



УКРАЇНА

(19) **UA** (11) **130745** (13) **C2**
(51) МПК (2026.01)
C07D 239/34 (2006.01)
A01N 43/54 (2006.01)
A01P 13/00

НАЦІОНАЛЬНИЙ ОРГАН
ІНТЕЛЕКТУАЛЬНОЇ ВЛАСНОСТІ
ДЕРЖАВНА ОРГАНІЗАЦІЯ
"УКРАЇНСЬКИЙ НАЦІОНАЛЬНИЙ
ОФІС ІНТЕЛЕКТУАЛЬНОЇ
ВЛАСНОСТІ ТА ІННОВАЦІЙ"

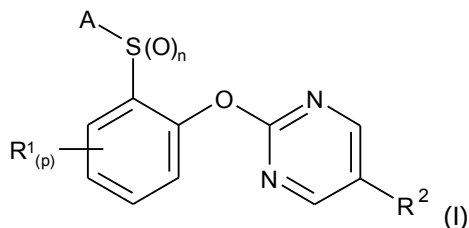
(12) ОПИС ДО ПАТЕНТУ НА ВИНАХІД

(21) Номер заявки:	а 2022 01254	(72) Винахідник(и):	Уолес Джеффрі Стівен (US), Тат Джозеф Ендрю (US), Інграм Катарін Мері (US)
(22) Дата подання заявки:	06.08.2020	(73) Володілець (володільці):	СІНГЕНТА КРОП ПРОТЕКШН АГ, Rosentalstrasse 67, 4058 Basel, Switzerland (CH)
(24) Дата, з якої є чинними права інтелектуальної власності:	07.05.2026	(74) Представник:	Петров Андрій Володимирович, реєстр. №139
(31) Номер попередньої заявки відповідно до Паризької конвенції:	1911429.7	(56) Перелік документів, взятих до уваги експертизою:	WO 2017/011288 A1, 19.01.2017 WO 2015/089003 A1, 18.06.2015 DE 10256354 A1, 18.06.2003
(32) Дата подання попередньої заявки відповідно до Паризької конвенції:	09.08.2019		
(33) Код держави-учасниці Паризької конвенції, до якої подано попередню заявку:	GB		
(41) Публікація відомостей про заявку:	18.05.2022, Бюл.№ 20		
(46) Публікація відомостей про державну реєстрацію:	06.05.2026, Бюл.№ 18		
(86) Номер та дата подання міжнародної заявки, поданої відповідно до Договору РСТ	PCT/EP2020/072168, 06.08.2020		

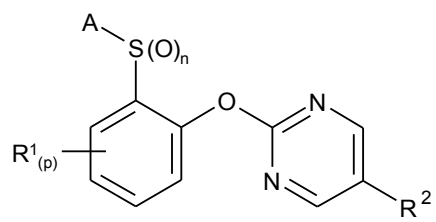
(54) 2-ФЕНОКСИПІРИМІДИНОВІ ПОХІДНІ ЯК ГЕРБІЦИДНІ СПОЛУКИ

(57) Реферат:

Винахід стосується сполуки формули (I), де А, R¹, R², n і р визначені у даному документі. Винахід додатково стосується гербіцидних композицій, які містять сполуку формули (I), і застосування сполуки формули (I) для боротьби з бур'янами, зокрема, серед сільськогосподарських культур корисних рослин.



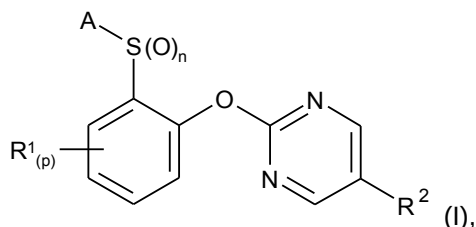
UA 130745 C2



Даний винахід стосується нових гербіцидних сполук, способів їх одержання, гербіцидних композицій, що містять нові сполуки, та їх застосування для здійснення контролю бур'янів, зокрема серед сільськогосподарських культур корисних рослин, або для пригнічення росту рослин.

У WO2017/011288 розкриті різні прості арилоксипіримідинільні етери та їх застосування як гербіцидів. Даний винахід стосується нових простих арилоксипіримідинільних тіоетерів, які демонструють покращені властивості порівняно з відомими сполуками, які відносяться до етерів.

