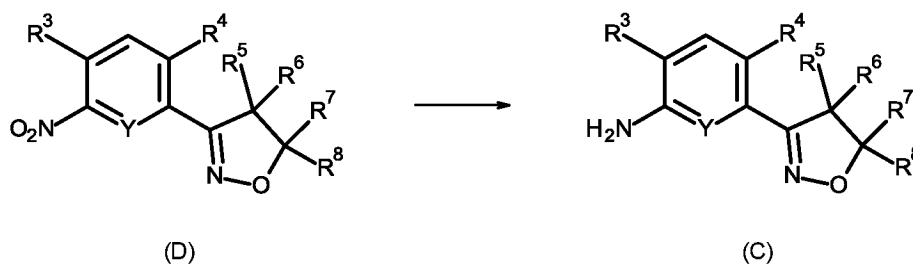
10 Схема реакции 2



Например, соединение формулы (C) может быть обработано галогенидом металла, таким как йодид калия, и нитрозилирующим реагентом, таким как нитрит натрия и толуолсульфоновая кислота, в подходящем растворителе, таком как смесь воды и ацетонитрила.

15 Анилины формулы (C) могут быть получены из нитросоединений формулы (D), как показано на схеме реакции 3.

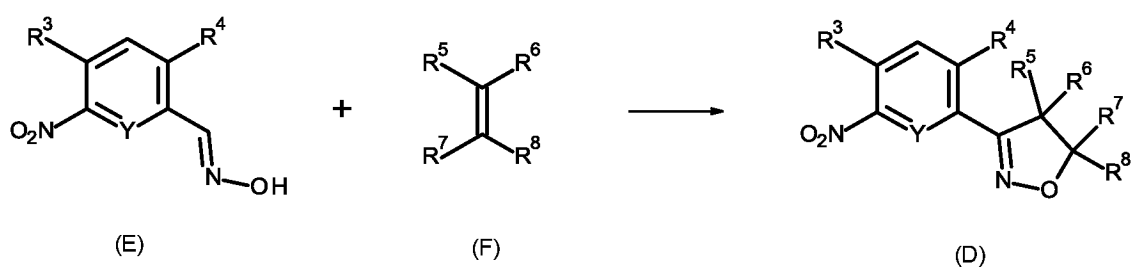
Схема реакции 3



20 Например, соединение формулы (D) может быть обработано восстановителем, таким как железо и хлорид аммония, в подходящем растворителе, таком как смесь воды и этанола.

Нитросоединения формулы (D) могут быть получены из оксимов формулы (E) и алкенов формулы (F), как показано на схеме реакции 4.

Схема реакции 4

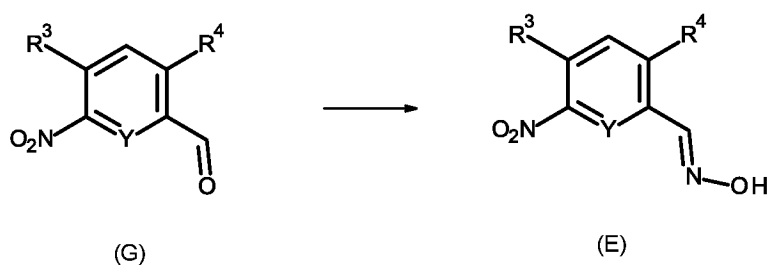


Например, оксим формулы (E) может быть обработан N-хлорсукцинимидом в подходящем растворителе, таком как диметилформамид, и полученное промежуточное соединение затем обрабатывают алкеном формулы (F) в присутствии основания, такого как триэтиламин, в подходящем растворителе, таком как дихлорметан.

Алкены формулы (F) доступны или могут быть получены с помощью способов, широко известных в литературе.

Оксимы формулы (E) могут быть получены из альдегидов формулы (G), как показано на схеме реакции 5.

Схема реакции 5

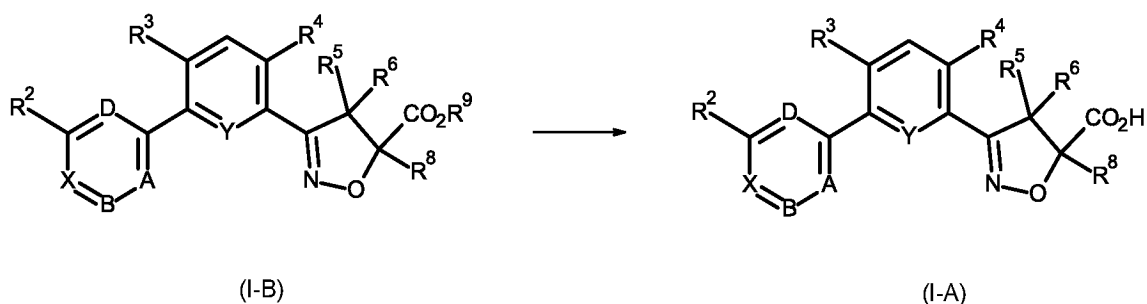


Например, альдегид формулы (G) может быть обработан гидрохлоридом гидроксиламина в подходящем растворителе, таком как смесь воды и этанола.

Альдегиды формулы (G) являются доступными или могут быть получены с помощью способов, известных в литературе.

Соединения формулы (I-A), которые представляют собой соединения формулы (I), в которых R⁷ представляет собой группу карбоновой кислоты, могут быть получены из соединений формулы (I-B), которые представляют собой соединения формулы (I), в которых R⁷ представляет собой CO₂R⁹, как показано на схеме реакции 6.

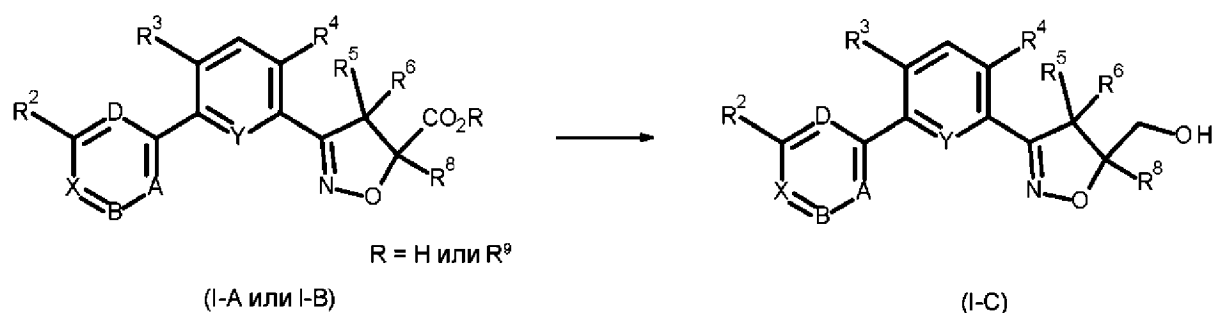
Схема реакции 6



Например, соединение формулы (I-B) может быть обработано гидроксидом натрия в подходящем растворителе, таком как смесь воды и этанола.

- 5 Соединения формулы (I-C), которые представляют собой соединения формулы (I), в которых R^7 представляет собой гидроксиметильную группу, могут быть получены из соединений формулы (I-A или I-B), как показано на схеме реакции 7.

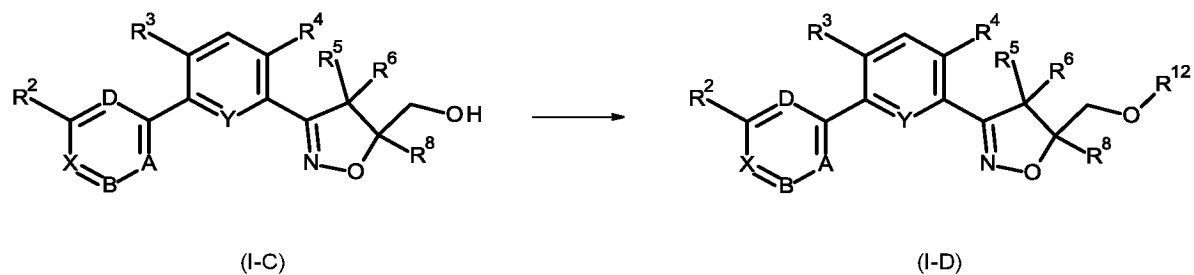
Схема реакции 7



- 10 Например, соединение формулы (I-A) или (I-B) может быть обработано подходящим восстановителем, например металлгидридным реагентом, таким как борогидрид натрия или боран, в подходящем растворителе, таком как тетрагидрофуран.

- 15 Соединения формулы (I-D), которые представляют собой соединения формулы (I), в которых R^7 представляет собой $\text{CH}_2\text{OR}^{12}$, могут быть получены из соединений формулы (I-C), как показано на схеме реакции 8.

Схема реакции 8

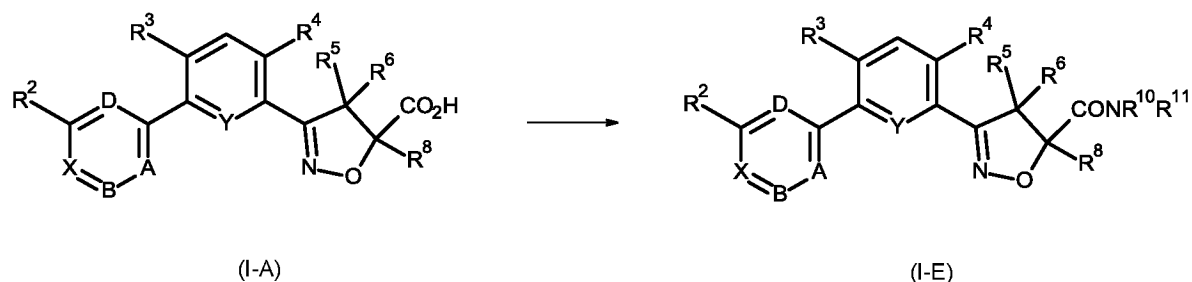


- 20 Например, соединение формулы (I-C) может быть обработано реагентом $\text{R}^{12}\text{-LG}$, где LG представляет собой уходящую группу, такую как галоген, таким как алкилирующее средство, ацилирующее средство или сульфонилующее средство, в

присутствии основания, такого как гидрид натрия или триэтиламин, в подходящем растворителе, таком как тетрагидрофуран.

Соединения формулы (I-E), которые представляют собой соединения формулы (I), в которых R^7 представляет собой $CONR^{10}R^{11}$, могут быть получены из соединений формулы (I-A), как показано на схеме реакции 9.

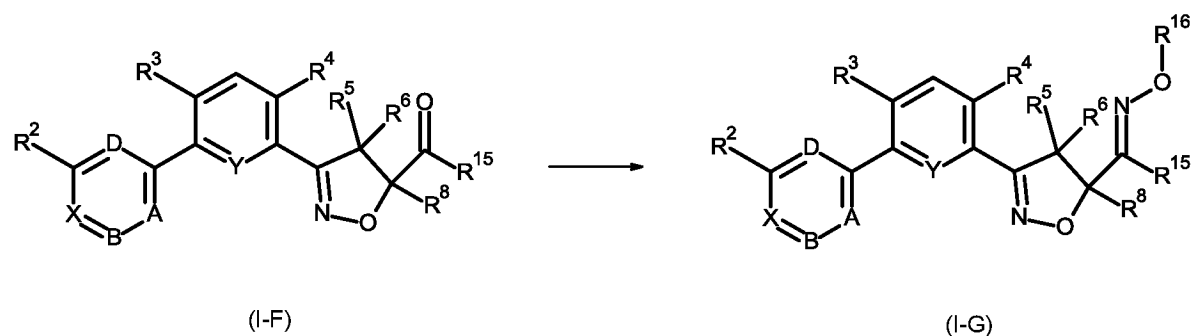
Схема реакции 9



Например, соединение формулы (I-A) может быть обработано реагентом для галогенирования, таким как оксалилхлорид, в подходящем растворителе, таком как дихлорметан, с образованием ацилгалогенида, который может быть обработан реагентом $HNR^{10}R^{11}$ в присутствии основания, такого как триэтиламин, в подходящем растворителе, таком как дихлорметан.

Соединения формулы (I-G), которые представляют собой соединения формулы (I), в которых R^7 представляет собой оксимную группу, могут быть получены из соединений формулы (I-F), которые представляют собой соединения формулы (I), в которых R^7 представляет собой кетонную группу, как показано на схеме реакции 10.

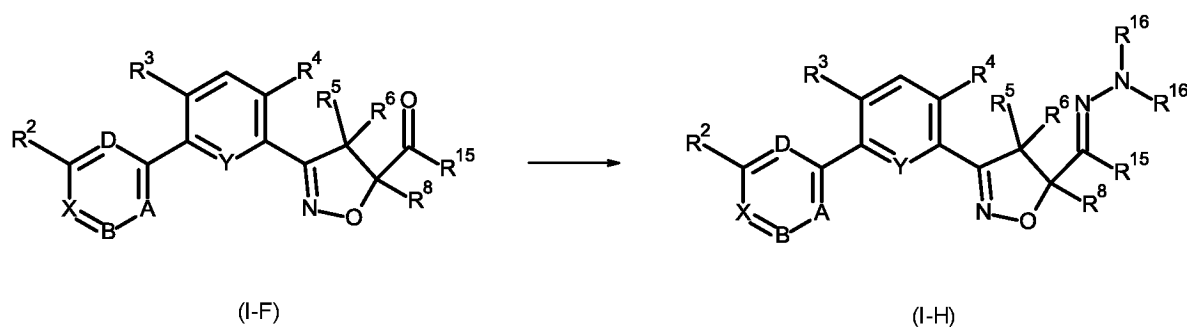
Схема реакции 10



Например, соединение формулы (I-F) может быть обработано гидроксиламином H_2NOR^{16} или его солью, необязательно в присутствии основания, такого как триэтиламин, в подходящем растворителе, таком как этанол.

Соединения формулы (I-H), которые представляют собой соединения формулы (I), в которых R7 представляет собой гидразоновую группу, могут быть получены из соединений формулы (I-F), которые представляют собой соединения формулы (I), в которых R7 представляет собой кетонную группу, как показано на схеме реакции 11.

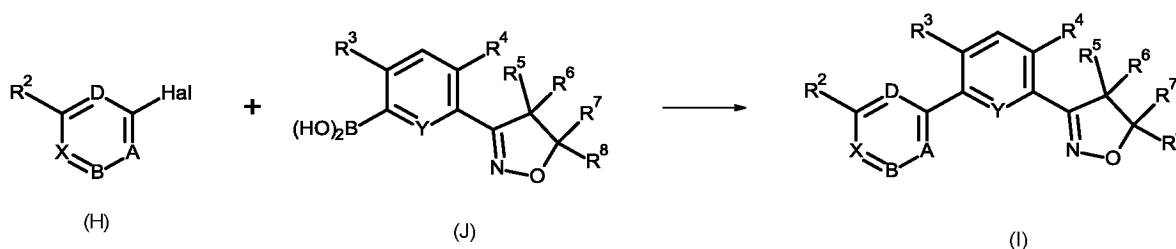
5 Схема реакции 11



Например, соединение формулы (I-F) может быть обработано гидразином $\text{H}_2\text{NN}(\text{R}16)_2$ или его солью, необязательно в присутствии основания, такого как триэтиламин, в подходящем растворителе, таком как этанол.

Соединения формулы (I) могут быть также получены из соединений формулы (H) и соединений формулы (J), как показано на схеме реакции 12.

Схема реакции 12

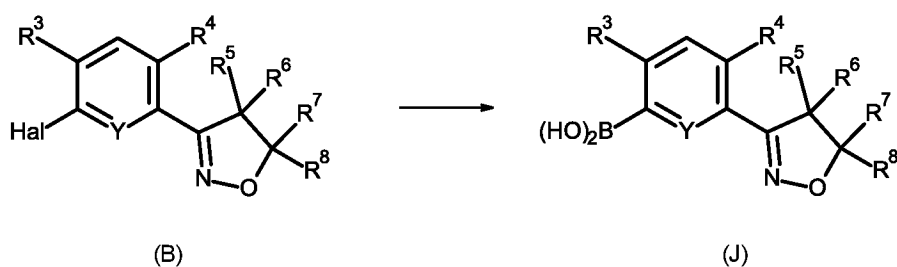


Например, смесь соединения формулы (H), где Hal представляет атом галогена, например атом хлора, брома или йода, и соединения формулы (J) может быть обработана металлическим катализатором, таким как ацетат палладия, необязательно в присутствии подходящего лиганда, такого как фосфиновый лиганд, например S-Phos, или предварительно образованным комплексом металла и лиганда, таким как dppf дихлорид палладия, и основанием, таким как ацетат калия, в подходящем растворителе, таком как диоксан.

Галоген-ароматические соединения формулы (H) доступны или могут быть получены с помощью способов, широко известных в литературе.

Соединения формулы (J) могут быть получены из галоген-ароматических соединений формулы (B), как показано на схеме реакции 13.

Схема реакции 13



5 Например, смесь соединения формулы (B), где Hal представляет атом галогена, например атом хлора, брома или йода, и реагента переноса бора, например тетрагидроксидибора или, для получения соответствующего сложного боронатного эфира, бис(пинаколато)дибора, может быть обработана металлическим катализатором, таким как ацетат палладия, необязательно в присутствии подходящего лиганда, такого как фосфиновый лиганд, например S-Phos, или предварительно образованным комплексом металла и лиганда, таким как dppf дихлорид палладия, и основанием, таким как ацетат калия, в подходящем растворителе, таком как диоксан.

10

Специалисту в данной области будет понятно, что зачастую может изменяться порядок, в котором проводят описанные выше преобразования, или могут объединяться их альтернативные способы для получения широкого диапазона соединений формулы (I). Несколько стадий также могут быть объединены в одну реакцию. Все такие варианты входят в объем настоящего изобретения.

15

Специалисту в данной области также будет понятно, что некоторые реагенты будут несовместимы с определенными значениями или комбинациями заместителей A, B, D, X, Y, Z, R1, R2, R3, R4, R5, R6, R7, R8, R9, R10, R11, R12, R13, R14, R15, R16, R17, R18, R19 и R20, определенных в данном документе, и любые дополнительные стадии, такие как стадии введения защитной группы и/или удаления защитной группы, которые необходимы для достижения желаемого превращения, будут понятны специалисту в данной области.

20

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

25

форме распыляемых порошков, гелей, смачиваемых порошков, диспергируемых в воде гранул, диспергируемых в воде таблеток, шипучих драже, эмульгируемых концентратов, концентратов микроэмульсий, эмульсий типа "масло в воде", масляных текучих составов, водных дисперсий, масляных дисперсий, суспензий, капсульных суспензий, эмульгируемых гранул, растворимых жидкостей, водорастворимых концентратов (с водой или смешиваемым с водой органическим растворителем в качестве носителя), пропитанных полимерных пленок или в других формах, известных, например, из Manual on Development and Use of FAO and WHO Specifications for Pesticides, United Nations, First Edition, Second Revision (2010). Для водорастворимых соединений являются предпочтительными растворимые жидкости, водорастворимые концентраты или растворимые в воде гранулы. Такие составы могут либо применяться непосредственно, либо разбавляться перед применением. Разбавленные растворы могут быть получены, например, с помощью воды, жидких удобрений, питательных микроэлементов, биологических организмов, масла или растворителей.

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

Активные ингредиенты также могут содержаться в очень мелких микрокапсулах. Микрокапсулы содержат активные ингредиенты в пористом носителе. Это обеспечивает возможность высвобождения активных ингредиентов в окружающую среду в регулируемых количествах (например, медленного высвобождения). Микрокапсулы обычно имеют диаметр от 0,1 до 500 микрон. Они содержат активные ингредиенты в количестве от приблизительно 25 до 95% по весу от веса капсулы. Активные ингредиенты могут находиться в форме монолитного твердого вещества, в форме мелких частиц в твердой или жидкой дисперсии или в форме подходящего раствора. Инкапсулирующие мембраны могут содержать, например, природные и синтетические каучуки, целлюлозу, сополимеры стирола и бутадиена, полиакрилонитрил, полиакрилат, сложные полиэфиры, полиамиды, полимочевины,

полиуретан или химически модифицированные полимеры и ксантаты крахмала или другие полимеры, которые известны специалисту в данной области техники. Альтернативно могут быть образованы очень мелкие микрокапсулы, в которых активный ингредиент содержится в форме тонкодисперсных частиц в твердой матрице
5 основного вещества, однако микрокапсулы сами по себе не являются инкапсулированными.

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

Подходящими твердыми носителями являются, например, тальк, диоксид титана, пирофиллитовая глина, диоксид кремния, аттапульгитовая глина, кизельгур, известняк, карбонат кальция, бентонит, кальциевый монтмориллонит, шелуха семян хлопчатника, пшеничная мука, соевая мука, пемза, древесная мука, измельченная скорлупа грецких орехов, лигнин и подобные вещества.

5
10
15
20
25
Большое количество поверхностно-активных веществ может успешно использоваться как в твердых, так и в жидких составах, особенно в тех составах, которые могут быть разбавлены носителем перед применением. Поверхностно-активные вещества могут быть анионными, катионными, неионогенными или полимерными, и они могут применяться в качестве эмульгаторов, смачивающих средств или суспендирующих средств или для других целей. Типичные поверхностно-активные вещества включают, например, соли алкилсульфатов, такие как лаурилсульфат диэтаноламмония; соли алкиларилсульфонатов, такие как додецилбензолсульфонат кальция; продукты присоединения алкилфенола/алкиленоксида, такие как этилоксилат нонилфенола; продукты присоединения спирта/алкиленоксида, такие как этоксилат тридецилового спирта; мыла, такие как стеарат натрия; соли алкилнафталинсульфонатов, такие как дибутилнафталинсульфонат натрия; диалкиловые сложные эфиры сульфосукцинатных солей, такие как ди(2-этилгексил)сульфосукцинат натрия; сложные эфиры сорбита, такие как сорбитолеат; четвертичные амины, такие как хлорид лаурилтриметиламмония, полиэтиленгликолевые сложные эфиры жирных кислот, такие как стеарат полиэтиленгликоля; блок-сополимеры этиленоксида и пропиленоксида и соли моно- и диалкилфосфатных сложных эфиров; а также дополнительные вещества, описанные, например, в McCutcheon's Detergents and Emulsifiers Annual, MC Publishing Corp., Ridgewood New Jersey (1981).

30
Дополнительные вспомогательные вещества, которые могут использоваться в пестицидных составах, включают ингибиторы кристаллизации, модификаторы вязкости, суспендирующие средства, красители, антиоксиданты, вспенивающие средства, поглотители света, вспомогательные средства для смешивания, противовспениватели, комплексообразующие средства, нейтрализующие или рН-модифицирующие вещества и буферы, ингибиторы коррозии, отдушки, смачивающие средства, усилители поглощения, питательные микроэлементы, пластификаторы, вещества, способствующие скольжению, смазывающие вещества, диспергирующие

вещества, загустители, антифризы, микробициды, а также жидкие и твердые удобрения.

Композиции в соответствии с настоящим изобретением могут включать добавку, предусматривающую масло растительного или животного происхождения, минеральное масло, алкиловые сложные эфиры таких масел или смеси таких масел и производных масел. Количество масляной добавки в композиции в соответствии с настоящим изобретением обычно составляет от 0,01 до 10% в пересчете на смесь, подлежащую применению. Например, масляная добавка может быть добавлена в резервуар опрыскивателя в требуемой концентрации после получения смеси для опрыскивания. Предпочтительные масляные добавки включают минеральные масла или масло растительного происхождения, например, рапсовое масло, оливковое масло или подсолнечное масло, эмульгированное растительное масло, алкиловые сложные эфиры масел растительного происхождения, например метиловые производные, или масло животного происхождения, такое как рыбий жир или говяжий жир. Предпочтительные масляные добавки включают алкиловые сложные эфиры C₈-C₂₂-жирных кислот, особенно метильные производные C₁₂-C₁₈-жирных кислот, например, метиловые сложные эфиры лауриновой кислоты, пальмитиновой кислоты и олеиновой кислоты (метиллаурат, метилпальмитат и метилолеат соответственно). Многие производные масел известны из Compendium of Herbicide Adjuvants, 10th Edition, Southern Illinois University, 2010.

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

Нормы применения варьируются в широких пределах и зависят от свойств почвы, способа применения, культурного растения, вредителя, подлежащего контролю, преобладающих климатических условий и других факторов, определяемых способом применения, временем применения и целевой сельскохозяйственной культурой. В

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

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

5 Эмульгируемые концентраты:

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

Пылевидные препараты:

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

Суспензионные концентраты:

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

Смачиваемые порошки:

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

20 Гранулы:

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

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

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

амитрол; I + асулам; I + атразин; I + бенсульфурон (в том числе бенсульфурон-метил); I + бентазон; I + бициклопирон; I + биланафос; I + бифенокс; I + биспирибак-натрий; I + бикслозон; I + бромацил; I + бромоксинил; I + бутахлор; I + бутафенацил; I + кафенстрол; I + карфентразон (в том числе карфентразон-этил); клорансулам (в том числе клорансулам-метил); I + хлоримурон (в том числе хлоримурон-этил); I + хлоротолурон; I + циноссульфурон; I + хлорсульфурон; I + цинметилин; I + клацифос; I + клетодим; I + клодинафоп (в том числе клодинафоп-пропаргил); I + кломазон; I + клопиралид; I + циклопиранил; I + циклопириморат; I + циклосульфамурон; I + цигалофоп (в том числе цигалофоп-бутил); I + 2,4-D (в том числе соль холина и ее 2-этилгексиловый сложный эфир); I + 2,4-DB; I + даимурон; I + десмедифам; I + дикамба (в том числе ее соли с алюминием, аминопропилом, бис-аминопропилметилом, холином, дихлорпропом, дигликольамином, диметиламином, диметиламмонием, калием и натрием); I + диклофоп-метил; I + диклосулам; I + дифлуфеникан; I + дифензокват; I + дифлуфеникан; I + дифлуфензопир; I + диметахлор; I + диметенамид-Р; I + дикват дибромид; I + диурон; I + эспрокарб; I + эталфлуралин; I + этофумезат; I + феноксапроп (в том числе феноксапроп-Р-этил); I + феноксасульфоп; I + фенквинотрион; I + фентразамид; I + флазасульфурон; I + флорасулам; I + флорпирауксифен; I + флуазифоп (в том числе флуазифоп-Р-бутил); I + флукарбазон (в том числе флукарбазон-натрий); I + флуфенацет; I + флуметралин; I + флуметсулам; I + флумиоксазин; I + флупирсульфурон (в том числе флупирсульфурон-метил-натрий); I + флуроксипир (в том числе флуроксипир-метил); I + флутиацет-метил; I + фомесафен; I + форамсульфурон; I + глюфосинат (в том числе его аммониевая соль); I + глифосат (в том числе его диаммониевые, изопропиламмониевые и калиевые соли); I + галауксифен (в том числе галауксифен-метил); I + галосульфурон-метил; I + галоксифоп (в том числе галоксифоп-метил); I + гексазион; I + гидантоцидин; I + имазамокс; I + имазапик; I + имазапир; I + имазаквин; I + имазетапир; I + индазифлам; I + йодосульфурон (в том числе йодосульфурон-метил-натрий); I + иофенсульфурон; I + иофенсульфурон-натрий; I + иоксинил; I + ипфенкарбазон; I + изопротурон; I + изоксабен; I + изоксафлютол; I + лактофен; I + ланкотрион; I + линурон; I + МСРА; I + МСРВ; I + мекопроп-Р; I + мефенацет; I + мезосульфурон; I + мезосульфурон-метил; I + мезотрион; I + метамитрон; I + метазахлор; I + метиозолин; I + метобромурон; I + метолахлор; I + метосулам; I + метоксурон; I + метрибузин; I + метсульфурон; I + молинат; I + напропамид; I + никосульфурон; I + норфлуразон; I + ортосульфамурон; I + оксадиаргил; I + оксадиазон; I + оксасульфурон; I + оксифлуорфен; I + паракват

дихлорид; I + пендиметалин; I + пеноксулам; I + фенмедифам; I + пихлорам; I +
 пиколинафен; I + пиноксаден; I + претилахлор; I + примисульфурон-метил; I +
 продиамин; I + прометрин; I + пропахлор; I + пропанил; I + пропаквизафоп; I + профам;
 5 I + пропирисульфурон, I + пропизамид; I + просульфокарб; I + просульфурон; I +
 пираклонил; I + пирафлуфен (в том числе пирафлуфен-этил); I + пирасульфотол; I +
 пиразолинат, I + пиразосульфурон-этил; I + пирибензоксим; I + пиридат; I +
 пирифталид; I + пиримисульфан, I + пиритиобак-натрий; I + пироксасульфон; I +
 пироксулам ; I + квинклолак; I + квинмерак; I + квизалофоп (в том числе квизалофоп-Р-
 10 этил и квизалофоп-Р-тефурил); I + римсульфурон; I + сафлуфенацил; I + сетоксидим; I
 + симазин; I + S-метолахлор; I + сулькотрион; I + сульфентразон; I + сульфосульфурон;
 I + тебутиурон; I + тефурилтрион; I + темботрион; I + тербутилазин; I + тербутрин; I +
 тиенкарбазон; I + тифенсульфурон; I + тиафенацил; I + толпиралат; I + топрамезон; I +
 тралкоксидим; I + триафамон; I + триаллат; I + триасульфурон; I + трибенурон (в том
 числе трибенурон-метил); I + трихлопир; I + трифлорисульфурон (в том числе
 15 трифлорисульфурон-натрий); I + трифлудимоксазин; I + трифлуралин; I +
 трифлусульфурон; I + тритосульфурон; I + 4-гидрокси-1-метокси-5-метил-3-[4-
 (трифторметил)-2-пиридил]имидазолидин-2-он; I + 4-гидрокси-1,5-диметил-3-[4-
 (трифторметил)-2-пиридил]имидазолидин-2-он; I + 5-этокси-4-гидрокси-1-метил-3-[4-
 (трифторметил)-2-пиридил]имидазолидин-2-он; I + 4-гидрокси-1-метил-3-[4-
 20 (трифторметил)-2-пиридил]имидазолидин-2-он; I + 4-гидрокси-1,5-диметил-3-[1-метил-
 5-(трифторметил)пиразол-3-ил]имидазолидин-2-он; I + (4R)1-(5-трет-бутилизоксазол-3-
 ил)-4-этокси-5-гидрокси-3-метилимидазолидин-2-он; I + 3-[2-(3,4-диметоксифенил)-6-
 метил-3-оксопиридазин-4-карбонил]бицикло[3.2.1]октан-2,4-дион; I + 2-[2-(3,4-
 диметоксифенил)-6-метил-3-оксопиридазин-4-карбонил]-5-метилциклогексан-1,3-дион;
 25 I + 2-[2-(3,4-диметоксифенил)-6-метил-3-оксопиридазин-4-карбонил]циклогексан-1,3-
 дион; I + 2-[2-(3,4-диметоксифенил)-6-метил-3-оксопиридазин-4-карбонил]-5,5-
 диметилциклогексан-1,3-дион; I + 6-[2-(3,4-диметоксифенил)-6-метил-3-
 оксопиридазин-4-карбонил]-2,2,4,4-тетраметилциклогексан-1,3,5-трион; I + 2-[2-(3,4-
 диметоксифенил)-6-метил-3-оксопиридазин-4-карбонил]-5-этилциклогексан-1,3-дион; I
 30 + 2-[2-(3,4-диметоксифенил)-6-метил-3-оксопиридазин-4-карбонил]-4,4,6,6-
 тетраметилциклогексан-1,3-дион; I + 2-[6-циклопропил-2-(3,4-диметоксифенил)-3-
 оксопиридазин-4-карбонил]-5-метилциклогексан-1,3-дион; I + 3-[6-циклопропил-2-(3,4-
 диметоксифенил)-3-оксопиридазин-4-карбонил]бицикло[3.2.1]октан-2,4-дион; I + 2-[6-
 циклопропил-2-(3,4-диметоксифенил)-3-оксопиридазин-4-карбонил]-5,5-

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

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

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

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

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

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

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

30 Антидоты для соединения формулы (I) также могут находиться в форме сложных эфиров или солей, как упоминается, например, в The Pesticide Manual, 14th Edition (BCPC), 2006. Ссылка на клоквинтосет-мексил также относится к его соли с литием, натрием, калием, кальцием, магнием, алюминием, железом, аммонием,

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

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

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

10 Соединения формулы (I) по настоящему изобретению являются пригодными в качестве гербицидов. Следовательно, в настоящем изобретении дополнительно предусмотрен способ контроля нежелательных растений, включающий применение в отношении указанных растений или места произрастания, содержащего их, эффективного количества соединения по настоящему изобретению или гербицидной композиции, содержащей указанное соединение. «Контроль» означает уничтожение, снижение или замедление роста или предупреждение или снижение прорастания. 15 Обычно растениями, подлежащими контролю, являются нежелательные растения (сорняки). «Место произрастания» означает территорию, на которой растения произрастают или будут произрастать.

Следует понимать, что нежелательные растения также включают такие сорняки, которым придали толерантность к гербицидам или классам гербицидов (например, 20 ALS-, GS-, EPSPS-, PPO-, ACCаза- и HPPD-ингибиторы) путем эволюции, традиционных способов селекции или с помощью генетической инженерии. Примеры включают *Amaranthus palmeri*, у которого развилась устойчивость к глифосату и/или ингибирующим ацетолактатсинтазу (ALS) гербицидам.

Соединения по настоящему изобретению могут применяться в способах 25 осуществления контроля нежелательных растений или сорняков, которые являются устойчивыми к ингибиторам протопорфириногенаоксидазы (PPO). Например, популяции *Amaranthus palmeri* и *Amaranthus tuberculatus* эволюционировали как устойчивые к PPO сорняки во многих регионах в мире, например, ввиду аминокислотных замен R128M/G (также называемых R98), или G399A, или делеции кодона (глицина) в положении 210 (Δ 210) в гене PPX2, кодирующем целевой фермент 30 гербицидов-ингибиторов PPO. Соединения по настоящему изобретению могут применяться в способах осуществления контроля *Amaranthus palmeri* и/или *Amaranthus tuberculatus* с любой из вышеуказанных мутаций, и будет очевидным испытать соединения для осуществления контроля нежелательных растений или сорняков с

другими мутациями, придающими толерантность или устойчивость к ингибиторам РРО, которые могут возникать.

Нормы применения соединений формулы (I) могут изменяться в широких пределах и зависят от свойств почвы, способа применения (до появления всходов; 5 после появления всходов; применение по отношению к борозде для семян; применение при беспашотной обработке и т. д.), культурного растения, сорняка(сорняков), подлежащего(подлежащих) контролю, преобладающих климатических условий и других факторов, определяемых способом применения, временем применения и целевой сельскохозяйственной культурой. Соединения формулы (I) в соответствии с 10 настоящим изобретением, как правило, применяют при норме от 10 до 2000 г/га, в частности от 50 до 1000 г/га. Предпочтительный диапазон составляет 10-200 г/га.

Применение обычно осуществляют посредством распыления композиции, как правило, с помощью установленного на тракторе опрыскивателя для больших 15 площадей, но также могут применяться и другие способы, такие как опыление (для порошков), капельный полив или орошение.

Полезные растения, по отношению к которым может применяться композиция в соответствии с настоящим изобретением, включают сельскохозяйственные культуры, такие как зерновые, например, ячмень и пшеница, хлопчатник, масличный рапс, 20 подсолнечник, маис, рис, соя, сахарная свекла, сахарный тростник и дерновой покров.

Культурные растения могут также включать деревья, такие как плодовые 25 деревья, пальмовые деревья, кокосовые пальмы или другие орехоплодные культуры. Также включены вьющиеся растения, такие как виноград, плодовые кустарники, плодовые растения и овощные культуры.

Следует понимать, что сельскохозяйственные культуры также включают такие 25 сельскохозяйственные культуры, которым придали толерантность к гербицидам или классам гербицидов (например, ALS-, GS-, EPSPS-, PPO-, ACCаза- и HPPD-ингибиторы) с помощью традиционных способов селекции или с помощью генетической инженерии. Примером сельскохозяйственной культуры, которой придали толерантность к имидазолинонам, например имазамоксу, с помощью традиционных 30 способов селекции, является сурепица (канола) Clearfield®. Примеры сельскохозяйственных культур, которым придали толерантность к гербицидам с помощью способов генетической инженерии, включают, например, устойчивые к глифосату и глюфосинату сорта маиса, коммерчески доступные под товарными знаками RoundupReady® и LibertyLink®.

Соединения по настоящему изобретению могут применяться в способах осуществления контроля нежелательной растительности в культурных растениях, которая толерантна к ингибиторам протопорфириногенаоксидазы (PPO). Такие растения могут быть получены, например, путем трансформации культурных растений с помощью нуклеиновых кислот, которые кодируют подходящую протопорфириногенаоксидазу, которая может содержать мутацию, чтобы сделать ее более устойчивой к ингибитору PPO. Примеры таких нуклеиновых кислот и культурных растений раскрыты в WO95/34659, WO97/32011, WO2007/024739, WO2012/080975, WO2013/189984, WO2015/022636, WO2015/022640, WO2015/092706, WO2016/099153, WO2017/023778, WO2017/039969, WO2017/217793, WO2017/217794, WO2018/114759, WO2019/117578, WO2019/117579 и WO2019/118726.

Под сельскохозяйственными культурами также следует понимать те, которым с помощью способов генетической инженерии была придана устойчивость к вредным насекомым, например, Bt-маис (устойчивый к мотыльку кукурузному), Bt-хлопчатник (устойчивый к долгоносику хлопковому), а также разновидности Bt-картофеля (устойчивые к колорадскому жуку). Примерами Bt-маиса являются гибриды маиса Bt 176 NK® (Syngenta Seeds). Токсин Bt представляет собой белок, который в природе образуют почвенные бактерии *Bacillus thuringiensis*. Примеры токсинов или трансгенных растений, способных синтезировать такие токсины, описаны в EP-A-451878, EP-A-374753, WO 93/07278, WO 95/34656, WO 03/052073 и EP-A-427529. Примерами трансгенных растений, содержащих один или несколько генов, кодирующих устойчивость к насекомым, и экспрессирующих один или несколько токсинов, являются KnockOut® (маис), Yield Gard® (маис), NuCOTIN33B® (хлопчатник), Bollgard® (хлопчатник), NewLeaf® (разновидности картофеля), NatureGard® и Protexcta®. Растительные культуры или их семенной материал могут быть устойчивыми к гербицидам и в то же время устойчивыми к поеданию насекомыми (трансгенные объекты с "пакетированными" генами). Например, семя может обладать способностью экспрессировать инсектицидный белок Cгу3, в то же время будучи выносливым к глифосату.