Таким чином, згідно з даним винаходом передбачена сполука формули (I):



де

A вибраний із групи, яка складається з C₃-C₈алкілу, C₃-C₈алкенілу, C₃-C₈алкінілу, C₃-C₈галогеналкілу, C₃-C₈галогеналкенілу, C₃-C₈галогеналкінілу, C₁-C₄алкокси-C₁-C₃алкіл-, C₁-C₄галогеналкокси-C₁-C₃алкіл-, C₁-C₄алкокси-C₁-C₃галогеналкіл- і -(CH₂)_mR³;

R¹ незалежно вибраний із групи, яка складається з галогену, -CN, нітро, C₁-C₄алкіл-, C₂-C₄алкеніл-, C₂-C₄алкініл-, C₁-C₄галогеналкіл-, C₁-C₄алкокси-, C₁-C₄галогеналкокси-, -S(O)_nC₁-C₄алкілу і C₃-C₆циклоалкіл-;

R² вибраний із групи, яка складається з галогену, -CN, нітро, C₁-C₄алкілу, C₂-C₄алкеніл-, C₂-C₄алкініл-, C₁-C₄галогеналкіл-, C₁-C₄алкокси-, C₁-C₄галогеналкокси-, -S(O)_nC₁-C₄алкілу і C₃-C₆циклоалкіл-;

m дорівнює 1, 2, 3 або 4;

n дорівнює 0, 1 або 2;

p дорівнює 0, 1 або 2;

R³ вибраний з C₃-C₆циклоалкілу, фенілу і 5- або 6-членного гетероарилу, який містить від 1 до 4 гетероатомів, кожний з яких незалежно вибраний із групи, яка складається з кисню, азоту і сірки, і при цьому вказані фенільна або гетероарильна групи необов'язково заміщені одним, двома або трьома замісниками, незалежно вибраними із групи, яка складається з галогену, ціано, C₁-C₄алкілу, C₁-C₄галогеналкілу, C₁-C₄алкокси і C₁-C₄галогеналкокси;

або її прийнята з погляду сільського господарства сіль.

Алکیلні групи (наприклад, C₁-C₆алкіл) включають, наприклад, метил (Me, CH₃), етил (Et, C₂H₅), н-пропіл (н-Pr), ізопропіл (ізо-Pr), н-бутил (н-Bu), ізобутил (ізо-Bu), втор-бутил (втор-Bu) та трет-бутил (трет-Bu).

Алкенільні та алкінільні фрагменти можуть бути представлені у формі прямих або розгалужених ланцюгів, і алкенільні фрагменти, якщо необхідно, можуть характеризуватись або (E)-, або (Z)-конфігурацією. Приклади являють собою вініл, аліл та пропаргіл. Алкенільні та алкінільні фрагменти можуть містити один або декілька подвійних та/або потрійних зв'язків у будь-якій комбінації.

Галоген (або галогенід) охоплює фтор, хлор, бром або йод. Те ж саме, відповідно, є застосовним до галогену в контексті інших визначень, таких як галогеналкіл.

Галогеналکیلні групи (наприклад, C₁-C₆галогеналкіл) являють собою, наприклад, фторметил, дифторметил, трифторметил, хлорметил, дихлорметил, трихлорметил, 2,2,2-трифторетил, 2-фторетил, 2-хлоретил, пентафторетил, 1,1-дифтор-2,2,2-трихлоретил, 2,2,3,3-тетрафторетил та 2,2,2-трихлоретил, гептафтор-н-пропіл та перфтор-н-гексил.

Алкоксигрупи (наприклад, C₁-C₄алкокси-) являють собою, наприклад, метокси, етокси, пропокси, ізопропокси, н-бутокс, ізобутокс, втор-бутокс або трет-бутокс, переважно метокси та етокси.

Алкоксиалکیلні групи (наприклад, C₁-C₄алкокси-C₁-C₃алкіл-) включають, наприклад, метоксиметил, метоксиетил, етоксиметил, етоксиетил, н-пропоксиметил, н-пропоксиетил, ізопропоксиметил або ізопропоксиетил.

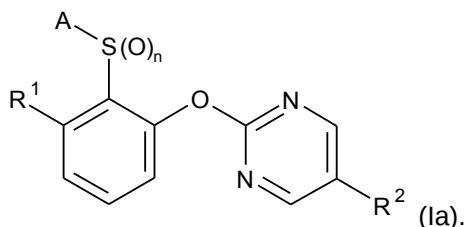
Циклоалکیلні групи (наприклад, C₃-C₆циклоалкіл-) включають, наприклад, циклопропіл (с-пропіл, с-Pr), циклобутил (с-бутил, с-Bu), циклопентил (с-пентил) та циклогексил (с-гексил) і можуть бути заміщеними або незаміщеними, як вказано.

C₁-C₆алкіл-S-(алкілтіо) являє собою, наприклад, метилтіо, етилтіо, пропілтіо, ізопропілтіо, н-бутилтіо, ізобутилтіо, втор-бутилтіо або трет-бутилтіо, переважно метилтіо або етилтіо.

C₁-C₆алкіл-S(O)-(алкілсульфініл) являє собою, наприклад, метилсульфініл, етилсульфініл, пропілсульфініл, ізопропілсульфініл, н-бутилсульфініл, ізобутилсульфініл, втор-бутилсульфініл або трет-бутилсульфініл, переважно метилсульфініл або етилсульфініл.