Также следует понимать, что сельскохозяйственные культуры включают те, которые получены традиционными способами селекции или генетической инженерии и обладают так называемыми привнесенными признаками (например, улучшенной

стабильностью при хранении, более высокой питательной ценностью и улучшенным вкусом).

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

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

Соединения формулы (I) также пригодны для предуборочной десикации сельскохозяйственных культур, например, без ограничения картофеля, сои, сортов подсолнечника и хлопчатника. Предуборочную десикацию применяют для 20 высушивания листьев сельскохозяйственных культур без значительного повреждения самой сельскохозяйственной культуры для способствования сбору урожая.

Соединения/композиции по настоящему изобретению особенно пригодны в неселективных контактных вариантах применения со "сплошным действием" и, как таковые, также могут применяться для контроля самосева или культурных "растений-беглецов". 25

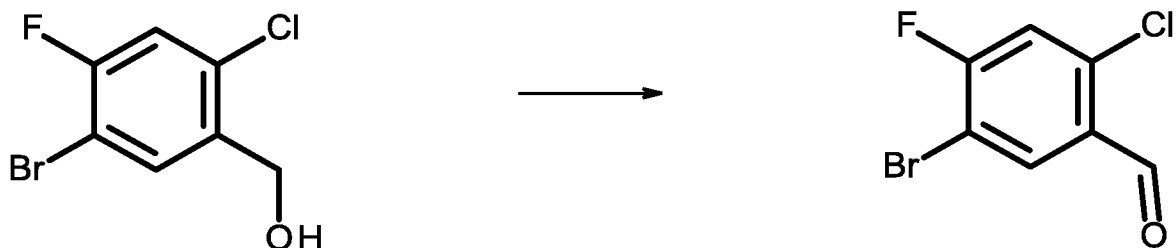
Различные аспекты и варианты осуществления настоящего изобретения далее будут более подробно проиллюстрированы с помощью примера. Следует понимать, что может быть осуществлена модификация некоторых подробностей без отступления от объема настоящего изобретения.

30 ПРИМЕРЫ

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

ПРИМЕРЫ СИНТЕЗА**Пример 1. Получение этил-3-[2-хлор-4-фтор-5-(2-фтор-3-пиридил)фенил]-5-метил-4Н-изоксазол-5-карбоксилата (соединение 1-211)****Стадия 1. Синтез 5-бром-2-хлор-4-фторбензальдегида**

5

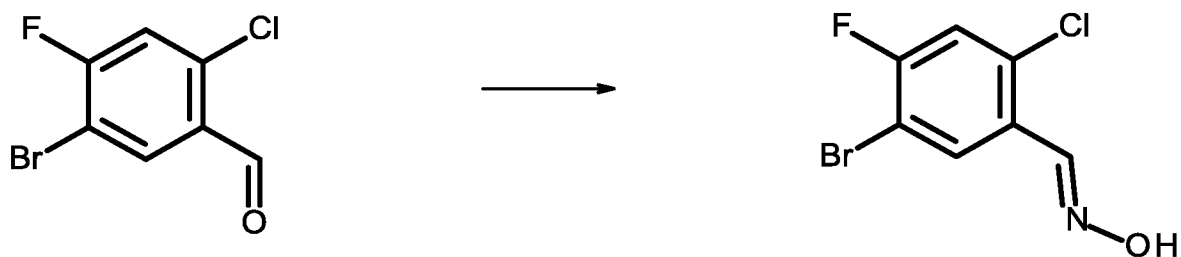


10

Дихромат пиридиния (1,7 г, 10 ммоль) добавляли к перемешиваемому раствору (5-бром-2-хлор-4-фторфенил)метанола (полученного как описано в примере 2, стадия 1; 1,2 г, 5,0 ммоль) в дихлорметане (60 мл). Полученную смесь перемешивали при комнатной температуре в течение 15 часов, затем фильтровали и выпаривали при пониженном давлении с получением остатка, который очищали с помощью хроматографии с получением 5-бром-2-хлор-4-фторбензальдегида в виде белого твердого вещества (1,2 г).

^1H ЯМР (400 МГц, CDCl_3) δ 10,3 (s, 1H), 8,15 (d, 1H), 7,3 (d, 1H) ppm.

15

Стадия 2. Синтез оксима 5-бром-2-хлор-4-фторбензальдегида

20

Гидрохлорид гидросиламина (1,27 г, 18,4 ммоль) добавляли к перемешиваемому раствору 5-бром-2-хлор-4-фторбензальдегида (3 г, 12,3 ммоль) в тетрагидрофуране (15 мл) при комнатной температуре. Добавляли воду (3 мл) и полученный раствор перемешивали при комнатной температуре в течение 60 мин. Добавляли воду (50 мл) и полученную смесь экстрагировали этилацетатом.

25

Объединенные органические фазы высушивали и выпаривали при пониженном

давлении с получением оксима 5-бром-2-хлор-4-фторбензальдегида в виде бледно-белого твердого вещества (2,5 г).

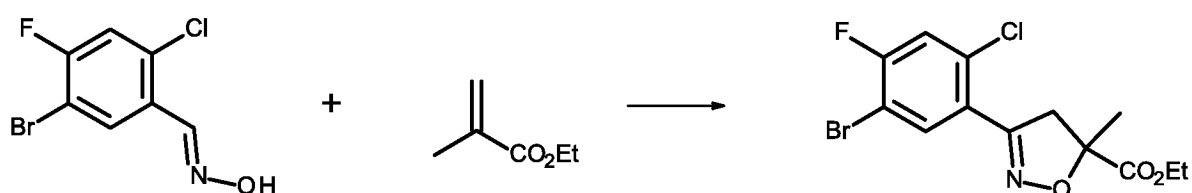
С помощью данного общего способа также был получен:

оксим 5-бром-2-цианобензальдегида

5 ^1H ЯМР (400 МГц, CDCl_3) δ 8,4 (s,1H), 8,1 (d,1H), 7,85 (s,1H), 7,6 (dd,1H), 7,55 (d,1H) ppm.

Стадия 3. Синтез этил-3-(5-бром-2-хлор-4-фторфенил)-5-метил-4Н-изоксазол-5-карбоксилата

10



15

1-Хлорпирролидин-2,5-дион (1,6 г, 12 ммоль) добавляли порциями к перемешиваемому раствору оксима 5-бром-2-хлор-4-фторбензальдегида (2,5 г, 9,9 ммоль) в *N,N*-диметилформамиде (18 мл) при 30°C. Полученную смесь перемешивали при 30°C в течение 1 часа, затем охлаждали до комнатной температуры и добавляли воду (20 мл) и дихлорметан (50 мл). Фазы разделяли и органическую фазу высушивали и охлаждали до 5°C. К этому перемешиваемому раствору добавляли по каплям смесь триэтиламина (1,3 мл, 9,4 ммоль) и этил-2-метилпроп-2-еноата (1,4 мл, 10 ммоль). После отстаивания при комнатной температуре в течение 1 часа добавляли разбавленную хлористоводородную кислоту (5 мл) и воду (20 мл), фазы разделяли и органическую фазу высушивали и очищали с помощью хроматографии с получением этил-3-(5-бром-2-хлор-4-фторфенил)-5-метил-4Н-изоксазол-5-карбоксилата в виде желтого масла (2,6 г).

20

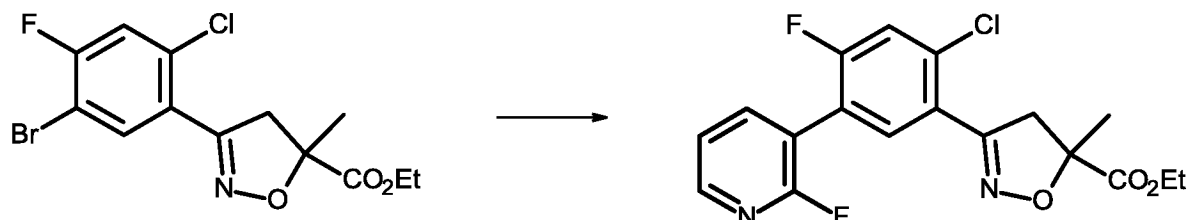
25 ^1H ЯМР (400 МГц, CDCl_3) δ 7,9 (d,1H), 7,2 (d,1H), 4,3 (q,2H), 3,95 (d,1H), 3,35 (d,1H), 1,7 (s,3H), 1,35 (t,3H) ppm.

С помощью данного общего способа также был получен:

этил-3-(5-бром-2-цианофенил)-5-метил-4Н-изоксазол-5-карбоксилат

30 ^1H ЯМР (400 МГц, CDCl_3) δ 8,05 (d,1H), 7,65 (dd,1H), 7,6 (d,1H), 4,3 (q,2H), 4,05 (d,1H), 3,45 (d,1H), 1,75 (s,3H), 1,35 (t,3H) ppm.

Стадия 4. Синтез этил-3-[2-хлор-4-фтор-5-(2-фтор-3-пиридил)фенил]-5-метил-4Н-изоксазол-5-карбоксилата (соединение 1-211)



5

Ацетат калия (78 мг, 0,78 ммоль) и [1,1'-бис(дифенилфосфино)ферроцен]дихлорпалладий (19 мг, 0,03 ммоль) добавляли в раствор этил-3-(5-бром-2-хлор-4-фторфенил)-5-метил-4Н-изоксазол-5-карбоксилата (95 мг, 0,26 ммоль) и (2-фтор-3-пиридил)бороновой кислоты (57 мг, 0,39 ммоль) в диоксане (3,8 мл). Смесь нагревали при 100°C в течение 45 минут в микроволновой печи, обеспечивали охлаждение, добавляли этилацетат (10 мл) и смесь фильтровали и выпаривали при пониженном давлении. Полученное масло очищали с помощью хроматографии с получением этил-3-[2-хлор-4-фтор-5-(2-фтор-3-пиридил)фенил]-5-метил-4Н-изоксазол-5-карбоксилата (соединение 1-211) в виде золотистой смолы (80 мг).

15

^1H ЯМР (400 МГц, CD_3OD) δ 8,3 (d,1H), 8,05 (dt,1H), 7,75 (d,1H), 7,55 (d,1H), 7,45 (m,1H), 4,3 (q,2H), 4,1 (d,1H), 3,45 (d,1H), 1,7 (s,3H), 1,3 (t,3H) ppm.

С помощью данного общего способа также были получены:

20

этил-3-[2-хлор-5-[2-хлор-4-(трифторметил)фенил]-4-фторфенил]-5-метил-4Н-изоксазол-5-карбоксилат (соединение 1-7)

^1H ЯМР (400 МГц, CDCl_3) δ 7,75 - 7,55 (m,4H), 7,3 (d,1H), 4,3 (q,2H), 4,0 (d,1H), 3,45 (d,1H), 1,7 (s,3H), 1,3 (t,3H) ppm.

Этил-3-[2-хлор-5-(2-хлорфенил)-4-фторфенил]-5-метил-4Н-изоксазол-5-карбоксилат (соединение 1-19)

^1H ЯМР (400 МГц, CDCl_3) δ 7,65 (d,1H), 7,5 (d,1H), 7,45 - 7,3 (m,4H), 4,3 (q,2H), 4,0 (d,1H), 3,4 (d,1H), 1,7 (s,3H), 1,3 (t,3H) ppm.

Этил-3-[2-хлор-5-(5-хлор-3-пиридил)-4-фторфенил]-5-метил-4Н-изоксазол-5-карбоксилат (соединение 1-271)

30

^1H ЯМР (400 МГц, CDCl_3) δ 8,75 – 8,6 (m, 2H), 7,9 (m, 1H), 7,85 (d, 1H), 7,35 (d, 1H), 4,3 (q, 2H), 4,0 (d, 1H), 3,45 (d, 1H), 1,7 (s, 3H), 1,3 (t, 3H) ppm.

Этил-3-[2-хлор-4-фтор-5-(4-метокси-3-пиридил)фенил]-5-метил-4Н-изоксазол-5-карбоксилат (соединение 1-259)

5 ^1H ЯМР (400 МГц, CDCl_3) δ 8,9 (br s, 1H), 8,7 (br s, 1H), 7,7 (m, 1H), 7,35 (br d, 2H), 4,3 (q, 2H), 4,15 (s, 3H), 4,1 (d, 1H), 3,45 (d, 1H), 1,7 (s, 3H), 1,3 (t, 3H) ppm.

Этил-3-[2-хлор-5-(2-хлор-4-метилфенил)-4-фторфенил]-5-метил-4Н-изоксазол-5-карбоксилат (соединение 1-31)

10 ^1H ЯМР (400 МГц, CDCl_3) δ 7,65 (d, 1H), 7,3 (s, 1H), 7,25 (d, 1H), 7,15 (m, 2H), 4,3 (q, 2H), 4,1 (d, 1H), 3,45 (d, 1H), 2,4 (s, 3H), 1,7 (s, 3H), 1,3 (t, 3H) ppm.

Этил-3-[2-хлор-4-фтор-5-[2-фтор-5-(трифторметил)-3-пиридил]фенил]-5-метил-4Н-изоксазол-5-карбоксилат (соединение 1-235)

^1H ЯМР (400 МГц, CDCl_3) δ 8,7 (s, 1H), 8,45 (d, 1H), 7,8 (d, 1H), 7,6 (d, 1H), 4,3 (q, 2H), 4,1 (d, 1H), 3,45 (d, 1H), 1,7 (s, 3H), 1,3 (t, 3H) ppm.

15 Этил-3-[2-хлор-4-фтор-5-(2-фтор-5-метил-3-пиридил)фенил]-5-метил-4Н-изоксазол-5-карбоксилат (соединение 1-223)

^1H ЯМР (400 МГц, CDCl_3) δ 8,15 (s, 1H), 7,85 (d, 1H), 7,7 (d, 1H), 7,5 (d, 1H), 4,3 (q, 2H), 4,1 (d, 1H), 3,45 (d, 1H), 2,3 (s, 3H), 1,7 (s, 3H), 1,3 (t, 3H) ppm.

20 Этил-3-[2-хлор-4-фтор-5-(6-метил-3-пиридил)фенил]-5-метил-4Н-изоксазол-5-карбоксилат (соединение 1-283)

^1H ЯМР (400 МГц, CDCl_3) δ 9,0 (d, 1H), 8,25 (d, 1H), 7,8 (d, 1H), 7,6 (d, 1H), 7,4 (d, 1H), 4,3 (q, 2H), 4,1 (d, 1H), 3,45 (d, 1H), 2,85 (s, 3H), 1,7 (s, 3H), 1,3 (t, 3H) ppm.

Этил-3-[2-хлор-4-фтор-5-(3-пиридил)фенил]-5-метил-4Н-изоксазол-5-карбоксилат (соединение 1-247)

25 ^1H ЯМР (400 МГц, CDCl_3) δ 8,8 (br s, 1H), 8,65 (dd, 1H), 7,9 (dq, 1H), 7,8 (d, 1H), 7,45 (dd, 1H), 7,3 (d, 1H), 4,3 (q, 2H), 4,0 (d, 1H), 3,45 (d, 1H), 1,7 (s, 3H), 1,3 (t, 3H) ppm.

Этил-3-[2-хлор-5-[6-хлор-4-(трифторметил)-2-пиридил]-4-фторфенил]-5-метил-4Н-изоксазол-5-карбоксилат (соединение 1-67)

30 ^1H ЯМР (400 МГц, CDCl_3) δ 8,4 (d, 1H), 7,95 (s, 1H), 7,6 (s, 1H), 7,35 (d, 1H), 4,3 (q, 2H), 4,0 (d, 1H), 3,4 (d, 1H), 1,75 (s, 3H), 1,35 (t, 3H) ppm.

Этил-3-[2-хлор-4-фтор-5-(2-фтор-4-пиридил)фенил]-5-метил-4Н-изоксазол-5-карбоксилат (соединение 1-295)

^1H ЯМР (400 МГц, CDCl_3) δ 8,55 (br s,1H), 7,9 (d,1H), 7,8 (m,1H), 7,4 (d,1H), 6,5 (br s,1H), 4,3 (q,2H), 4,1 (d,1H), 3,45 (d,1H), 1,7 (s,3H), 1,3 (t,3H) ppm.

Этил-3-[2-хлор-4-фтор-5-[6-(трифторметил)-2-пиридил]фенил]-5-метил-4Н-изоксазол-5-карбоксилат (соединение 1-43)

5 ^1H ЯМР (400 МГц, CDCl_3) δ 8,35 (d,1H), 7,95 (d,2H), 7,7 (m,1H), 7,35 (d,1H), 4,3 (q,2H), 4,1 (d,1H), 3,45 (d,1H), 1,7 (s,3H), 1,3 (t,3H) ppm.

Этил-3-[2-хлор-4-фтор-5-(2-пиридил)фенил]-5-метил-4Н-изоксазол-5-карбоксилат (соединение 1-139)

10 ^1H ЯМР (400 МГц, CDCl_3) δ 8,8 (d,1H), 8,3 (d,1H), 7,8 (d,2H), 7,4 (m,1H), 7,35 (br d,1H), 4,3 (q,2H), 4,1 (d,1H), 3,45 (d,1H), 1,7 (s,3H), 1,3 (t,3H) ppm.

Этил-3-[2-хлор-5-(5-хлор-2-фтор-3-пиридил)-4-фторфенил]-5-метил-4Н-изоксазол-5-карбоксилат (соединение 1-199)

^1H ЯМР (400 МГц, CDCl_3) δ 8,25 (s,1H), 7,85 (m,1H), 7,75 (d,1H), 7,35 (d,1H), 4,3 (q,2H), 4,1 (d,1H), 3,45 (d,1H), 1,7 (s,3H), 1,3 (t,3H) ppm.

15 Этил-3-[2-хлор-4-фтор-5-[5-(трифторметил)-2-пиридил]фенил]-5-метил-4Н-изоксазол-5-карбоксилат (соединение 1-79)

^1H ЯМР (400 МГц, CDCl_3) δ 9,0 (s,1H), 8,35 (d,1H), 8,05 (d,1H), 7,9 (d,1H), 7,35 (d,1H), 4,3 (q,2H), 4,1 (d,1H), 3,45 (d,1H), 1,7 (s,3H), 1,3 (t,3H) ppm.

20 Этил-3-[2-хлор-5-(5-хлор-6-фтор-3-пиридил)-4-фторфенил]-5-метил-4Н-изоксазол-5-карбоксилат (соединение 1-403)

^1H ЯМР (400 МГц, CDCl_3) δ 8,4 (s,1H), 7,85 (d,1H), 7,7 (m,1H), 7,35 (d,1H), 4,3 (q,2H), 4,0 (d,1H), 3,45 (d,1H), 1,7 (s,3H), 1,3 (t,3H) ppm.

Этил-3-[2-хлор-5-(5,6-дифтор-3-пиридил)-4-фторфенил]-5-метил-4Н-изоксазол-5-карбоксилат (соединение 1-391)

25 ^1H ЯМР (400 МГц, CDCl_3) δ 8,2 (s,1H), 7,8 (d,1H), 7,55 (dt,1H), 7,45(d,1H), 4,3 (q,2H), 4,05 (d,1H), 3,45 (d,1H), 1,7 (s,3H), 1,3 (t,3H) ppm.