C₁-C₆алкіл-S(O)₂-(алкілсульфоніл) являє собою, наприклад, метилсульфоніл, етилсульфоніл, пропілсульфоніл, ізопропілсульфоніл, н-бутилсульфоніл, ізобутилсульфоніл, втор-бутилсульфоніл або трет-бутилсульфоніл, переважно метилсульфоніл або етилсульфоніл.

В одному варіанті здійснення даного винаходу передбачена сполука формули (Ia),



В одному варіанті здійснення даного винаходу передбачена сполука формули (I) або формули (Ia), де n дорівнює 0.

В одному варіанті здійснення даного винаходу передбачена сполука формули (I) або формули (Ia), де n дорівнює 1.

В одному варіанті здійснення даного винаходу передбачена сполука формули (I) або формули (Ia), де n дорівнює 2.

В іншому варіанті здійснення даного винаходу передбачена сполука формули (I) або (Ia), де A вибраний із групи, яка складається з C₃-C₈алкілу, C₃-C₈алкенілу, C₃-C₈алкінілу, C₃-C₈галогеналкілу, C₃-C₈галогеналкенілу, C₃-C₈галогеналкінілу, C₁-C₄алкокси-C₁-C₃алкіл-, C₁-C₄галогеналкокси-C₁-C₃алкіл- і C₁-C₄алкокси-C₁-C₃галогеналкіл-. У більш переважному варіанті здійснення даного винаходу передбачена сполука формули (I) або формули (Ia), де A вибраний із групи, яка складається з C₃-C₈алкілу, C₃-C₈галогеналкілу, C₃-C₈галогеналкенілу, C₃-C₈галогеналкінілу і C₁-C₄галогеналкокси-C₁-C₃алкіл-. У додатковому переважному варіанті здійснення A вибраний із групи, яка складається з 3,3,3-трифторпроп-1-ілу, 1-бутилу, 2-пентилу, 4,4,4-трифторбут-1-ілу, E-CH₂CH=CHCl, бензилу, -CH₂(4-Cl-C₆H₄), -CH₂(4-CN-C₆H₄) і CH₂(4-тіазоліл).

В одному варіанті здійснення даного винаходу передбачена сполука формули (I) або формули (Ia), де R¹ являє собою галоген (наприклад, фтор або хлор) або -CN.

В іншому варіанті здійснення передбачена сполука формули (I) або формули (Ia), де R² вибраний із групи, яка складається з галогену, C₁-C₄алкілу, C₂-C₄алкенілу, C₂-C₄алкінілу, C₁-C₄галогеналкілу, C₁-C₄алкокси і C₁-C₄галогеналкокси. В переважному варіанті здійснення R² являє собою галоген, переважно хлор.

Сполуки формули (I) згідно з даним винаходом можна застосовувати окремо як гербіциди, але зазвичай їх складають у гербіцидні композиції із застосуванням допоміжних засобів для складання, таких як носії, розчинники та поверхнево-активні засоби (SAA). Таким чином, у даному винаході додатково передбачена гербіцидна композиція, що містить гербіцидну сполуку за даним винаходом і прийнятний з погляду сільського господарства допоміжний засіб для складання. Композиція може бути представлена у формі концентратів, які розводять перед застосуванням, хоча також можна одержувати готові до застосування композиції. Кінцеве розведення зазвичай здійснюють із використанням води, але його також можна виконувати із застосуванням замість води або додатково до води, наприклад, рідких добрив, поживних мікроелементів, біологічних організмів, масла або розчинників.

Як зазначено вище, сполуки за даним винаходом можуть містити асиметричний центр. Таким чином, сполука за даним винаходом може бути присутня в композиції у вигляді рацемічної суміші двох енантіомерів. Як альтернатива, сполука за даним винаходом може бути присутня в енантіомерно збагаченій формі.

Гербіцидні композиції зазвичай містять від 0,1 до 99 % за вагою, зокрема від 0,1 до 95 % за вагою, сполук формули I і від 1 до 99,9 % за вагою допоміжного засобу для складання, який переважно включає від 0 до 25 % за вагою поверхнево-активної речовини.

Композиції можна вибирати з ряду типів складів. Вони включають емульсійний концентрат (EC), суспензійний концентрат (SC), суспензію (SE), капсульну суспензію (CS), гранулу, яка диспергується у воді (WG), гранулу, які емульгуються (EG), емульсію типу "вода в маслі" (EO),

емульсію типу "масло у воді" (EW), мікроемульсію (ME), масляну дисперсію (OD), рідкий склад, який змішується з маслом (OF), рідину, яка змішується з маслом (OL), розчинний концентрат (SL), суспензію для наднизькооб'ємного застосування (SU), рідину для наднизькооб'ємного застосування (UL), технічний концентрат (TK), концентрат, який диспергується (DC), розчинний порошок (SP), змочуваний порошок (WP) і розчинну гранулу (SG). Вибраний тип складу у будь-якому випадку буде залежати від конкретного передбачуваного призначення і фізичних, хімічних та біологічних властивостей сполуки формули (I).