Этил-3-[2-хлор-5-(2,2-дифтор-[1,3]диоксоло[4,5-b]пиридин-6-ил)-4-фторфенил]-5-метил-4Н-изоксазол-5-карбоксилат (соединение 1-451)

30 ^1H ЯМР (500 МГц, CDCl_3) δ 8,15 (s,1H), 7,8 (d,1H), 7,5 (s,1H), 7,45 (d,1H), 4,3 (q,2H), 4,05 (d,1H), 3,45 (d,1H), 1,7 (s,3H), 1,3 (t,3H) ppm.

Этил-3-[2-хлор-4-фтор-5-(3-хинолил)-фенил]-5-метил-4Н-изоксазол-5-карбоксилат (соединение 1-439)

^1H ЯМР (500 МГц, CDCl_3) δ 9,1 (s, 1H), 8,35 (s, 1H), 8,2 (d, 1H), 7,90 (d, 1H), 7,9 (d, 1H), 7,75 (m, 1H), 7,65 (d, 1H), 7,35 (d, 1H), 4,3 (q, 2H), 4,05 (d, 1H), 3,45 (d, 1H), 1,7 (s, 3H), 1,3 (t, 3H) ppm.

5 Этил-3-[2-хлор-4-фтор-5-(5-метокси-3-пиридил)-фенил]-5-метил-4Н-изоксазол-5-карбоксилат (соединение 1-379)

^1H ЯМР (500 МГц, CDCl_3) δ 8,4 (m, 2H), 7,80 (d, 1H), 7,3 (m, 2H), 4,3 (q, 2H), 4,05 (d, 1H), 3,9 (s, 3H), 3,45 (d, 1H), 1,7 (s, 3H), 1,3 (t, 3H) ppm.

10 Этил-3-[2-хлор-5-(2-хлор-5-метокси-4-пиридил)-4-фторфенил]-5-метил-4Н-изоксазол-5-карбоксилат (соединение 1-511)

^1H ЯМР (400 МГц, CDCl_3) δ 8,15 (s, 1H), 7,7 (d, 1H), 7,45 (m, 2H), 4,3 (q, 2H), 4,05 (d, 1H), 3,95 (s, 3H), 3,45 (d, 1H), 1,7 (s, 3H), 1,3 (t, 3H) ppm.

15 Этил-3-[2-хлор-5-(2-хлор-6-метокси-4-пиридил)-4-фторфенил]-5-метил-4Н-изоксазол-5-карбоксилат (соединение 1-523)

^1H ЯМР (400 МГц, CDCl_3) δ 7,8 (d, 1H), 7,35 (d, 1H) 7,15 (s, 1H), 6,8 (s, 1H), 4,3 (q, 2H), 4,05 (d, 1H), 4,0 (s, 3H), 3,45 (d, 1H), 1,7 (s, 3H), 1,3 (t, 3H) ppm.

Этил-3-[2-хлор-4-фтор-5-(2-фтор-6-метил-3-пиридил)-фенил]-5-метил-4Н-изоксазол-5-карбоксилат (соединение 1-463)

^1H ЯМР (400 МГц, CDCl_3) δ 7,75 (d, 1H), 7,7 (m, 1H), 7,35 (d, 1H) 7,15 (d, 1H), 4,3 (q, 2H), 4,0 (d, 1H), 3,4 (d, 1H), 2,6 (s, 3H), 1,7 (s, 3H), 1,3 (t, 3H) ppm.

20 Этил-3-[2-хлор-4-фтор-5-(6-фтор-5-метокси-3-пиридил)-фенил]-5-метил-4Н-изоксазол-5-карбоксилат (соединение 1-415)

^1H ЯМР (400 МГц, CDCl_3) δ 7,95 (t, 1H), 7,8 (d, 1H), 7,45 (d, 1H), 7,35 (d, 1H) 4,3 (q, 2H), 4,05 (d, 1H), 3,95 (s, 3H), 3,45 (d, 1H), 1,7 (s, 3H), 1,3 (t, 3H) ppm.

25 Этил-3-[2-хлор-4-фтор-5-[2-(трифторметил)-4-пиридил]-фенил]-5-метил-4Н-изоксазол-5-карбоксилат (соединение 1-499)

^1H ЯМР (400 МГц, CDCl_3) δ 8,5 (d, 1H), 7,9 (m, 2H), 7,7 (d, 1H) 7,4 (d, 1H), 4,3 (q, 2H), 4,1 (d, 1H), 3,45 (d, 1H), 1,7 (s, 3H), 1,3 (t, 3H) ppm.

Этил-3-[2-хлор-4-фтор-5-(4-пиридил)-фенил]-5-метил-4Н-изоксазол-5-карбоксилат (соединение 1-487)

30 ^1H ЯМР (400 МГц, CDCl_3) δ 8,7 (d, 2H), 7,85 (d, 1H), 7,45 (m, 2H), 4,3 (q, 2H), 4,0 (d, 1H), 3,45 (d, 1H), 1,75 (s, 3H), 1,35 (t, 3H) ppm.

Этил-3-[2-хлор-4-фтор-5-(6-фтор-4-метил-2-пиридил)-фенил]-5-метил-4Н-изоксазол-5-карбоксилат (соединение 1-367)

^1H ЯМР (400 МГц, CDCl_3) δ 8,3 (d,1H), 7,55 (s,1H), 7,3 (d,1H), 6,75 (s,1H), 4,3 (q,2H), 4,0 (d,1H), 3,45 (d,1H), 2,5 (s,3H), 1,7 (s,3H), 1,3 (t,3H) ppm.

Этил-3-[2-хлор-5-(5,6-дихлор-3-пиридил)-4-фторфенил]-5-метил-4Н-изоксазол-5-карбоксилат (соединение 1-427)

5 ^1H ЯМР (400 МГц, CDCl_3) δ 8,5 (d,1H), 8,0 (d,1H), 7,8 (d,1H), 7,35 (d,1H), 4,3 (q,2H), 4,1 (d,1H), 3,45 (d,1H), 1,7 (s,3H), 1,3 (t,3H) ppm.

20-67045 Этил-3-[2-хлор-5-(2,3-дихлор-4-пиридил)-4-фторфенил]-5-метил-4Н-изоксазол-5-карбоксилат (соединение 1-535)

10 ^1H ЯМР (400 МГц, CDCl_3) δ 8,25 (s,1H), 7,85 (m,1H), 7,75 (d,1H), 7,35 (d,1H), 4,3 (q,2H), 4,1 (d,1H), 3,45 (d,1H), 1,7 (s,3H), 1,3 (t,3H) ppm.

Этил-3-[2-циано-5-(2,2-дифтор-[1,3]диоксо[4,5-b]пиридин-6-ил)фенил]-5-метил-4Н-изоксазол-5-карбоксилат (соединение 2-451)

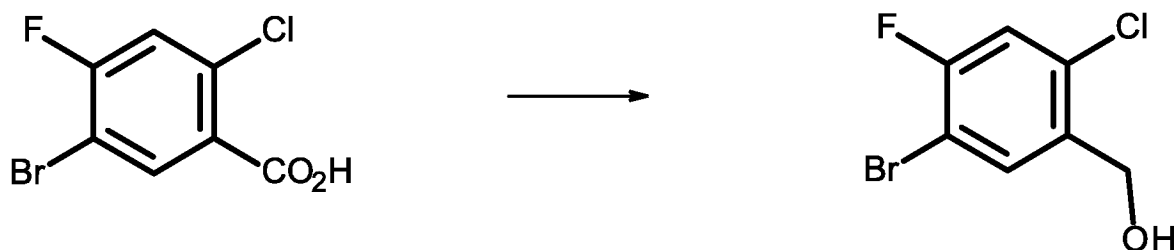
^1H ЯМР (400 МГц, CDCl_3) δ 8,2 (d,1H), 8,05 (d,1H), 7,85 (d,1H), 7,7 (dd,1H), 7,6 (d,1H), 4,3 (q,2H), 4,05 (d,1H), 3,55 (d,1H), 1,8 (s,3H), 1,35 (t,3H) ppm.

15

Пример 2. Получение этил-3-[2-хлор-5-(3-хлор-5-трифторметил-2-пиридил)-4-фторфенил]-5-метил-4Н-изоксазол-5-карбоксилата (соединение 1-103)

Стадия 1. Синтез (5-бром-2-хлор-4-фторфенил)метанола

20

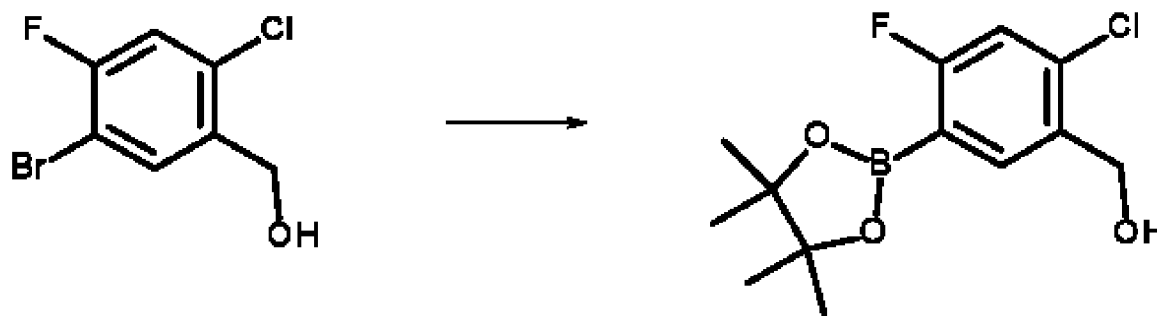


25 Комплекс борана и диметилсульфида (3 мл, 33 ммоль) добавляли по каплям в течение 10 минут к перемешиваемому раствору 5-бром-2-хлор-4-фторбензойной кислоты (10 г, 28 ммоль) в тетрагидрофуране (300 мл) при 0°C. Обеспечивали нагревание полученной смеси до комнатной температуры в течение 30 минут, затем нагревали при 70°C в течение 3 часов. Смесь охлаждали до 0°C и медленно добавляли метанол до прекращения образования пузырьков газа. Смесь экстрагировали этилацетатом и органическую фазу промывали водным раствором гидроксидом натрия

(2 M, 10 мл), высушивали и выпаривали при пониженном давлении с получением (5-бром-2-хлор-4-фторфенил)метанола в виде твердого вещества (7,0 г).

^1H ЯМР (400 МГц, CDCl_3) δ 7,7 (d,1H), 7,15 (d,1H), 4,75 (s,2H) ppm (ОН не наблюдали).

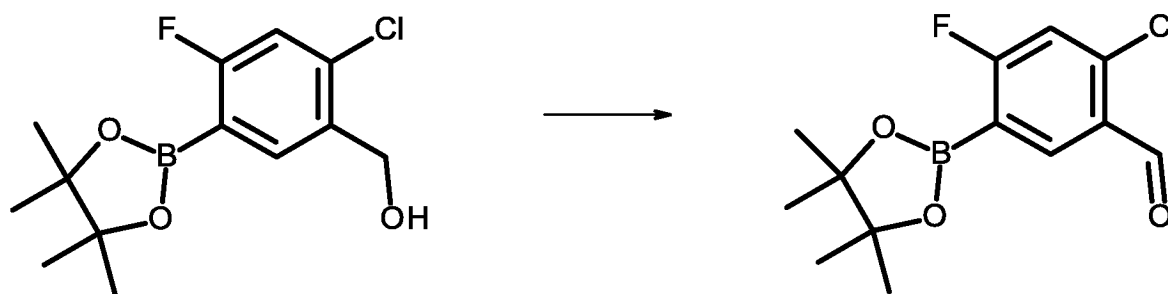
5 Стадия 2. Синтез [2-хлор-4-фтор-5-(4,4,5,5-тетраметил-1,3,2-диоксаборолан-2-ил)фенил]метанола



Ацетат калия (1,8 г, 18 ммоль) и [1,1'-бис(дифенилфосфино)ферроцен]дихлорпалладий (0,45 г, 0,61 ммоль) добавляли в раствор (5-бром-2-хлор-4-фторфенил)метанола (1,5 г, 6,1 ммоль) и бис(пинаколато)дибора (2,4 мл, 9,1 ммоль) в диоксане (30 мл). Смесь нагревали при 85°C в течение 3 часов, затем нагревали с применением обратного холодильника в течение 17 часов, обеспечивали охлаждение, добавляли этилацетат (100 мл) и смесь фильтровали и выпаривали при пониженном давлении. Полученное масло очищали с помощью хроматографии с получением [2-хлор-4-фтор-5-(4,4,5,5-тетраметил-1,3,2-диоксаборолан-2-ил)фенил]метанола в виде белого твердого вещества (1,35 г).

^1H ЯМР (400 МГц, CDCl_3) δ 7,85 (d,1H), 7,1 (d,1H), 4,75 (s,2H), 1,35 (s,12H) ppm.

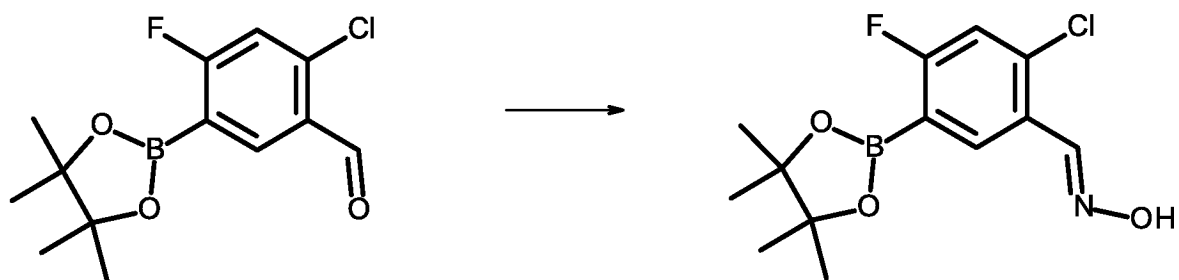
20 Стадия 3. Синтез 2-хлор-4-фтор-5-(4,4,5,5-тетраметил-1,3,2-диоксаборолан-2-ил)бензальдегида



Дихромат пиридиния (0,83 г, 5,0 ммоль) добавляли к перемешиваемому раствору [2-хлор-4-фтор-5-(4,4,5,5-тетраметил-1,3,2-диоксаборолан-2-ил)фенил]метанола (750 мг, 2,5 ммоль) в дихлорметане (37,5 мл). Полученную смесь перемешивали при комнатной температуре в течение 15 часов, затем фильтровали и выпаривали при пониженном давлении с получением остатка, который очищали с помощью хроматографии с получением 2-хлор-4-фтор-5-(4,4,5,5-тетраметил-1,3,2-диоксаборолан-2-ил)бензальдегида в виде масла (340 мг).

^1H ЯМР (400 МГц, CDCl_3) δ 10,7 (s, 1H), 8,4 (d, 1H), 7,2 (d, 1H), 1,35 (s, 12H) ppm.

10 Стадия 4 Синтез оксима 2-хлор-4-фтор-5-(4,4,5,5-тетраметил-1,3,2-диоксаборолан-2-ил)бензальдегида



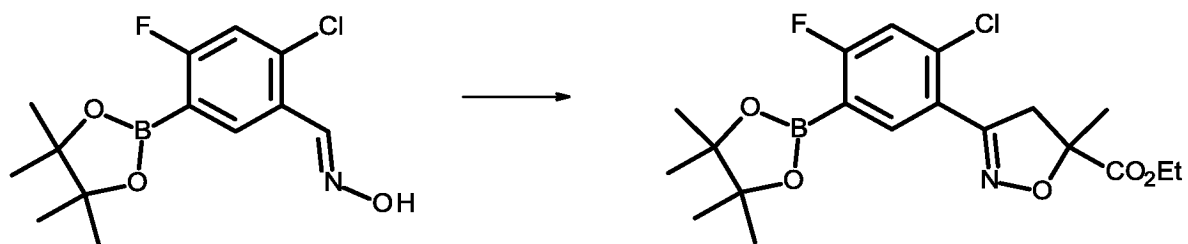
15 Гидрохлорид гидроксилamina (0,15 г, 2,1 ммоль) добавляли к перемешиваемому раствору 2-хлор-4-фтор-5-(4,4,5,5-тетраметил-1,3,2-диоксаборолан-2-ил)бензальдегида (0,4 г, 1,4 ммоль) в тетрагидрофуране (6 мл) при комнатной температуре. Добавляли воду (0,8 мл) и полученный раствор перемешивали при комнатной температуре в течение 60 минут. Добавляли воду и полученную смесь экстрагировали этилацетатом.

20 Объединенные органические фазы высушивали и выпаривали при пониженном давлении с получением остатка, который очищали с помощью хроматографии с получением оксима 2-хлор-4-фтор-5-(4,4,5,5-тетраметил-1,3,2-диоксаборолан-2-ил)бензальдегида в виде масла (2,5 г).

^1H ЯМР (400 МГц, CDCl_3) δ 8,5 (s, 1H), 8,25 (d, 1H), 7,7 (br s, 1H), 7,15 (d, 1H), 1,35 (s, 12H) ppm.

25

Стадия 5. Синтез этил-3-[2-хлор-4-фтор-5-(4,4,5,5-тетраметил-1,3,2-диоксаборолан-2-ил)фенил]-5-метил-4Н-изоксазол-5-карбоксилата



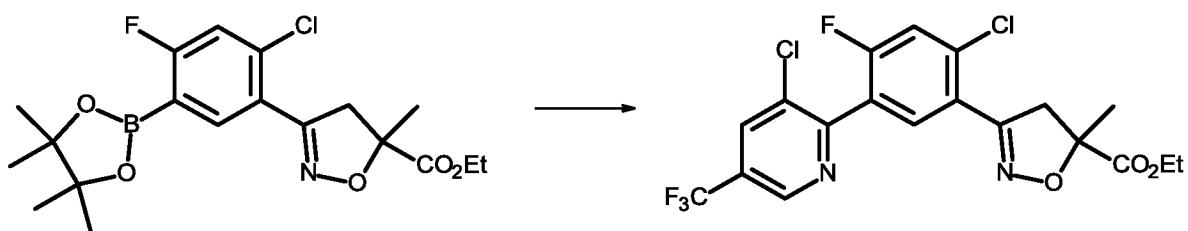
5

1-Хлорпирролидин-2,5-дион (93 мг, 0,68 ммоль) добавляли порциями к перемешиваемому раствору оксима 2-хлор-4-фтор-5-(4,4,5,5-тетраметил-1,3,2-диоксаборолан-2-ил)бензальдегида (0,17 г, 0,57 ммоль) в *N,N*-диметилформамиде (0,85 мл) при 35^oС. Полученную смесь перемешивали при 30^oС в течение 1 часа, затем охлаждали до комнатной температуры и добавляли воду (20 мл). Добавляли дихлорметан (50 мл), фазы разделяли и органическую фазу высушивали и охлаждали до 5^oС. К этому перемешанному раствору добавляли по каплям смесь триэтиламина (0,07 мл, 0,51 ммоль) и этил-2-метилпроп-2-еноата (0,07 мл, 0,56 ммоль). После перемешивания при комнатной температуре в течение 1 часа добавляли разбавленную хлористоводородную кислоту (5 мл), фазы разделяли и органическую фазу высушивали и очищали с помощью хроматографии с получением этил-3-[2-хлор-4-фтор-5-(4,4,5,5-тетраметил-1,3,2-диоксаборолан-2-ил)фенил]-5-метил-4Н-изоксазол-5-карбоксилата в виде масла (29 мг).