Розчинні порошки (SP) можна одержувати шляхом змішування сполуки формули (I) з однією або декількома водорозчинними неорганічними солями (такими як бікарбонат натрію, карбонат натрію або сульфат магнію) або з однією або декількома водорозчинними органічними твердими речовинами (такими як полісахарид) і необов'язково з одним або декількома змочувальними засобами, одним або декількома диспергувальними засобами або сумішшю вказаних засобів для поліпшення диспергованості/розчинності у воді. Потім суміш подрібнюють до тонкодисперсного порошку. Подібні композиції також можна гранулювати з утворенням водорозчинних гранул (SG).

Змочувані порошки (WP) можна одержувати шляхом змішування сполуки формули (I) з одним або декількома твердими розріджувачами або носіями, одним або декількома змочувальними засобами та переважно одним або декількома диспергувальними засобами, а також необов'язково з одним або декількома суспендувальними засобами для полегшення диспергування в рідинах. Потім суміш подрібнюють до тонкодисперсного порошку. Подібні композиції також можна гранулювати з утворенням гранул, що диспергуються у воді (WG).

Гранули (GR) можуть бути утворені або шляхом гранулювання суміші сполуки формули (I) та одного або декількох порошкоподібних твердих розріджувачів або носіїв, або з попередньо утворених порожніх гранул за допомогою абсорбції сполуки формули (I) (або її розчину в придатному засобі) у пористому гранульованому матеріалі (такому як пемза, атапульгітові глини, фулерова земля, кізельгур, види діатомової землі або подрібнені кукурудзяні качани) або за допомогою адсорбції сполуки формули (I) (або її розчину в придатному засобі) на твердому зернистому матеріалі (такому як піски, силікати, мінеральні карбонати, сульфати або фосфати) та сушіння, якщо необхідно. Засоби, які зазвичай застосовують для полегшення абсорбції або адсорбції, включають розчинники (такі як аліфатичні та ароматичні нафтові розчинники, спирти, етери, кетони та естери) та засоби, що сприяють прилипанню (такі як полівінілацетати, полівінілові спирти, декстрини, цукри та рослинні олії). У гранули також можна включати одну або декілька інших добавок (наприклад, емульгувальний засіб, змочувальний засіб або диспергувальний засіб).

Дисперговувані концентрати (DC) можна одержувати шляхом розчинення сполуки формули (I) у воді або органічному розчиннику, такому як кетон, спирт або гліколевий етер. Дані розчини можуть містити поверхнево-активний засіб (наприклад, для поліпшення розбавлення водою або попередження кристалізації в резервуарі обприскувача).

Емульговувані концентрати (EC) або емульсії типу "масло у воді" (EW) можна одержувати шляхом розчинення сполуки формули (I) в органічному розчиннику (який необов'язково містить один або декілька змочувальних засобів, один або декілька емульгувальних засобів або суміш вказаних засобів). Придатні органічні розчинники для застосування в EC включають ароматичні вуглеводні (такі як алкілбензоли або алкілнафталіни, прикладами яких є SOLVESSO 100, SOLVESSO 150 і SOLVESSO 200; SOLVESSO являє собою зареєстровану торговельну марку), кетони (такі як циклогексанон або метилциклогексанон) і спирти (такі як бензиловий спирт, фурфуріловий спирт або бутанол), N-алкілпіролідони (такі як N-метилпіролідон або N-октилпіролідон), диметиламід жирних кислот (такі як диметиламід C₈-C₁₀жирної кислоти) та хлоровані вуглеводні. EC-продукт може самовільно емульгуватися під час додавання у воду з одержанням емульсії з достатньою стабільністю, що дозволяє наносити її розпиленням за допомогою відповідного обладнання.

Одержання EW включає одержання сполуки формули (I) або у вигляді рідини (якщо вона не є рідиною за кімнатної температури, її можна розплавити за помірної температури, зазвичай нижче 70 °C), або у вигляді розчину (шляхом розчинення її у відповідному розчиннику), а потім емульгування одержаної рідини або розчину у воді, що містить один або декілька SAA, за умов високого зусилля зсуву з одержанням емульсії. Придатні розчинники для застосування в EW включають рослинні олії, хлоровані вуглеводні (такі як хлорбензоли), ароматичні розчинники (такі як алкілбензоли або алкілнафталіни) та інші відповідні органічні розчинники, які характеризуються низькою розчинністю у воді.