¹Н ЯМР (400 МГц, CDCl₃) δ 8,0 (d,1H), 7,25 (d,1H), 4,3 (q,2H), 3,95 (d,1H), 3,35 (d,1H), 1,75 (s,3H), 1,35 (m,15H) ppm.

20

Стадия 6. Синтез этил-3-[2-хлор-5-(3-хлор-5-трифторметил-2-пиридил)-4-фторфенил]-5-метил-4Н-изоксазол-5-карбоксилата (соединение 1-103)



25

Ацетат калия (22 мг, 0,22 ммоль) и [1,1'-бис(дифенилфосфино)ферроцен]дихлорпалладий (5 мг, 0,007 ммоль) добавляли в раствор этил-3-[2-хлор-4-фтор-5-(4,4,5,5-тетраметил-1,3,2-диоксаборолан-2-ил)фенил]-5-метил-4Н-изоксазол-5-карбоксилата (30 мг, 0,07 ммоль) и 2,3-дихлор-5-трифторметилпиридина (24 мг, 0,11 ммоль) в диоксане (1,2 мл). Смесь нагревали при 100°C в течение 45 минут в микроволновой печи, обеспечивали охлаждение, добавляли этилацетат (10 мл) и смесь фильтровали и выпаривали при пониженном давлении. Полученное масло очищали с помощью хроматографии с получением этил-3-[2-хлор-5-(3-хлор-5-трифторметил-2-пиридил)-4-фторфенил]-5-метил-4Н-изоксазол-5-карбоксилата (соединение 1-103) в виде смолы.

^1H ЯМР (400 МГц, CDCl_3) δ 8,85 (s,1H), 8,1 (s,1H), 7,85 (d,1H), 7,35 (d,1H), 4,3 (q,2H), 4,05 (d,1H), 3,4 (d,1H), 1,75 (s,3H), 1,35 (t,3H) ppm.

С помощью данного общего способа также были получены:

15 этил-3-[2-хлор-5-(3-хлор-5-метил-2-пиридил)-4-фторфенил]-5-метил-4Н-изоксазол-5-карбоксилат (соединение 1-175)

^1H ЯМР (500 МГц, CDCl_3) δ 8,55 (s,1H), 7,80 (s,1H), 7,75 (d,1H), 7,4 (d,1H), 4,3 (q,2H), 4,05 (d,1H), 3,45 (d,1H), 2,5 (s,3H), 1,7 (s,3H), 1,3 (t,3H) ppm.

20 Этил-3-[2-хлор-4-фтор-5-[4-(трифторметил)-2-пиридил]-фенил]-5-метил-4Н-изоксазол-5-карбоксилат (соединение 1-319)

^1H ЯМР (400 МГц, CDCl_3) δ 9,0 (d,1H), 8,3 (d,1H), 8,05 (s,1H), 7,65 (d,1H), 7,35 (d,1H), 4,3 (q,2H), 4,05 (d,1H), 3,4 (d,1H), 1,75 (s,3H), 1,35 (t,3H) ppm.

25 Этил-3-[2-хлор-4-фтор-5-[3-фтор-5-(трифторметил)-2-пиридил]-фенил]-5-метил-4Н-изоксазол-5-карбоксилат (соединение 1-91)

^1H ЯМР (400 МГц, CDCl_3) δ 8,85 (s,1H), 8,05 (d,1H), 7,8 (m,1H), 7,35 (d,1H), 4,3 (q,2H), 4,05 (d,1H), 3,4 (d,1H), 1,75 (s,3H), 1,35 (t,3H) ppm.

Этил-3-[2-хлор-5-[5-хлор-3-(трифторметил)-2-пиридил]-4-фторфенил]-5-метил-4Н-изоксазол-5-карбоксилат (соединение 1-343)

30 ^1H ЯМР (400 МГц, CDCl_3) δ 8,85 (s,1H), 8,15 (s,1H), 7,7 (d,1H), 7,3 (d,1H), 4,3 (q,2H), 3,95 (d,1H), 3,45 (d,1H), 1,75 (s,3H), 1,35 (t,3H) ppm.

Этил-3-[2-хлор-5-(3,5-дифтор-2-пиридил)-4-фторфенил]-5-метил-4Н-изоксазол-5-карбоксилат (соединение 1-551)

^1H ЯМР (400 МГц, CDCl_3) δ 8,5 (s,1H), 7,9 (d,1H), 7,35 (td,1H), 7,3 (d,1H), 4,3 (q,2H), 4,0 (d,1H), 3,4 (d,1H), 1,7 (s,3H), 1,3 (t,3H) ppm.

Этил-3-[2-хлор-4-фтор-5-[3-(трифторметил)пиразин-2-ил]фенил]-5-метил-4Н-изоксазол-5-карбоксилат (соединение 1-823)

^1H ЯМР (400 МГц, CDCl_3) δ 8,95 (s, 1H), 8,8 (s, 1H), 7,8 (m, 1H), 7,45 (d, 1H), 4,3 (q, 2H), 4,05 (d, 1H), 3,4 (d, 1H), 1,75 (s, 3H), 1,35 (t, 3H) ppm.

5 Этил-3-[2-хлор-4-фтор-5-[5-(трифторметил)пиразин-2-ил]фенил]-5-метил-4Н-изоксазол-5-карбоксилат (соединение 1-751)

^1H ЯМР (400 МГц, CDCl_3) δ 9,25 (s, 1H), 9,05 (s, 1H), 8,5 (d, 1H), 7,4 (d, 1H), 4,3 (q, 2H), 4,05 (d, 1H), 3,4 (d, 1H), 1,75 (s, 3H), 1,35 (t, 3H) ppm.

10 Этил-3-[2-хлор-4-фтор-5-[6-(трифторметил)пиразин-2-ил]фенил]-5-метил-4Н-изоксазол-5-карбоксилат (соединение 1-727)

^1H ЯМР (400 МГц, CDCl_3) δ 9,35 (s, 1H), 8,95 (s, 1H), 8,4 (d, 1H), 7,4 (d, 1H), 4,3 (q, 2H), 4,05 (d, 1H), 3,4 (d, 1H), 1,75 (s, 3H), 1,35 (t, 3H) ppm.

Этил-3-[2-хлор-4-фтор-5-(3-метилпиразин-2-ил)фенил]-5-метил-4Н-изоксазол-5-карбоксилат (соединение 1-775)

15 ^1H ЯМР (400 МГц, CDCl_3) δ 8,55 (br s, 2H), 7,8 (d, 1H), 7,35 (d, 1H), 4,3 (q, 2H), 4,0 (d, 1H), 3,4 (d, 1H), 2,55 (s, 3H), 1,7 (s, 3H), 1,3 (t, 3H) ppm.

Этил-3-[2-хлор-4-фтор-5-(5-метилпиразин-2-ил)фенил]-5-метил-4Н-изоксазол-5-карбоксилат (соединение 1-739)

20 ^1H ЯМР (400 МГц, CDCl_3) δ 8,95 (br s, 1H), 8,6 (br s, 1H), 8,3 (m, 1H), 7,35 (d, 1H), 4,3 (q, 2H), 4,0 (d, 1H), 3,4 (d, 1H), 2,6 (s, 3H), 1,7 (s, 3H), 1,3 (t, 3H) ppm.

Этил-3-[2-хлор-5-(3,6-диметилпиразин-2-ил)-4-фторфенил]-5-метил-4Н-изоксазол-5-карбоксилат (соединение 1-787)

^1H ЯМР (400 МГц, CDCl_3) δ 8,45 (s, 1H), 7,85 (m, 1H), 7,35 (d, 1H), 4,3 (q, 2H), 4,05 (d, 1H), 3,4 (d, 1H), 2,6 (s, 3H), 2,5 (s, 3H), 1,75 (s, 3H), 1,35 (t, 3H) ppm.

25 Этил-3-[2-хлор-5-(6-хлорпиридазин-3-ил)-4-фторфенил]-5-метил-4Н-изоксазол-5-карбоксилат (соединение 1-679)

^1H ЯМР (400 МГц, CDCl_3) δ 8,9 (s, 1H), 8,65 (s, 1H), 8,0 (d, 1H), 7,4 (d, 1H), 4,3 (q, 2H), 4,05 (d, 1H), 3,4 (d, 1H), 1,75 (s, 3H), 1,3 (t, 3H) ppm.

Этил-3-[2-хлор-4-фтор-5-(6-метоксипиридазин-3-ил)фенил]-5-метил-4Н-изоксазол-5-карбоксилат (соединение 1-703)

30 ^1H ЯМР (400 МГц, CDCl_3) δ 8,4 (d, 1H), 7,85 (dd, 1H), 7,3 (d, 1H), 7,05 (d, 1H), 4,25 (q, 2H), 4,2 (s, 3H), 4,0 (d, 1H), 3,4 (d, 1H), 1,7 (s, 3H), 1,3 (t, 3H) ppm.

Этил-3-[2-хлор-4-фтор-5-[7-(трифторметил)хиноксалин-2-ил]фенил]-5-метил-4Н-изоксазол-5-карбоксилат (соединение 1-763)

^1H ЯМР (400 МГц, CDCl_3) δ 9,4 (d,1H), 8,55 (d,1H), 8,5 (m,1H), 8,3 (d,1H), 8,0 (m,1H), 7,4 (d,1H), 4,3 (q,2H), 4,05 (d,1H), 3,4 (d,1H), 1,75 (s,3H), 1,35 (t,3H) ppm.

Этил-3-[2-хлор-5-[3-хлор-5-(трифторметил)пиразин-2-ил]-4-фторфенил]-5-метил-4Н-изоксазол-5-карбоксилат (1-811)

5 ^1H ЯМР (400 МГц, CDCl_3) δ 9,0 (s,1H), 7,95 (d,1H), 7,4 (d,1H), 4,3 (q,2H), 4,05 (d,1H), 3,45 (d,1H), 1,75 (s,3H), 1,35 (t,3H) ppm.

Этил-6-[2-хлор-5-[2-хлор-3-(трифторметил)-3-пиридил]-4-фторфенил]-5-метил-4Н-изоксазол-5-карбоксилат (соединение 1-655)

10 ^1H ЯМР (400 МГц, CDCl_3) δ 7,85 (d,1H), 7,75 (m,2H), 7,35 (d,1H), 4,3 (q,2H), 4,05 (d,1H), 3,45 (d,1H), 1,75 (s,3H), 1,35 (t,3H) ppm.

Этил-3-[5-(5-бром-3-хлор-2-пиридил)-2-хлор-4-фторфенил]-5-метил-4Н-изоксазол-5-карбоксилат (соединение 1-559)

^1H ЯМР (400 МГц, CDCl_3) δ 8,65 (s,1H), 8,0 (s,1H), 7,8 (d,1H), 7,3 (d,1H), 4,3 (q,2H), 4,0 (d,1H), 3,4 (d,1H), 1,75 (s,3H), 1,35 (t,3H) ppm.

15 Этил-3-[2-хлор-5-(3-хлор-5-метилсульфонил-2-пиридил)-4-фторфенил]-5-метил-4Н-изоксазол-5-карбоксилат (соединение 1-643)

^1H ЯМР (400 МГц, CDCl_3) δ 9,1 (d,1H), 8,35 (d,1H), 7,85 (d,1H), 7,35 (d,1H), 4,3 (q,2H), 4,0 (d,1H), 3,4 (d,1H), 3,2 (s,3H), 1,75 (s,3H), 1,35 (t,3H) ppm.

20 Этил-3-[2-хлор-5-(3-хлор-5-циано-2-пиридил)-4-фторфенил]-5-метил-4Н-изоксазол-5-карбоксилат (соединение 1-607)

^1H ЯМР (400 МГц, CDCl_3) δ 8,9 (d,1H), 8,15 (d,1H), 7,85 (d,1H), 7,35 (d,1H), 4,3 (q,2H), 4,05 (d,1H), 3,45 (d,1H), 1,75 (s,3H), 1,35 (t,3H) ppm.

Этил-3-[5-(5-ацетил-3-хлор-2-пиридил)-2-хлор-4-фторфенил]-5-метил-4Н-изоксазол-5-карбоксилат (соединение 1-631)

25 ^1H ЯМР (400 МГц, CDCl_3) δ 9,1 (d,1H), 8,35 (d,1H), 7,85 (d,1H), 7,35 (d,1H), 4,3 (q,2H), 4,05 (d,1H), 3,45 (d,1H), 2,7 (s,3H), 1,75 (s,3H), 1,35 (t,3H) ppm.

Этил-3-[5-[3-бром-5-(трифторметил)-2-пиридил]-2-хлор-4-фторфенил]-5-метил-4Н-изоксазол-5-карбоксилат (соединение 1-571)

30 ^1H ЯМР (400 МГц, CDCl_3) δ 8,9 (d,1H), 8,25 (d,1H), 7,8 (d,1H), 7,35 (d,1H), 4,3 (q,2H), 4,05 (d,1H), 3,45 (d,1H), 1,75 (s,3H), 1,35 (t,3H) ppm.

Этил-3-[5-[2-бром-5-(трифторметил)-3-пиридил]-2-хлор-4-фторфенил]-5-метил-4Н-изоксазол-5-карбоксилат (соединение 1-835)

^1H ЯМР (400 МГц, CDCl_3) δ 8,7 (s,1H), 7,85 (d,1H), 7,7 (d,1H), 7,35 (d,1H), 4,3 (q,2H), 4,05 (d,1H), 3,45 (d,1H), 1,75 (s,3H), 1,35 (t,3H) ppm.

Этил-3-[2-хлор-5-[3-хлор-5-(дифторметил)-2-пиридил]-4-фторфенил]-5-метил-4Н-изоксазол-5-карбоксилат (соединение 1-583)

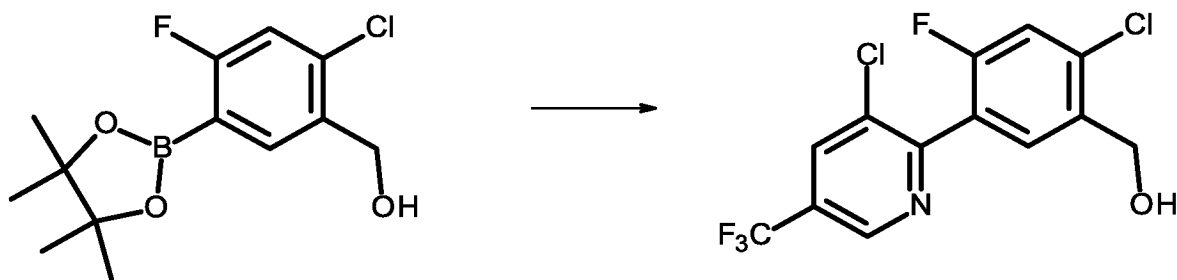
^1H ЯМР (400 МГц, CDCl_3) δ 8,75 (d,1H), 8,0 (s,1H), 7,85 (d,1H), 7,35 (d,1H), 6,8 (t,1H), 4,3 (q,2H), 4,05 (d,1H), 3,45 (d,1H), 1,75 (s,3H), 1,35 (t,3H) ppm.

5 Этил-3-[5-(4-амино-6-хлорпиридазин-3-ил)-2-хлор-4-фторфенил]-5-метил-4Н-изоксазол-5-карбоксилат

^1H ЯМР (400 МГц, CDCl_3) δ 7,9 (d,1H), 7,75 (d,1H), 7,55 (s,1H), 4,3 (q,2H), 4,05 (d,1H), 3,45 (d,1H), 1,75 (s,3H), 1,35 (t,3H) ppm (NH_2 не наблюдали).

10 **Пример 3. Альтернативное получение этил-3-[2-хлор-5-(3-хлор-5-трифторметил-2-пиридил)-4-фторфенил]-5-метил-4Н-изоксазол-5-карбоксилата (соединение 1-103)**

Стадия 1. Синтез [2-хлор-5-[3-хлор-5-(трифторметил)-2-пиридил]-4-фторфенил]метанола



15 Ацетат калия (2,5 г, 25 ммоль) и [1,1'-бис(дифенилфосфино)ферроцен]дихлорпалладий (0,74 г, 1 ммоль) добавляли в смесь этил-3-[2-хлор-4-фтор-5-(4,4,5,5-тетраметил-1,3,2-диоксаборолан-2-ил)фенил]-5-метил-4Н-изоксазол-5-карбоксилата (полученного как описано в примере 2, стадия 2; 2,86 мг, 20 10 ммоль) и 2,3-дихлор-5-трифторметилпиридина (2,83 г, 13 ммоль) в толуоле (57 мл) и воде (29 мл). Смесь нагревали с обратным холодильником в течение 17 часов, обеспечивали охлаждение, добавляли этилацетат (50 мл) и фазы разделяли. Органическую фазу высушивали и выпаривали при пониженном давлении с получением 25 этил-[2-хлор-5-[3-хлор-5-(трифторметил)-2-пиридил]-4-фторфенил]метанола в виде белого твердого вещества (1,0 г).

^1H ЯМР (400 МГц, CDCl_3) δ 8,85 (s,1H), 8,1 (s,1H), 7,65 (d,1H), 7,25 (d,1H), 4,8 (d,2H), 2,0 (t,1H) ppm.

С помощью данного общего способа также были получены:

[2-хлор-5-(3-хлор-5-фтор-2-пиридил)-4-фторфенил]-метанол,

[2-хлор-5-(2-хлор-5-фтор-3-пиридил)-4-фторфенил]-метанол,

[2-хлор-5-(3-хлор-5-нитро-2-пиридил)-4-фторфенил]-метанол,

5 [2-хлор-5-(3-хлор-2-пиридил)-4-фторфенил]-метанол

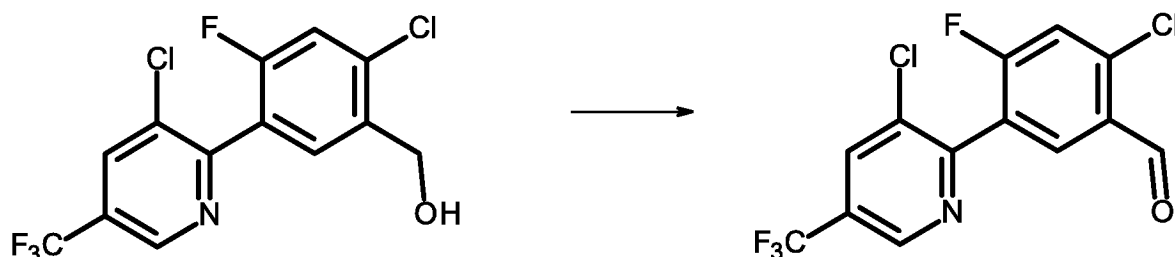
^1H ЯМР (400 МГц, CDCl_3) δ 8,6 (d,1H), 7,8 (d,1H), 7,6 (d,1H), 7,45 (dd,1H), 7,2 (d,1H), 4,75 (s,2H), 2,25 (br s,1H) ppm.

[2-Хлор-5-(3,5-дихлор-2-пиридил)-4-фторфенил]-метанол

^1H ЯМР (400 МГц, CDCl_3) δ 8,6 (s,1H), 7,85 (d,1H), 7,65 (d,1H), 7,45 (dd,1H), 4,8 (d,2H), 1,95 (t,1H) ppm.

10

Стадия 2. Синтез 2-хлор-5-[3-хлор-5-(трифторметил)-2-пиридил]-4-фторбензальдегида



Дихромат пиридиния (0,32 г, 1,9 ммоль) добавляли к перемешиваемому раствору [2-хлор-5-[3-хлор-5-(трифторметил)-2-пиридил]-4-фторфенил]метанола (300 мг, 0,88 ммоль) в дихлорметане (10 мл). Полученную смесь перемешивали при комнатной температуре в течение 5 часов, затем фильтровали и выпаривали при пониженном давлении с получением остатка, который очищали с помощью хроматографии с получением 2-хлор-5-[3-хлор-5-(трифторметил)-2-пиридил]-4-фторбензальдегида в виде масла (210 мг).

15

20

^1H ЯМР (400 МГц, CDCl_3) δ 10,5 (s,1H), 8,9 (br s,1H), 8,15 (d,1H), 8,1 (d,1H), 7,35 (d,1H) ppm.

С помощью данного общего способа также были получены:

25 2-хлор-5-[3-хлор-5-(трифторметил)-2-пиридил]-бензальдегид,

2-хлор-5-(3-хлор-5-фтор-2-пиридил)-4-фторбензальдегид,

2-хлор-5-(2-хлор-5-фтор-3-пиридил)-4-фторбензальдегид,

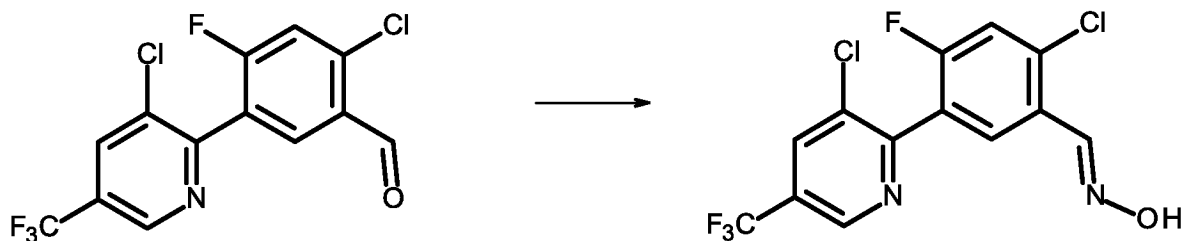
2-хлор-5-(3-хлор-5-нитро-2-пиридил)-4-фторбензальдегид,

2-хлор-5-(3-хлор-2-пиридил)-4-фторбензальдегид

^1H ЯМР (400 МГц, CDCl_3) δ 10,4 (s, 1H), 8,65 (d, 1H), 8,15 (d, 1H), 7,85 (d, 1H), 7,35 (d, 1H), 7,3 (d, 1H) ppm.

2-Хлор-5-(3,5-дихлор-2-пиридил)-4-фторбензальдегид.

- 5 Стадия 3. Синтез оксима 2-хлор-5-[3-хлор-5-(трифторметил)-2-пиридил]-4-фторбензальдегида



- 10 Гидрохлорид гидросиламина (49 мг, 0,71 ммоль) добавляли к перемешиваемому раствору 2-хлор-5-[3-хлор-5-(трифторметил)-2-пиридил]-4-фторбензальдегида (0,20 г, 0,47 ммоль) в тетрагидрофуране (1 мл) при комнатной температуре. Добавляли воду (0,2 мл) и полученный раствор перемешивали при комнатной температуре в течение 60 минут. Смесь концентрировали при пониженном давлении, затем добавляли дихлорметан и воду и фазы разделяли. Органическую фазу
- 15 высушивали и выпаривали при пониженном давлении с получением остатка, который очищали с помощью хроматографии с получением оксима 2-хлор-5-[3-хлор-5-(трифторметил)-2-пиридил]-4-фторбензальдегида в виде белого твердого вещества (170 мг).

- 20 ^1H ЯМР (400 МГц, CD_3OD) δ 8,95 (s, 1H), 8,45 (s, 1H), 8,4 (s, 1H), 8,05 (d, 1H), 7,45 (d, 1H) ppm (ОН не наблюдали).

С помощью данного общего способа также были получены:

оксим 2-хлор-5-[3-хлор-5-(трифторметил)-2-пиридил]-бензальдегида

^1H ЯМР (400 МГц, CDCl_3) δ 8,85 (s, 1H), 8,6 (s, 1H), 8,3 (s, 1H), 8,05 (s, 1H), 7,85 (br s, 1H),

- 25 7,7 (d, 1H), 7,5 (d, 1H) ppm.

Оксим 2-хлор-5-(3-хлор-5-фтор-2-пиридил)-4-фторбензальдегида,

оксим 2-хлор-5-(2-хлор-5-фтор-3-пиридил)-4-фторбензальдегида,

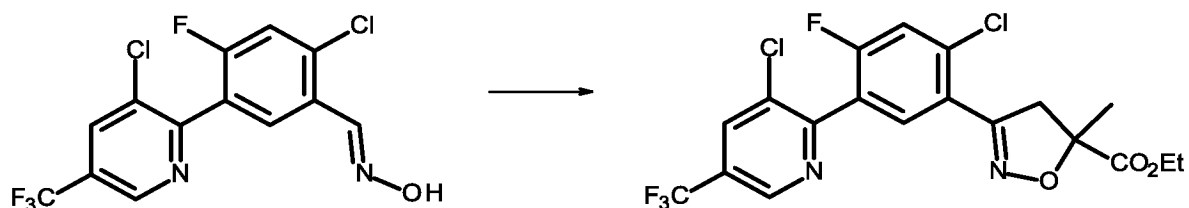
оксим 2-хлор-5-(3-хлор-5-нитро-2-пиридил)-4-фторбензальдегида,

оксим 2-хлор-5-(3-хлор-2-пиридил)-4-фторбензальдегида,

оксим 2-хлор-5-(3,5-дихлор-2-пиридил)-4-фторбензальдегида.

Стадия 4. Синтез этил-3-[2-хлор-5-[3-хлор-5-(трифторметил)-2-пиридил]-4-фторфенил]-5-метил-4Н-изоксазол-5-карбоксилата (соединение 1-103)

5



1-Хлорпирролидин-2,5-дион (240 мг, 1,7 ммоль) добавляли порциями к перемешиваемому раствору оксима 2-хлор-5-[3-хлор-5-(трифторметил)-2-пиридил]-4-фторбензальдегида (0,85 г, 1,4 ммоль) в N,N-диметилформамиде (4,3 мл) при 35°C. Полученную смесь перемешивали при 30°C в течение 1 часа, затем охлаждали до комнатной температуры и добавляли воду (20 мл). Добавляли дихлорметан (50 мл), фазы разделяли и органическую фазу высушивали и охлаждали до 5°C. К этому перемешанному раствору добавляли по каплям смесь триэтиламина (0,33 мл, 2,3 ммоль) и этил-2-метилпроп-2-еноата (0,34 мл, 2,6 ммоль). После перемешивания при комнатной температуре в течение 1 часа добавляли разбавленную хлористоводородную кислоту (5 мл), фазы разделяли и органическую фазу высушивали и очищали с помощью хроматографии с получением этил-3-[2-хлор-5-[3-хлор-5-(трифторметил)-2-пиридил]-4-фторфенил]-5-метил-4Н-изоксазол-5-карбоксилата (соединение 1-103) в виде масла (550 мг).

¹H ЯМР (400 МГц, CDCl₃) δ 8,85 (s,1H), 8,1 (s,1H), 7,85 (d,1H), 7,35 (d,1H), 4,3 (q,2H), 4,05 (d,1H), 3,4 (d,1H), 1,75 (s,3H), 1,35 (t,3H) ppm.

Отдельные энантиомеры соединения 1-103 получали с помощью хиральной хроматографии (¹H-ЯМР, как указано выше).

25

С помощью данного общего способа также были получены:

этил-3-[2-хлор-5-[3-хлор-5-(трифторметил)-2-пиридил]-фенил]-5-метил-4Н-изоксазол-5-карбоксилат (соединение 1-99)

¹H ЯМР (400 МГц, CDCl₃) δ 8,85 (s,1H), 8,1 (d,1H), 8,05 (s,1H), 7,8 (dd,1H), 7,55 (d,1H), 4,3 (q,2H), 4,0 (d,1H), 3,45 (d,1H), 1,75 (s,3H), 1,35 (t,3H) ppm.

30

Этил-3-[2-хлор-5-(3-хлор-5-фтор-2-пиридил)-4-фторфенил]-5-метил-4Н-изоксазол-5-карбоксилат (соединение 1-331)

^1H ЯМР (400 МГц, CDCl_3) δ 8,5 (s, 1H), 7,8 (d, 1H), 7,65 (m, 1H), 7,3 (d, 1H), 4,3 (q, 2H), 4,05 (d, 1H), 3,35 (d, 1H), 1,7 (s, 3H), 1,3 (t, 3H) ppm.

5 Этил-3-[2-хлор-5-(2-хлор-5-фтор-3-пиридил)-4-фторфенил]-5-метил-4Н-изоксазол-5-карбоксилат (соединение 1-475)

^1H ЯМР (400 МГц, CDCl_3) δ 8,35 (s, 1H), 7,7 (d, 1H), 7,45 (m, 1H), 7,3 (d, 1H), 4,3 (q, 2H), 4,0 (d, 1H), 3,4 (d, 1H), 1,75 (s, 3H), 1,3 (t, 3H) ppm.

10 Этил-3-[2-хлор-5-(3-хлор-5-нитро-2-пиридил)-4-фторфенил]-5-метил-4Н-изоксазол-5-карбоксилат (соединение 1-355)

^1H ЯМР (400 МГц, CDCl_3) δ 9,45 (s, 1H), 8,65 (s, 1H), 7,9 (d, 1H), 7,35 (d, 1H), 4,3 (q, 2H), 4,05 (d, 1H), 3,4 (d, 1H), 1,75 (s, 3H), 1,35 (t, 3H) ppm.

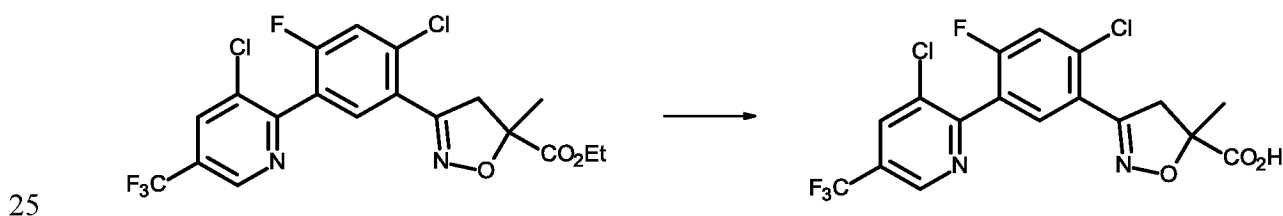
Этил-3-[2-хлор-5-(3-хлор-2-пиридил)-4-фторфенил]-5-метил-4Н-изоксазол-5-карбоксилат (соединение 1-127)

15 ^1H ЯМР (400 МГц, CDCl_3) δ 8,65 (d, 1H), 7,75 (m, 2H), 7,35 (m, 1H), 7,3 (d, 1H), 4,3 (q, 2H), 4,05 (d, 1H), 3,4 (d, 1H), 1,75 (s, 3H), 1,35 (t, 3H) ppm.

Этил-3-[2-хлор-5-(3,5-дихлор-2-пиридил)-4-фторфенил]-5-метил-4Н-изоксазол-5-карбоксилат (соединение 1-115)

20 ^1H ЯМР (400 МГц, CDCl_3) δ 8,85 (d, 1H), 7,9 (d, 1H), 7,85 (d, 1H), 7,35 (d, 1H), 4,3 (q, 2H), 4,05 (d, 1H), 3,4 (d, 1H), 1,75 (s, 3H), 1,35 (t, 3H) ppm.

Пример 4. Получение 3-[2-хлор-5-(3-хлор-5-трифторметил-2-пиридил)-4-фторфенил]-5-метил-4Н-изоксазол-5-карбоновой кислоты (соединение 1-101)



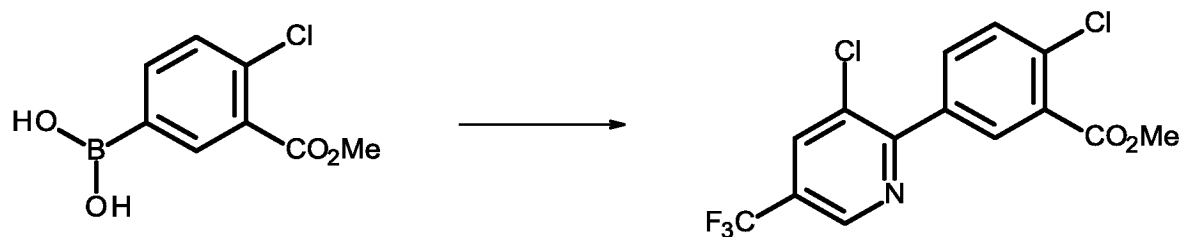
30 Концентрированную серную кислоту (0,5 мл, 9 ммоль) добавляли к перемешиваемому раствору этил-3-[2-хлор-5-(3-хлор-5-трифторметил-2-пиридил)-4-фторфенил]-5-метил-4Н-изоксазол-5-карбоксилата (полученного как описано в примере 3, стадия 4; 200 мг, 0,43 ммоль) в ледяной уксусной кислоте (4 мл) и полученную смесь

нагревали при 100°C в течение 1 часа. Смесь охлаждали до температуры окружающей среды, выпаривали при пониженном давлении, затем добавляли толуол (2 x 10 мл) и раствор выпаривали при пониженном давлении с получением остатка, который очищали с помощью хроматографии с получением 3-[2-хлор-5-(3-хлор-5-трифторметил-2-пиридил)-4-фторфенил]-5-метил-4Н-изоксазол-5-карбоновой кислоты (соединение 1-101) в виде белого твердого вещества (160 мг).

^1H ЯМР (400 МГц, CDCl_3) δ 8,9 (s,1H), 8,15 (s,1H), 7,8 (d,1H), 7,35 (s,1H), 4,0 (d,1H), 3,5 (d,1H), 1,7 (s,3H) ppm (кислотный протон не наблюдали).

10 Пример 5. Получение [2-хлор-5-(3-хлор-5-трифторметил-2-пиридил)-фенил]-метанола

Стадия 1. Синтез метил-2-хлор-5-[3-хлор-5-(трифторметил)-2-пиридил]-бензоата



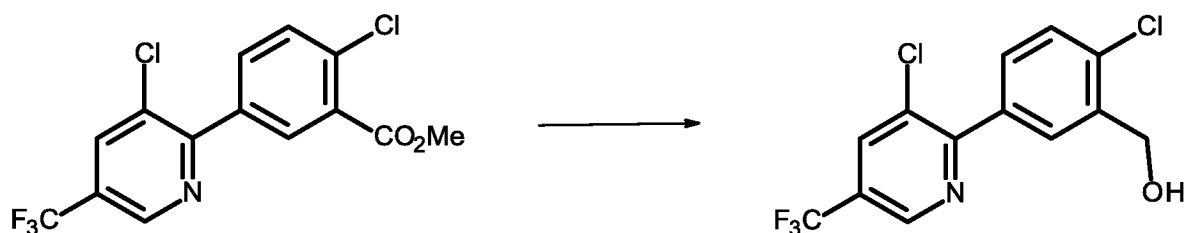
15 Ацетат калия (0,295 г, 0,86 ммоль) и [1,1'-бис(дифенилфосфино)ферроцен]дихлорпалладий (73 мг, 0,1 ммоль) добавляли в смесь (4-хлор-3-метоксикарбонилфенил)бороновой кислоты (215 мг, 0,98 ммоль) и 2,3-дихлор-5-трифторметилпиридина (320 мг, 1,5 ммоль) в диоксане (8,6 мл). Смесь

20 нагревали при 100°C в течение 45 минут в микроволновой печи, обеспечивали охлаждение и выпаривали при пониженном давлении. Остаток растворяли в дихлорметане (10 мл) и полученный раствор промывали водой и выпаривали при пониженном давлении. Остаток очищали с помощью хроматографии с получением метил-2-хлор-5-[3-хлор-5-(трифторметил)-2-пиридил]-бензоата в виде бледно-

25 оранжевого масла (0,30 г).

^1H ЯМР (400 МГц, CDCl_3) δ 8,9 (s,1H), 8,35 (d,1H), 8,15 (s,1H), 7,9 (d,1H), 7,6 (d,1H), 4,0 (s,3H) ppm.

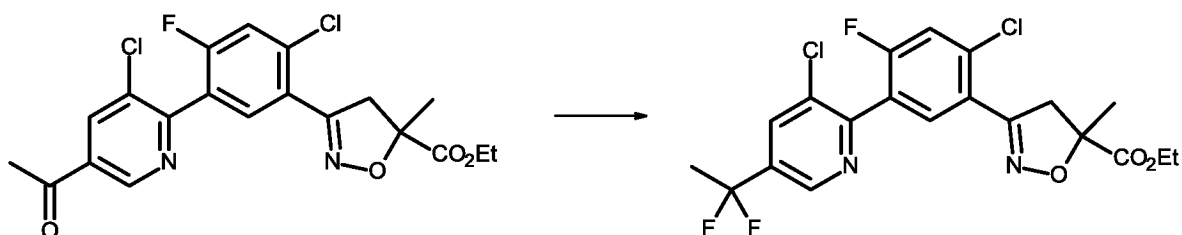
Стадия 2. Синтез [2-хлор-5-[3-хлор-5-(трифторметил)-2-пиридил]-фенил]-метанола



Раствор алюмогидрида лития (1 М в тетрагидрофуране; 4,8 мл, 4,8 ммоль) добавляли по каплям в течение 15 минут к перемешиваемому раствору метил-2-хлор-5-[3-хлор-5-(трифторметил)-2-пиридил]-бензоата (1,4 г, 3,2 ммоль) в тетрагидрофуране (10 мл) при 15°C. Обеспечивали нагревание полученной смеси до комнатной температуры и перемешивали в течение 2 часов. Смесь охлаждали до 15°C и медленно добавляли воду (5 мл). Смесь перемешивали в течение 5 минут, затем добавляли водный раствор хлорида аммония (50 мл) и смесь перемешивали в течение 5 минут, экстрагировали этилацетатом и органическую фазу высушивали и выпаривали при пониженном давлении с получением красного масла, которое очищали с помощью хроматографии с получением [2-хлор-5-[3-хлор-5-(трифторметил)-2-пиридил]-фенил]-метанола в виде желтого масла (440 мг).

¹H ЯМР (400 МГц, CDCl₃) δ 8,85 (d,1H), 8,1 (s,1H), 7,95 (s,1H), 7,7 (dd,1H), 7,5 (d,1H), 4,9 (s,2H), 2,0 (br s,1H) ppm.