Мікроемульсії (ME) можна одержувати шляхом змішування води із сумішшю одного або декількох розчинників з одним або декількома SAA зі спонтанним утворенням термодинамічно

стабільного ізотропного рідкого складу. Сполука формули (I) є наявною спочатку або у воді, або у суміші розчинник/SAA. Придатні розчинники для застосування в МЕ включають розчинники, що описані в даному документі вище, для застосування в ЕС або в EW. МЕ може являти собою систему або типу "масло у воді", або типу "вода в маслі" (при цьому те, яка система є наявною, може бути визначене шляхом вимірювань електричної провідності) і може бути придатною для змішування водорозчинних та розчинних у маслі пестицидів в одному складі. МЕ є придатною для розведення у воді, при цьому вона або залишається у вигляді мікроемульсії, або утворює звичайну емульсію типу "масло у воді".

Суспензійні концентрати (SC) можуть містити водні або неводні суспензії тонкоподрібнених нерозчинних твердих частинок сполуки формули (I). SC можна одержувати шляхом розмелювання в кульовому або бісерному млині твердої сполуки формули (I) у придатному середовищі необов'язково з одним або декількома диспергувальними засобами з одержанням тонкодисперсної суспензії сполуки. У композицію можна включати один або декілька змочувальних засобів, а також можна включати суспендувальний засіб для зниження швидкості осідання частинок. Як альтернатива, сполуку формули (I) можна піддавати сухому розмелюванню та додавати у воду, що містить засоби, описані в даному документі вище, з одержанням необхідного кінцевого продукту.

Аерозольні склади містять сполуку формули (I) та придатний газ-витискувач (наприклад, н-бутан). Сполуку формули (I) також можна розчиняти або диспергувати у придатному середовищі (наприклад, у воді або в рідині, що змішується з водою, такий як н-пропанол) з одержанням композицій для застосування в насосах, що не перебувають під тиском, для обприскування з ручним керуванням.

Капсульні суспензії (CS) можна одержувати аналогічно одержанню складів EW, але з додатковою стадією полімеризації з одержанням водної дисперсії крапель масла, в якій кожна крапля масла інкапсульована в полімерній оболонці та містить сполуку формули (I) і необов'язково її носій або розріджувач. Полімерну оболонку можна одержати або за допомогою здійснення реакції міжфазної поліконденсації, або за допомогою процедури коацервації. Композиції можуть забезпечувати контрольоване вивільнення сполуки формули (I), і їх можна застосовувати для обробки насіння. Сполука формули (I) також може бути складена у біорозкладній полімерній матриці із забезпеченням повільного контрольованого вивільнення сполуки.

Композиція може містити одну або декілька добавок для поліпшення біологічної дії композиції, наприклад, шляхом поліпшення змочування, утримання на поверхнях або розподілу по поверхнях; стійкості до змивання дощем з оброблених поверхонь або поглинання чи рухливості сполуки формули (I). Такі добавки включають поверхнево-активні засоби (SAA), добавки для обприскування на основі масел, наприклад, деякі мінеральні масла або природні рослинні масла (такі як соєва і ріпакова олія), модифіковані рослинні олії, такі як метильована рапсова олія (MRSO), та їх суміші з іншими біопідсилювальними допоміжними засобами (інгредієнтами, які можуть сприяти дії сполуки формули (I) або модифікувати її).

Змочувальні засоби, диспергувальні засоби й емульгувальні засоби можуть являти собою SAA катіонного, аніонного, амфотерного або неіоногенного типу.

Придатні SAA катіонного типу включають сполуки четвертинного амонію (наприклад, бромід цетилтриметиламонію), імідазоліни та солі амінів.

Придатні аніонні SAA включають солі лужних металів жирних кислот, солі аліфатичних моноестерів сірчаної кислоти (наприклад, лаурилсульфат натрію), солі сульфонованих ароматичних сполук (наприклад, додецилбензолсульфонат натрію, додецилбензолсульфонат кальцію, бутілнафталін сульфонат і суміші діізопропіл- та триізопропілнафталінсульфонатів натрію), етерсульфати, етерсульфати спиртів (наприклад, лаурет-3-сульфат натрію), етеркарбоксилати (наприклад, лаурет-3-карбоксилат натрію), естери фосфорної кислоти (продукти реакції між одним або декількома жирними спиртами та фосфорною кислотою (переважно моноестери) або пентаоксидом фосфору (переважно діестери), наприклад, під час реакції між лауриловим спиртом і тетрафосфорною кислотою; додатково ці продукти можуть бути етоксильованими), сульфосукцинамат, парафін- або олефінсульфонати, таурати, лігносульфонати та фосфати/сульфати тристирилфенолів.

Придатні SAA амфотерного типу включають бетаїни, пропіонати і гліцинати.

Придатні SAA неіоногенного типу включають продукти конденсації алкіленоксидів, таких як етиленоксид, пропіленоксид, бутіленоксид або їх суміші, із жирними спиртами (такими як олеїловий спирт або цетиловий спирт) або з алкілфенолами (такими як октилфенол, нонілфенол або октилкрезол); неповні естери, одержані з довголанцюгових жирних кислот або ангідридів гекситу; продукти конденсації вказаних неповних естерів з етиленоксидом; блок-

співполімери (що включають етиленоксид і пропіленоксид); алканоламіди; естери з простою структурою (наприклад, естери жирної кислоти та поліетиленгліколю); аміноксиди (наприклад, лаурилдиметиламіноксид); лецитини і сорбітани та їх естери, алкілполіглікозиди і тристерилфеноли.