Пример 6. Получение этил-3-[2-хлор-5-[3-хлор-5-(1,1-дифторэтил)-2-пиридил]-4-фторфенил]-5-метил-4Н-изоксазол-5-карбоксилата (соединение 1-595)

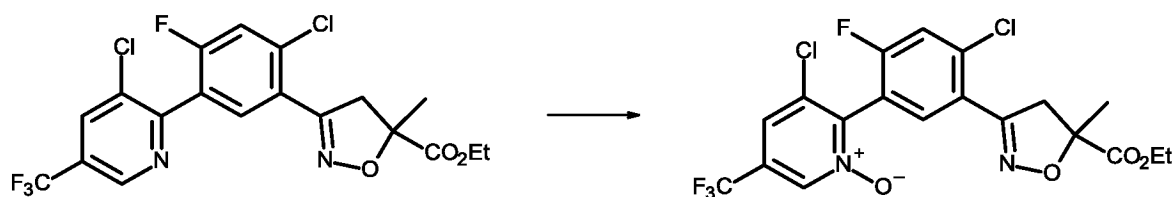


2-Метокси-N-(2-метоксиэтил)-N-(трифтор-λ⁴-сульфанил)этанамин (50% в толуоле; 0,93 мл, 2,6 ммоль) добавляли по каплям в этил-3-[5-(5-ацетил-3-хлор-2-пиридил)-2-хлор-4-фторфенил]-5-метил-4Н-изоксазол-5-карбоксилат (полученный как описано в примере 2, стадия 6; 75 мг, 0,17 ммоль) и полученную смесь перемешивали при температуре окружающей среды в течение 70 часов, затем добавляли по каплям в ледяной водный раствор гидрокарбоната натрия. Полученную смесь экстрагировали этилацетатом (2 x 40 мл) и объединенные органические экстракты высушивали и

выпаривали при пониженном давлении с получением остатка, который очищали с помощью хроматографии с получением этил-3-[2-хлор-5-[3-хлор-5-(1,1-дифторэтил)-2-пиридил]-4-фторфенил]-5-метил-4Н-изоксазол-5-карбоксилата (соединение 1-595) в виде масла (29 мг).

¹H ЯМР (400 МГц, CDCl₃) δ 8,7 (d,1H), 7,95 (d,1H), 7,8 (d,1H), 7,3 (d,1H), 4,25 (q,2H), 4,0 (d,1H), 3,4 (d,1H), 2,0 (t,3H), 1,7 (s,3H), 1,3 (t,3H) ppm.

Пример 7. Получение этил-3-[2-хлор-5-(3-хлор-1-оксидо-5-трифторметил-2-пиридил)-4-фторфенил]-5-метил-4Н-изоксазол-5-карбоксилата (соединение 1-667)



10 Раствор этил-3-[2-хлор-5-(3-хлор-5-трифторметил-2-пиридил)-4-фторфенил]-5-метил-4Н-изоксазол-5-карбоксилата (полученного как описано в примере 3, стадия 4; 300 мг, 0,64 ммоль) и 3-хлорпербензойной кислоты (60%; 890 мг, 3,1 ммоль) в трифторметилбензоле (10 мл) перемешивали при температуре окружающей среды в течение 48 часов. Добавляли воду (20 мл) и этилацетат (60 мл), фазы разделяли и
15 водную фазу экстрагировали этилацетатом (4 x 50 мл). Объединенные органические фазы высушивали и выпаривали при пониженном давлении с получением остатка, который очищали с помощью хроматографии с получением этил-3-[2-хлор-5-(3-хлор-1-оксидо-5-трифторметил-2-пиридил)-4-фторфенил]-5-метил-4Н-изоксазол-5-карбоксилата (соединение 1-667) в виде масла (39 мг). ¹H ЯМР (400 МГц, CDCl₃) δ 8,55
20 (s,1H), 7,8 (dd,1H), 7,6 (s,1H), 7,4 (d,1H), 4,3 (q,2H), 4,15 (d,0,5H), 3,9 (d,0,5H), 3,55 (d,0,5H), 3,3 (d,0,5H), 1,75 (d,3H), 1,35 (td,3H) ppm.

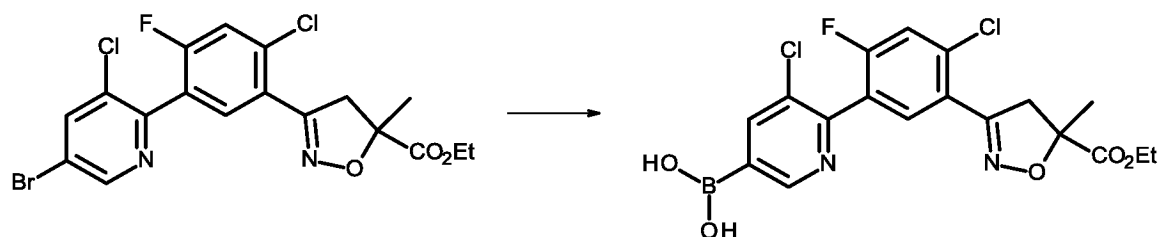
С помощью данного общего способа также был получен:

25 этил-3-[2-хлор-5-(3-хлор-1-оксидо-5-трифторметил-2-пиридил)-фенил]-5-метил-4Н-изоксазол-5-карбоксилат (соединение 1-663)

¹H ЯМР (400 МГц, CDCl₃) δ 8,5 (s,1H), 7,8 (d,1H), 7,6 (d,1H), 7,6 (s,1H), 7,5 (dd,1H), 4,3 (q,2H), 4,05 (d,1H), 3,45 (d,1H), 1,75 (s,3H), 1,35 (t,3H) ppm.

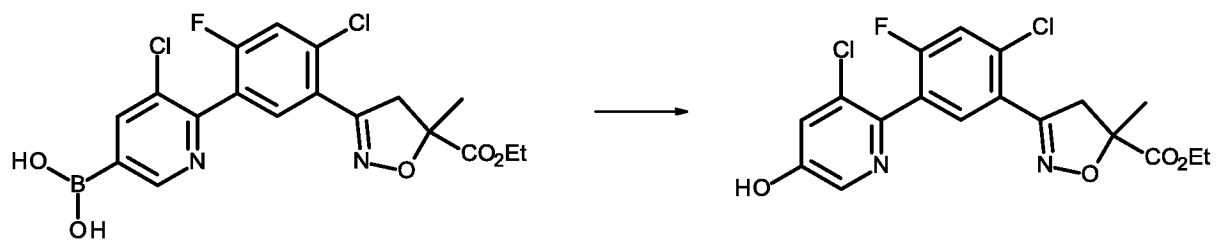
Пример 8. Получение этил-3-[2-хлор-5-[3-хлор-5-(дифторметокси)-2-пиридил]-4-фторфенил]-5-метил-4Н-изоксазол-5-карбоксилата (соединение 1-619)

Стадия 1. Синтез [5-хлор-6-[4-хлор-5-(5-этоксикарбонил-5-метил-4Н-изоксазол-3-ил)-2-фторфенил]-3-пиридил]бороновой кислоты



Раствор этил-3-[5-(5-бром-3-хлор-2-пиридил)-2-хлор-4-фторфенил]-5-метил-4Н-изоксазол-5-карбоксилата (соединение 1-559) (полученного как описано в примере 2; 330 мг, 0,68 ммоль), бис(пинаколато)дибора (0,19 г, 0,75 ммоль), ацетата калия (167 мг, 1,7 ммоль), диацетоксипалладия (3 мг, 0,014 ммоль) и трициклогексилфосфина (8 мг, 0,028 ммоль) в толуоле (6,6 мл) нагревали при 110°C в течение 3 часов, затем обеспечивали охлаждение и добавляли этилацетат (80 мл). Полученную смесь фильтровали через Celite и фильтрат выпаривали при пониженном давлении с получением [5-хлор-6-[4-хлор-5-(5-этоксикарбонил-5-метил-4Н-изоксазол-3-ил)-2-фторфенил]-3-пиридил]бороновой кислоты, которую переносили на следующую стадию без дополнительной очистки.

Стадия 2. Синтез этил-3-[2-хлор-5-(3-хлор-5-гидрокси-2-пиридил)-4-фторфенил]-5-метил-4Н-изоксазол-5-карбоксилата

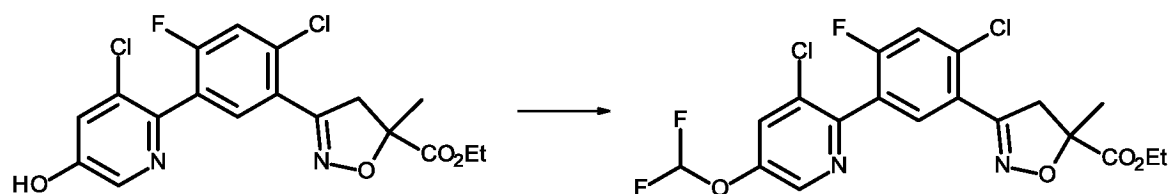


Раствор оксона (0,36 г, 0,58 ммоль) в воде (2,8 мл) добавляли к перемешиваемому раствору [5-хлор-6-[4-хлор-5-(5-этоксикарбонил-5-метил-4Н-изоксазол-3-ил)-2-фторфенил]-3-пиридил]бороновой кислоты (280 мг, 0,57 ммоль) в ацетоне (11 мл). Полученную смесь перемешивали в течение 1 часа, затем добавляли воду и этилацетат и фазы разделяли. Водную фазу экстрагировали этилацетатом и объединенные органические фазы высушивали и выпаривали при пониженном

давлении с получением остатка, который очищали с помощью хроматографии с получением этил-3-[2-хлор-5-(3-хлор-5-гидрокси-2-пиридил)-4-фторфенил]-5-метил-4Н-изоксазол-5-карбоксилата (190 мг).

¹H ЯМР (400 МГц, CDCl₃) δ 8,2 (d,1H), 7,75 (d,1H), 7,3 (d,1H), 7,25 (s,1H), 4,3 (q,2H), 4,0 (d,1H), 3,4 (d,1H), 1,75 (s,3H), 1,35 (t,3H) ppm (ОН не наблюдали).

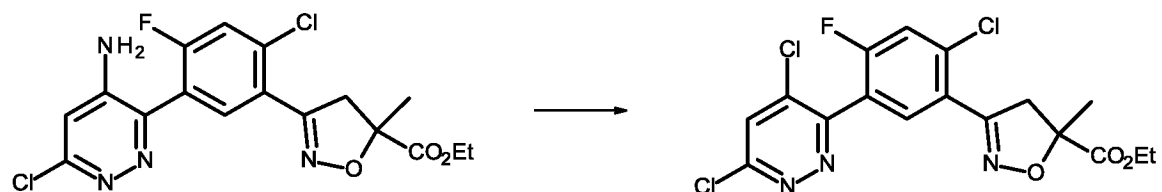
Стадия 3. Синтез этил-3-[2-хлор-5-[3-хлор-5-(дифторметокси)-2-пиридил]-4-фторфенил]-5-метил-4Н-изоксазол-5-карбоксилата (соединение 1-619)



Смесь 3-[2-хлор-5-(3-хлор-5-гидрокси-2-пиридил)-4-фторфенил]-5-метил-4Н-изоксазол-5-карбоксилата (90 мг, 0,21 ммоль), хлордифторацетата натрия (66 мг, 0,43 ммоль), карбоната калия (35 мг, 0,26 ммоль) и диметилформамида (0,9 мл) перемешивали при 80°C в течение 18 часов, затем обеспечивали охлаждение и добавляли трет-бутилметилвый эфир (60 мл). Смесь промывали водой, высушивали и выпаривали при пониженном давлении с получением смолы, которую очищали с помощью хроматографии с получением этил-3-[2-хлор-5-[3-хлор-5-(дифторметокси)-2-пиридил]-4-фторфенил]-5-метил-4Н-изоксазол-5-карбоксилата (соединение 1-619) в виде смолы (35 мг).

¹H ЯМР (400 МГц, CDCl₃) δ 8,5 (d,1H), 7,8 (d,1H), 7,65 (s, 1H), 7,3 (d,1H), 6,65 (t,1H), 4,3 (q,2H), 4,0 (d,1H), 3,4 (d,1H), 1,75 (s,3H), 1,35 (t,3H) ppm.

Пример 9. Получение этил-3-[2-хлор-5-(4,6-дихлорпиридазин-3-ил)-4-фторфенил]-5-метил-4Н-изоксазол-5-карбоксилата (соединение 1-691)



Трет-бутилнитрит (0,035 мл, 0,4 ммоль) добавляли по каплям в течение 2 минут к перемешиваемой смеси хлорида меди(II) (54 мг, 0,4 ммоль) и ацетонитрила (2,2 мл) при 0°C в атмосфере азота. Добавляли раствор этил-3-[5-(4-амино-6-хлорпиридазин-3-

ил)-2-хлор-4-фторфенил]-5-метил-4Н-изоксазол-5-карбоксилата (полученного как описано в примере 2, стадия 6; 110 мг, 0,27 ммоль) в ацетонитриле (1,1 мл) и смесь перемешивали в течение 30 минут при 0°C, затем при температуре окружающей среды в течение 2 часов. Добавляли воду (30 мл) и полученную смесь экстрагировали этилацетатом (2 x 40 мл). Объединенные органические экстракты высушивали и выпаривали при пониженном давлении с получением остатка, который очищали с помощью хроматографии с получением этил-3-[2-хлор-5-(4,6-дихлорпиридазин-3-ил)-4-фторфенил]-5-метил-4Н-изоксазол-5-карбоксилата (соединение 1-691) (71 мг).

¹H ЯМР (400 МГц, CDCl₃) δ 7,9 (d,1H), 7,7 (s,1H), 7,35 (d, 1H), 4,3 (q,2H), 4,05 (d,1H), 3,4 (d,1H), 1,75 (s,3H), 1,35 (t,3H) ppm.

ПРИМЕРЫ СОСТАВОВ

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

Комбинацию тщательно смешивают со вспомогательными веществами и смесь тщательно измельчают в подходящей мельнице с получением смачиваемых порошков, которые могут быть разбавлены водой с получением суспензии с необходимой концентрацией.

Эмульгируемый концентрат

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

Из этого концентрата путем разбавления водой могут быть получены эмульсии любого необходимого разбавления, которые могут применяться для защиты растений.

Пылевидные препараты	a)	b)	c)
Активные ингредиенты	5%	6%	4%
Тальк	95%	-	-
Каолин	-	94%	-
Минеральный наполнитель	-	-	96%

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

Экструдированные гранулы

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

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

Покрытые оболочкой гранулы

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

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

10 **Суспензионный концентрат**

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

Тонкоизмельченную комбинацию тщательно смешивают со вспомогательными веществами с получением суспензионного концентрата, из которого путем разбавления водой может быть получена суспензия любой необходимой степени разбавления.

Капсульная суспензия медленного высвобождения

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

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

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

БИОЛОГИЧЕСКИЕ ПРИМЕРЫ

Биологическая эффективность до появления всходов

20 Семена сорняков и/или сельскохозяйственных высеивали в стандартную почву в горшках. После культивирования в течение одного дня в контролируемых условиях в теплице (при 24/19°C, день/ночь; 16-часовой световой период), растения опрыскивали водным раствором для опрыскивания, полученным из состава технических активных ингредиентов в небольшом количестве ацетона и смеси специального растворителя и эмульгатора, называемой IF50 (11,12% Emulsogen EL360 TM + 44,44% N-метилпирролидона + 44,44% гликолевого простого эфира Dowanol DPM), с получением
25 50 г/л раствора, который затем разбавляли с применением 0,2% Genapol XO80 в качестве разбавителя с получением требуемой конечной дозы испытуемого соединения.

30 Затем испытуемые растения выращивали при контролируемых условиях в теплице (при 24/18°C, день/ночь; 15 часов светового периода; 50 % влажность) и поливали дважды в сутки. Через 13 дней проводили оценку результатов испытания (100 = повреждение всего растения; 0 = отсутствие повреждения у растения). Результаты показаны в таблице 2 ниже.

Таблица 2

Соединение	Норма применения (г/га)	Виды					
		АМАРА	LOLPE	ЕРННЛ	ІРОНЕ	SETFA	ЕСНCG
1-7	250	30	0	0	0	0	0
1-19	250	0	0	0	0	0	0
1-31	250	30	0	10	0	0	0
1-43	250	20	0	0	0	0	0
1-67	250	10	0	0	0	0	0
1-79	250	50	40	60	100	60	80
1-91	250	100	90	100	100	100	100
1-99	250	100	80	100	100	100	100
1-101	250	100	80	100	100	100	100
1-103	250	100	80	100	100	80	90
1-103 энантиомер А	250	100	80	100	100	100	100
1-103 энантиомер В	250	100	20	100	100	80	100
1-115	250	100	50	100	80	60	80
1-127	250	40	20	100	50	70	50
1-139	250	0	0	0	0	0	0
1-175	250	30	20	60	50	80	60
1-199	250	80	10	30	0	10	0
1-211	250	0	0	0	0	0	0
1-223	250	0	0	0	0	0	0
1-235	250	100	0	50	60	0	0
1-247	250	60	0	0	0	0	0
1-259	250	0	0	0	0	0	0
1-271	250	0	0	0	0	0	0
1-283	250	0	0	20	0	0	0
1-295	250	0	0	0	0	0	0
1-319	250	40	10	20	0	0	30
1-331	250	100	80	100	60	100	90
1-343	250	70	20	50	60	50	30
1-355	250	0	20	20	20	10	10
1-367	250	0	0	0	0	0	0
1-379	250	0	0	0	0	0	0
1-391	250	0	0	0	0	0	0
1-403	250	30	20	20	10	0	40
1-415	250	0	0	0	0	0	0
1-427	250	0	0	0	0	0	0
1-439	250	50	20	10	10	20	30
1-451	250	90	40	80	50	40	40
1-463	250	20	10	20	10	30	50
1-475	250	0	0	40	20	0	0
1-487	250	0	0	0	0	0	0

Соединение	Норма применения (г/га)	Виды					
		АМАРА	LOLPE	ЕРННЛ	ІРОНЕ	SETFA	ЕСНСГ
1-499	250	20	20	0	0	0	0
1-511	250	0	0	0	0	0	0
1-523	250	0	0	0	0	0	20
1-535	250		0	0	40	40	10
1-551	250	80	50	50	60	90	80
1-559	250	100	50	50	10	80	90
1-571	250	100	70	0	0	10	10
1-583	250	100	60	100	60	90	90
1-595	250	100	90	100	80	100	100
1-607	250	100	20	50	30	10	70
1-631	250	0	0	0	0	0	0
1-643	250	100	100	100	100	100	100
1-655	250	100	40	90	40	30	40
1-663	250	100	50	90	90	40	30
1-667	250	100	100	100	100	100	100
1-679	250	0	0	0	0	0	0
1-703	250		0	0	0	0	0
1-727	250	0	0	10	20	10	30
1-739	250	0	0	0	0	0	0
1-751	250	20	20		50	40	50
1-763	250	0	0	0	0	0	0
1-775	250	0	0	0	0	0	0
1-787	250	10	20	10	10	20	20
1-811	250	100	10	100	0	50	70
1-823	250	0	20	40	90	20	20
1-835	250	70	0	0	10	0	0
2-451	250	90	40	0	0	70	60

Биологическая эффективность после появления всходов

5 Семена сорняков и/или сельскохозяйственных высеивали в стандартную почву в горшках. После культивирования в течение 14 дней в контролируемых условиях в теплице (при 24/19°C, день/ночь; 16-часовой световой период), растения опрыскивали водным раствором для опрыскивания, полученным из состава технических активных ингредиентов в небольшом количестве ацетона и смеси специального растворителя и эмульгатора, называемой IF50 (11,12% Emulsogen EL360 TM + 44,44% N-метилпирролидона + 44,44% гликолевого простого эфира Dowanol DPM), с получением 10 50 г/л раствора, который затем разбавляли с применением 0,2% Genapol XO80 в качестве разбавителя с получением требуемой конечной дозы испытуемого соединения.

Затем испытуемые растения выращивали при контролируемых условиях в теплице (при 24/18°C, день/ночь; 15 часов светового периода; 50% влажность) и поливали дважды в сутки. Через 13 дней проводили оценку результатов испытания (100 = повреждение всего растения; 0 = отсутствие повреждения у растения). Результаты показаны в таблице 3 ниже.