5 Придатні суспендувальні засоби включають гідрофільні колоїди (такі як полісахариди, полівінілпіролідон або карбоксиметилцелюлоза натрію) та глини, що набухають (такі як бентоніт або атапульгіт).

Гербіцидні сполуки за даним винаходом також можна застосовувати в сумішах з одним або декількома додатковими гербіцидами та/або регуляторами росту рослин. Приклади таких додаткових гербіцидів або регуляторів росту рослин включають ацетохлор, ацифлуорфен (включаючи ацифлуорфен-натрій), аклоніфен, аметрин, амікарбазон, амінопіралід, амініотриазол, атразин, бенсульфурон (включаючи бенсульфурон-метил), бентазон, біциклопірон, біланафос, біспірибак-натрій, бікслозон, бромацил, бромоксиніл, бутахлор, бутафенацил, карфентразон (включаючи карфентразон-етил), клорансулам (включаючи клорансулам-метил), хлоримурон (включаючи хлоримурон-етил), хлортолурон, хлорсульфурон, цинметилін, клацифос, клетодим, клодинафоп (включаючи клодинафоп-пропаргіл), кломазон, клопіралід, циклопіраніл, циклопіриморат, циклосульфамурон, цигалофоп (включаючи цигалофоп-бутил), 2,4-D (включаючи її холінову сіль та 2-етилгексильовий естер), 2,4-DB, десмедифам, дикамбу (включаючи її алюмінієву, амінопропілову, біс-амінопропілметильову, холінову, дихлорпропілову, диглікольамінову, диметиламінову, диметиламонієву, калієву та натрієву солі), диклосулам, дифлуфенікан, дифлуфензопір, диметахлор, диметенамід-П, дибромід диквату, діурон, еталфлуралін, етофумезат, феноксапроп (включаючи феноксапроп-П-етил), феноксасульфоп, фенквінотрион, фентразамід, флазасульфурон, флорасулам, флорпірауксифен (включаючи флорпірауксифен-бензил), флуазифоп (включаючи флуазифоп-П-бутил), флукарбазон (включаючи флукарбазон-натрій), флуфенацет, флуметсулам, флуміоксазин, флупірсульфурон (включаючи флупірсульфурон-метил-натрій), флуороксипір (включаючи флуороксипір-мептил), фомесафен, форамсульфурон, глюфосинат (включаючи його амонієву сіль), гліфосат (включаючи його діамонієву, ізопропіламонієву та калієву солі), галауксифен (включаючи галауксифен-метил), галоксифоп (включаючи галоксифоп-метил), гексазион, гідантоцидин, імазамокс, імазапін, імазапін, імазетапін, індазифлам, йодосульфурон (включаючи йодосульфурон-метил-натрій), іофенсульфурон (включаючи іофенсульфурон-натрій), іоксиніл, ізопротурон, ізоксафлутол, ланкотрион, МСРА, МСРВ, мекопроп-П, мезосульфурон (включаючи мезосульфурон-метил), мезотрион, метамітрон, метазакхлор, метіозолін, метолахлор, метосулам, метрибузин, метсульфурон, напропамід, нікосульфурон, норфлуразон, оксадіазон, оксасульфурон, оксифлуорфен, дихлорид параквату, пендиметалін, пеносулам, фенмедифам, піхлорам, піноксаден, претилахлор, примісульфурон-метил, пропаніл, пропаквізафоп, пропірисульфурон, пропізамід, просульфокарб, просульфуфурон, піраклоніл, пірафлуфен (включаючи пірафлуфен-етил), пірасульфотол, піридат, пірифталід, піримісульфан, піроксасульфоп, піроксулам, квінклорак, квінмерак, квізалофоп (включаючи квізалофоп-П-етил та квізалофоп-П-тефурил), римсульфурон, сафлуфенацил, сетоксидим, симазин, С-метолахлор, сульфентразон, сульфосульфурон, тебутіурон, тефурилтрион, темботрион, тербутилазин, тербутрин, тіенкарбазон, тифенсульфурон, тіафенацил, толпіралат, топрамезон, тралкоксидим, триафамон, триалат, триасульфурон, трибенурон (включаючи трибенурон-метил), трихлорпін, трифлорисульфурон (включаючи трифлорисульфурон-натрій), трифлудимоксазин, трифлуралін, трифлусульфурон, 4-гідрокси-1-метокси-5-метил-3-[4-(трифторметил)-2-піридил]імідазолідин-2-он, 4-гідрокси-1,5-диметил-3-[4-(трифторметил)-2-піридил]імідазолідин-2-он, 5-етокси-4-гідрокси-1-метил-3-[4-(трифторметил)-2-піридил]імідазолідин-2-он, 4-гідрокси-1-метил-3-[4-(трифторметил)-2-піридил]імідазолідин-2-он, 4-гідрокси-1,5-диметил-3-[1-метил-5-(трифторметил)піразол-3-іл]імідазолідин-2-он, (4R)1-(5-трет-бутилізоксазол-3-іл)-4-етокси-5-гідрокси-3-метилімідазолідин-2-он, 3-[2-(3,4-диметоксифеніл)-6-метил-3-оксопіридазин-4-карбоніл]біцикло[3.2.1]октан-2,4-діон, 2-[2-(3,4-диметоксифеніл)-6-метил-3-оксопіридазин-4-карбоніл]-5-метилциклогексан-1,3-діон, 2-[2-(3,4-диметоксифеніл)-6-метил-3-оксопіридазин-4-карбоніл]циклогексан-1,3-діон, 2-[2-(3,4-диметоксифеніл)-6-метил-3-оксопіридазин-4-карбоніл]-5,5-диметилциклогексан-1,3-діон, 6-[2-(3,4-диметоксифеніл)-6-метил-3-оксопіридазин-4-карбоніл]-2,2,4,4-тетраметилциклогексан-1,3,5-трион, 2-[2-(3,4-диметоксифеніл)-6-метил-3-оксопіридазин-4-карбоніл]-5-етилциклогексан-1,3-діон, 2-[2-(3,4-диметоксифеніл)-6-метил-3-оксопіридазин-4-карбоніл]-4,4,6,6-тетраметилциклогексан-1,3-діон, 2-[6-циклопропіл-2-(3,4-диметоксифеніл)-3-оксопіридазин-4-карбоніл]-5-метилциклогексан-1,3-діон, 3-[6-циклопропіл-2-(3,4-диметоксифеніл)-3-оксопіридазин-4-карбоніл]біцикло[3.2.1]октан-2,4-діон, 2-[6-циклопропіл-2-(3,4-диметоксифеніл)-

3-оксопіридазин-4-карбоніл]-5,5-диметилциклогексан-1,3-діон, 6-[6-циклопропіл-2-(3,4-диметоксифеніл)-3-оксопіридазин-4-карбоніл]-2,2,4,4-тетраметилциклогексан-1,3,5-трион, 2-[6-циклопропіл-2-(3,4-диметоксифеніл)-3-оксопіридазин-4-карбоніл]циклогексан-1,3-діон, 4-[2-(3,4-диметоксифеніл)-6-метил-3-оксопіридазин-4-карбоніл]-2,2,6,6-тетраметилтетрагідропіран-3,5-діон та 4-[6-циклопропіл-2-(3,4-диметоксифеніл)-3-оксопіридазин-4-карбоніл]-2,2,6,6-тетраметилтетрагідропіран-3,5-діон.

Партнери по змішуванню для сполуки формули (I) також можуть бути представлені у формі естерів або солей, як зазначається, наприклад, у The Pesticide Manual, Sixteenth Edition, British Crop Protection Council, 2012.

Сполуку формули (I) також можна застосовувати в сумішах з іншими агрохімічними засобами, такими як фунгіциди, нематодциди або інсектициди, приклади яких наведені в The Pesticide Manual.

Співвідношення в суміші сполуки формули (I) і змішуваного партнера переважно становить від 1:100 до 1000:1.

Суміші переважно можна застосовувати у вказаних вище складах (у цьому разі "активний інгредієнт" стосується відповідної суміші сполуки формули (I) зі змішуваним партнером).

Сполуки або суміші за даним винаходом також можна застосовувати в комбінації з одним або декількома антидотами гербіцидів. Приклади таких антидотів включають беноксакор, клоквінтосет (включаючи клоквінтосет-мексил), ципросульфамід, дихлормід, фенхлоразол (включаючи фенхлоразол-етил), фенклорим, флуксофенім, фурилазол, ізоксадифен (включаючи ізоксадифен-етил), мефенпір (включаючи мефенпір-діетил), меткаміфен та оксабетриніл.

Особливо переважними є суміші сполуки формули (I) із ципросульфамідом, ізоксадифен-етилом, клоквінтосет-мексилом та/або N-(2-метоксибензоїл)-4-[(метиламінокарбоніл)аміно]бензолсульфонамідом.

Антидоти сполуки формули (I) також можуть бути представлені у формі естерів або солей, як зазначається, наприклад, у The Pesticide Manual, 16th Edition (BCPC), 2012. Посилання на клоквінтосет-мексил також стосується його літєвої, натрієвої, калієвої, кальцієвої, магнієвої, алюмінієвої, залізної, амонієвої, четвертинної амонієвої, сульфонієвої або фосфонієвої солі, як розкрито у WO 02/34048.