5

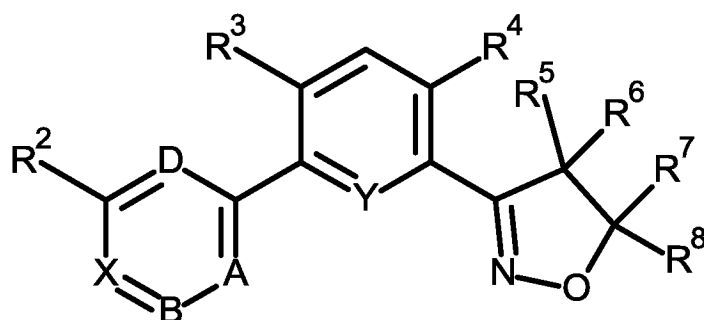
Таблица 3

Соединение	Норма применения (г/га)	Виды								
		AM APA	CHEAL	EPHHL	IPOHE	ELEIN	LOLPE	DIGSA	SETFA	ECHCG
1-7	250	90	100	90	90	70	10	40	60	30
1-19	250	90	90	90	80	20	10	20	40	20
1-31	250	100	100	80	90	70	20	30	50	30
1-43	250	80	80	20	60	70	0	30	90	20
1-67	250	20	10	40	30	0	0	10	20	0
1-79	250	100	100	100	100	90	100	100	100	100
1-91	250	100	100	100	100	100	100	100	100	100
1-99	250	100	100	100	100	100	100	100	100	100
1-101	250	100	100	100	100	100	100	100	100	100
1-103	250	100	100	100	100	100	100	100	100	100
1-103 энантиомер А	250	100	100	100	100	100	100	100	100	100
1-103 энантиомер В	250	100	100	100	100	100	100	100	100	100
1-115	250	100	100	100	100	100	100	100	100	100
1-127	250	100	100	80	100	30	10	50	100	90
1-139	250	0	0	10	20	0	0	0	10	0
1-175	250	100	100	100	100	70	90	70	100	100
1-199	250	100	90	90	100	20	40	50	60	70
1-211	250	100	90	30	50	20	0	10	20	20
1-223	250	100	80	70	100	10	20	30	80	50
1-235	250	100	100	100	100	100	60	70	100	60
1-247	250	0	0	10	0	10	0	0	0	0
1-259	250	60	80	20	30	20	0	40	30	20
1-271	250	90	70	40	100	20	0	20	50	20
1-283	250	70	30	60	40	0	0	20	20	10
1-295	250	90	70	50	50	10	0	10	10	10
1-319	250	80	90	80	100	40	10	80	70	60
1-331	250	100	100	100	100	100	100	100	100	100
1-343	250	100	100	100	100	100	60	100	100	80
1-355	250	100	60	80	70	50	50	50	40	50
1-367	250	0	20	30	40	20	0	50	40	40
1-379	250	100	50	50	80	40	10	60	40	40
1-391	250	60	50	50	40	40	10	50	40	40
1-403	250	70	70	70	50	60	20	70	40	40
1-415	250	100	100	90	90	70	20	40	90	70
1-427	250	100	60	70	80	60	20	40	100	80
1-439	250	70	50	40	40	50	20	30	30	30
1-451	250	100	100	100	100	100	100	100	100	100
1-463	250	70	70	70	100	60	0	70	90	90
1-475	250	100	100	70	100	30	10	50	80	80
1-487	250	30	0	0	0	0	0	0	0	0
1-499	250	80	80	50	70	60	0	60	80	50
1-511	250	40	50	50	60	40	0	30	30	30
1-523	250	50	40	50	60	10	0	50	50	20
1-535	250	100	100	100	100	80	50	90	100	80
1-551	250	100	100	90	100	100	100	100	100	100

1-559	250	100	100	100	100	90	90	80	100	100
1-571	250	100	100	100	70	90	90	60	90	30
1-583	250	100	100	100	100	90	100	90	100	100
1-595	250	100	100	100	100	100	100	100	100	100
1-607	250	100	100	100	100	60	70	70	80	40
1-631	250	10	20	20	40	10	0	30	10	40
1-643	250	100	100	100	100	100	100	100	100	100
1-655	250	100	100	100	100	80	80	70	90	90
1-663	250	100	100	100	100	100	100	100	100	100
1-667	250	100	100	100	100	100	100	100	100	100
1-679	250	60	60	50	40	60	10	50	50	50
1-703	250	100	100	100	60	70	70	70	70	80
1-727	250	70	70	70	100	80	20	70	90	90
1-739	250	50	50	40	50	50	0	30	30	30
1-751	250	100	100	100	100	100	70	100	100	100
1-763	250	20	20	20	10	0	0	0	0	0
1-775	250	60	60	40	30	50	0	20	50	20
1-787	250	50	60	40	50	60	20	40	40	40
1-811	250	80	60	80	70	90	70	40	100	50
1-823	250	60	60	60	60	30	10	50	60	70
1-835										
2-451	250	40	50	70	30	70	20	50	40	30

ФОРМУЛА ИЗОБРЕТЕНИЯ

1. Соединение формулы (I) или его агрономически приемлемая соль:



(I),

- 5 где
- A выбран из группы, состоящей из C-R17 и азота;
- B выбран из группы, состоящей из C-R18 и азота;
- D выбран из группы, состоящей из C-R1, азота и N⁺-O⁻;
- X выбран из группы, состоящей из C-R19 и азота;
- 10 при условии, что не более чем два из A, B, D и X представляют собой азот, а B и X одновременно не представляют собой азот;
- Y выбран из группы, состоящей из C-H и азота;
- R1 выбран из группы, состоящей из водорода, галогена, циано, нитро, C₁-C₄алкила, C₁-C₄галогеналкила, C₃-C₆циклоалкила, C₁-C₄алкокси-C₁-C₆алкила, C₁-C₄галогеналкокси-C₁-C₆алкила, C₁-C₄алкокси, C₁-C₄галогеналкокси, C₁-C₄алкокси-C₁-C₄алкокси, C₁-C₄алкилсульфонилокси, C₁-C₄галогеналкилсульфонилокси, C₁-C₄алкилтио, C₁-C₄алкилсульфинила, C₁-C₄алкилсульфонила, C₁-C₄галогеналкилтио, C₁-C₄галогеналкилсульфинила, C₁-C₄галогеналкилсульфонила, amino, C₁-C₄алкиламино, ди(C₁-C₄алкил)амино, C₁-C₄алкилкарбониламино, C₁-C₄алкилкарбонил(C₁-C₄алкил)амино, C₁-C₄алкилоксикарбониламино, аминокарбониламино, C₁-C₄алкиламинокарбониламино, C₁-C₄алкилсульфониламино, C₁-C₄галогеналкилсульфониламино, CO₂R₉, CONR₁₀R₁₁, C(=Z)R₁₅;
- 15
- 20
- 25 R2 выбран из группы, состоящей из водорода, галогена, циано, нитро, C₁-C₄алкила, C₁-C₄галогеналкила, C₃-C₆циклоалкила, C₁-C₄алкокси-C₁-C₆алкила, C₁-C₄галогеналкокси-C₁-C₆алкила, C₁-C₄алкокси, C₁-C₄галогеналкокси, C₁-C₄алкокси-C₁-C₄алкокси, C₁-C₄алкилсульфонилокси, C₁-C₄галогеналкилсульфонилокси, C₁-C₄алкилтио, C₁-C₄алкилсульфинила, C₁-C₄алкилсульфонила, C₁-C₄галогеналкилтио, C₁-C₄галогеналкилсульфинила, C₁-C₄галогеналкилсульфонила, amino, C₁-C₄алкиламино,

ди(C₁-C₄алкил)амино, C₁-C₄алкилкарбониламино, C₁-C₄алкилкарбонил-(C₁-C₄алкил)амино, C₁-C₄алкилоксикарбониламино, аминокрбониламино, C₁-C₄алкиламинокарбониламино, C₁-C₄алкилсульфониламино, C₁-C₄галогеналкилсульфониламино, CO₂R₉, CONR₁₀R₁₁, C(=Z)R₁₅; или

5 R1 и R2 вместе с атомами углерода, к которым они присоединены, образуют 5- или 6-членное кольцо; или

R2 и R19 вместе с атомами углерода, к которым они присоединены, образуют 5- или 6-членное кольцо;

10 R3 выбран из группы, состоящей из водорода, галогена, C₁-C₄алкила, C₁-C₄галогеналкила, C₁-C₄алкокси, C₁-C₄галогеналкокси и C₁-C₄алкилсульфонила;

R4 выбран из группы, состоящей из водорода, галогена, циано, аминокрбонила, аминотиокрбонила, C₁-C₄алкила, C₁-C₄галогеналкила, C₁-C₄алкокси, C₁-C₄галогеналкокси и C₁-C₄алкилсульфонила;

15 каждый из R5 и R6 независимо выбран из группы, состоящей из водорода, циано, C₁-C₆алкила, C₁-C₆галогеналкила, C₁-C₄алкилсульфонила, CO₂R₉, CONR₁₀R₁₁ и CH₂OR₁₂;

каждый из R7 и R8 независимо выбран из группы, состоящей из водорода, циано, C₁-C₆алкила, C₁-C₆галогеналкила, C₁-C₄алкокси, C₁-C₄алкилсульфонила, C(=Z)R₁₅, CO₂R₉, CONR₁₀R₁₁ и CH₂OR₁₂;

20 Z выбран из группы, состоящей из кислорода, NOR₁₆ и NN(R₁₆)₂;

R9 выбран из группы, состоящей из водорода, C₁-C₁₀алкила, C₁-C₁₀галогеналкила, C₃-C₆алкенила, C₃-C₆галогеналкенила, C₃-C₆алкинила, C₁-C₄алкокси-C₁-C₆алкила, C₁-C₄галогеналкокси-C₁-C₆алкила, C₆-C₁₀арил-C₁-C₃алкила, C₆-C₁₀арил-C₁-C₃алкила, замещенного 1-4 группами R₁₃, гетероарил-C₁-C₃алкила и гетероарил-C₁-C₃алкила, замещенного 1-3 группами R₁₃;

R10 выбран из группы, состоящей из водорода, C₁-C₆алкила и SO₂R₁₄;

R11 выбран из группы, состоящей из водорода и C₁-C₆алкила; или

R10 и R11 вместе с атомом азота, к которому они присоединены, образуют 3-6-членное гетероциклическое кольцо, которое необязательно содержит атом кислорода;

30 R12 выбран из группы, состоящей из водорода, C₁-C₄алкила, C₁-C₄галогеналкила, C₁-C₄алкилсульфонила, C₁-C₄галогеналкилсульфонила, фенилсульфонила, фенилсульфонила, замещенного 1-2 группами R₁₃; C₁-C₄алкилкарбонила, C₁-C₄галогеналкилкарбонила, C₆-C₁₀арилкарбонила, C₆-C₁₀арилкарбонила, замещенного 1-4 группами R₁₃, гетероарилкарбонила,

гетероарилкарбонила, замещенного 1-3 группами R13, C₆-C₁₀арилC₁-C₃алкилкарбонила, C₆-C₁₀арилC₁-C₃алкилкарбонила, замещенного 1-4 группами R13, гетероарилC₁-C₃алкилкарбонила и гетероарилC₁-C₃алкилкарбонила, замещенного 1-3 группами R13;

каждая R13 независимо выбрана из группы, состоящей из галогена, C₁-C₄алкила, C₁-C₄галогеналкила, C₁-C₄алкокси, C₁-C₄галогеналкокси, циано и C₁-C₄алкилсульфонила;

R14 выбран из группы, состоящей из C₁-C₄алкила, C₁-C₄галогеналкила и C₁-C₄алкил(C₁-C₄алкил)амино;

R15 выбран из группы, состоящей из водорода, C₁-C₄алкила и C₁-C₄галогеналкила;

каждый R16 независимо выбран из группы, состоящей из водорода, C₁-C₄алкила, C₁-C₄галогеналкила и C₁-C₄алкоксикарбонил-C₁-C₄алкила;

R17 выбран из группы, состоящей из водорода, галогена, циано, нитро, C₁-C₄алкила, C₁-C₄галогеналкила, C₃-C₆циклоалкила, C₁-C₄алкокси-C₁-C₆алкила, C₁-C₄галогеналкокси-C₁-C₆алкила, C₁-C₄алкокси, C₁-C₄галогеналкокси, C₁-C₄алкокси-C₁-C₄алкокси, C₁-C₄алкилсульфонилокси, C₁-C₄галогеналкилсульфонилокси, C₁-C₄алкилтио, C₁-C₄алкилсульфинила, C₁-C₄алкилсульфонила, C₁-C₄галогеналкилтио, C₁-C₄галогеналкилсульфинила, C₁-C₄галогеналкилсульфонила, amino, C₁-C₄алкиламино, ди(C₁-C₄алкил)амино, C₁-C₄алкилкарбониламино, C₁-C₄алкилкарбонил-(C₁-C₄алкил)амино, C₁-C₄алкилоксикарбониламино, аминокарбониламино, C₁-C₄алкиламинокарбониламино, C₁-C₄алкилсульфониламино, C₁-C₄галогеналкилсульфониламино, CO₂R₉, CONR₁₀R₁₁, C(=Z)R₁₅;

R18 выбран из группы, состоящей из водорода, галогена, циано, нитро, C₁-C₄алкила, C₁-C₄галогеналкила, C₃-C₆циклоалкила, C₁-C₄алкокси-C₁-C₆алкила, C₁-C₄галогеналкокси-C₁-C₆алкила, C₁-C₄алкокси, C₁-C₄галогеналкокси, C₁-C₄алкокси-C₁-C₄алкокси, C₁-C₄алкилсульфонилокси, C₁-C₄галогеналкилсульфонилокси, C₁-C₄алкилтио, C₁-C₄алкилсульфинила, C₁-C₄алкилсульфонила, C₁-C₄галогеналкилтио, C₁-C₄галогеналкилсульфинила, C₁-C₄галогеналкилсульфонила, amino, C₁-C₄алкиламино, ди(C₁-C₄алкил)амино, C₁-C₄алкилкарбониламино, C₁-C₄алкилкарбонил-(C₁-C₄алкил)амино, C₁-C₄алкилоксикарбониламино, аминокарбониламино, C₁-C₄алкиламинокарбониламино, C₁-C₄алкилсульфониламино, C₁-C₄галогеналкилсульфониламино, CO₂R₉, CONR₁₀R₁₁, C(=Z)R₁₅;

R19 выбран из группы, состоящей из водорода, галогена, циано, нитро, C₁-C₄алкила, C₁-C₄галогеналкила, C₃-C₆циклоалкила, C₁-C₄алкокси-C₁-C₆алкила, C₁-

С₄галогеналкокси-С₁-С₆алкила, С₁-С₄алкокси, С₁-С₄галогеналкокси, С₁-С₄алкокси-С₁-С₄алкокси, С₁-С₄алкилсульфонилокси, С₁-С₄галогеналкилсульфонилокси, С₁-С₄алкилтио, С₁-С₄алкилсульфинила, С₁-С₄алкилсульфонила, С₁-С₄галогеналкилтио, С₁-С₄галогеналкилсульфинила, С₁-С₄галогеналкилсульфонила, amino, С₁-С₄алкиламино, ди(С₁-С₄алкил)амино, С₁-С₄алкилкарбониламино, С₁-С₄алкилкарбонил-(С₁-С₄алкил)амино, С₁-С₄алкилоксикарбониламино, аминокарбониламино, С₁-С₄алкиламинокарбониламино, С₁-С₄алкилсульфониламино, С₁-С₄галогеналкилсульфониламино, CO₂R₉, CONR₁₀R₁₁, C(=Z)R₁₅; и

при условии, что все из R₁, R₂, R₁₇, R₁₈ и R₁₉ одновременно не представляют собой водород.

2. Соединение по п. 1, в котором R₃ выбран из группы, состоящей из водорода, хлора и фтора.

3. Соединение по п. 1 или п. 2, в котором R₄ выбран из группы, состоящей из водорода, хлора, циано и аминотиокарбонила.

4. Соединение по любому из пп. 1-3, в котором R₅ и R₆ одновременно представляют собой водород.

5. Соединение по любому из пп. 1-4, в котором один из R₇ и R₈ представляет собой С₁-С₄алкил, а другой из R₇ и R₈ представляет собой CO₂R₉, где R₉ представляет собой С₁-С₄алкил.

6. Соединение по любому из пп. 1-5, в котором R₁₀ выбран из группы, состоящей из водорода и SO₂R₁₄, и R₁₁ представляет собой водород.

7. Соединение по любому из пп. 1-6, в котором Y представляет собой С-Н.

8. Соединение по любому из пп. 1-7, в котором А представляет собой азот, В представляет собой С-R₁₈, D представляет собой С-R₁, и X представляет собой С-R₁₉.

9. Соединение по любому из пп. 1-7, в котором А представляет собой С-
R17, В представляет собой азот, D представляет собой С-R1, и X представляет собой С-
R19.

5 10. Соединение по любому из пп. 1-7, в котором В представляет собой азот,
один из А и D представляет собой азот, и X представляет собой С-R19.

10 11. Соединение по любому из пп. 1-10, в котором R1 выбран из группы,
состоящей из водорода, галогена, С₁-С₄алкила, С₁-С₄галогеналкила, С₁-С₄алкокси, С₁-
С₄галогеналкокси.

15 12. Соединение по любому из пп. 1-11, в котором R2 выбран из группы,
состоящей из водорода, галогена, С₁-С₄алкила, С₁-С₄галогеналкила, С₁-С₄алкокси и С₁-
С₄галогеналкокси.

20 13. Соединение по любому из пп. 1-12, в котором R19 выбран из группы,
состоящей из водорода, галогена, С₁-С₂алкила, С₁-С₂галогеналкила, нитро, циано, С₁-
С₂алкилкарбонил-С₁-С₂алкила, С₁-С₂алкилсульфонила, С₁-С₂алкокси и С₁-
С₂галогеналкокси.

25 14. Соединение по любому из пп. 1-11, в котором R2 и R19 вместе с атомами
углерода, к которым они присоединены, образуют 5- или 6-членное кольцо, где 5- или
6-членное кольцо замещено 1-4 группами R20, при этом R20 выбран из группы,
состоящей из галогена, С₁-С₄алкила, С₁-С₄галогеналкила, С₁-С₄алкокси, С₁-
С₄галогеналкокси, циано и С₁-С₄алкилсульфонила.

30 15. Соединение по любому из пп. 1-11 и п. 14, в котором R2 и R19 вместе с
атомами углерода, к которым они присоединены, образуют насыщенное 5-членное
кольцо, содержащее один или два гетероатома, выбранных из группы азота, кислорода
и серы.

16. Соединение по любому из пп. 1-11 и п. 14, в котором R2 и R19 вместе с
атомами углерода, к которым они присоединены, образуют ненасыщенное 6-членное
кольцо, не содержащее гетероатомы.

17. Агрохимическая композиция, содержащая гербицидно эффективное количество соединения формулы (I) по любому из пп. 1-16 и агрохимически приемлемый разбавитель или носитель.

5

18. Способ осуществления контроля или предупреждения роста нежелательных растений, где гербицидно эффективное количество соединения формулы (I) по любому из пп. 1-16 или композиции по п. 17 применяют в отношении растений, их частей или места их произрастания.