Співвідношення у суміші сполуки формули (I) та антидоту переважно становить від 100:1 до 1:10, зокрема від 20:1 до 1:1.

У даному винаході, крім того, додатково передбачений спосіб контролю бур'янів у місці зростання, при цьому вказаний спосіб включає застосування щодо місця зростання достатньої для контролю бур'янів кількості композиції, яка містить сполуку формули (I). Крім того, даний винахід може додатково передбачати спосіб вибіркового контролю бур'янів у місці зростання культурних рослин та бур'янів, де спосіб включає застосування щодо місця зростання достатньої для контролю бур'янів кількості композиції згідно з даним винаходом. "Контроль" означає знищення, зменшення чи вповільнення росту або попередження чи зниження ступеню проростання. Треба відзначити, що сполуки за даним винаходом демонструють набагато покращену селективність порівняно з відомими структурно аналогічними сполуками. Зазвичай рослинами, що підлягають контролю, є небажані рослини (бур'яни). "Місце зростання" означає територію, на якій рослини зростають або будуть зростати. Застосування можна здійснювати щодо місця зростання до появи сходів і/або після появи сходів культурної рослини. Деякі культурні рослини можуть мати природну витривалість щодо гербіцидних ефектів сполук формули (I). Переважні культурні рослини включають маїс, пшеницю, ячмінь і рис.

Норми застосування сполук формули I можуть змінюватися в широких межах і залежать від властивостей ґрунту, способу застосування (до або після появи сходів; протравлювання насіння; застосування щодо борозни для насіння; застосування у випадку безорної обробки тощо), культурної рослини, бур'яну(бур'янів), що підлягає(підлягають) контролю, переважних кліматичних умов та інших факторів, що визначаються способом застосування, часом застосування та цільовою сільськогосподарською культурою. Сполуки формули I за даним винаходом зазвичай застосовують за норми від 10 до 2500 г/га, зокрема від 25 до 1000 г/га, більш конкретно від 25 до 250 г/га.

Застосування зазвичай здійснюють шляхом розпилювання композиції, зазвичай за допомогою встановленого на тракторі обприскувача для великих площ, але також можна застосовувати й інші способи, такі як розпорошування (для порошків), краплинний полив або зрошення.

Слід розуміти, що культурні рослини також включають ті культурні рослини, яким була надана витривалість до інших гербіцидів або класів гербіцидів (наприклад, інгібіторів ALS, GS,

EPSPS, PPO, HPPD, PDS і ACCази) за допомогою традиційних способів селекції або за допомогою генної інженерії. Прикладом сільськогосподарської культури, якій надали витривалості щодо імідазолінонів, наприклад, імазамоксу, за допомогою традиційних способів селекції, є капуста польова Clearfield® (канола). Приклади сільськогосподарських культур, яким надали витривалості щодо гербіцидів за допомогою способів генної інженерії, включають, наприклад, сорти маїсу, стійкі щодо гліфосату та глюфосинату, комерційно доступні під торговельними назвами RoundupReady® та LibertyLink®.

Під культурними рослинами також слід розуміти ті, яким за допомогою способів генної інженерії була надана стійкість до шкідливих комах, наприклад Bt-маїс (стійкий до метелика кукурудзяного), Bt-бавовник (стійкий до довгоносіка бавовняного), а також різновиди Bt-картоплі (стійкі до колорадського жука). Прикладами Bt-маїсу є гібриди Bt-маїсу 176 NK® (Syngenta Seeds). Токсин Bt являє собою білок, який у природі утворюють ґрунтові бактерії *Bacillus thuringiensis*. Приклади токсинів або трансгенних рослин, здатних синтезувати такі токсини, описані в EP-A-451878, EP-A-374753, WO 93/07278, WO 95/34656, WO 03/052073 та EP-A-427529. Прикладами трансгенних рослин, які містять один або декілька генів, що відповідають за стійкість щодо комах, та експресують один або декілька токсинів, є KnockOut (маїс), Yield Gard (маїс), NuCOTIN33B (бавовник), Bollgard (бавовник), NewLeaf® (різновиди картоплі), NatureGard та Protexcta. Рослинні культури або їхній насіннєвий матеріал можуть бути стійкими щодо гербіцидів і водночас стійкими щодо поїдання комахами (трансгенні об'єкти з "пакетованими" генами). Наприклад, насінина може мати здатність експресувати інсектицидний білок Cry3 та водночас бути витривалою щодо гліфосату.

Також слід розуміти, що культурні рослини включають ті, які одержані за допомогою традиційних способів селекції або генної інженерії та мають так звані привнесені ознаки (наприклад, поліпшену стабільність під час зберігання, більш високу поживну цінність та поліпшений смак).

Композиції можна застосовувати для контролю небажаних рослин (узагальнено "бур'янів"). Бур'яни, які підлягають контролю, можуть являти собою як види однодольних рослин, наприклад *Agrostis*, *Alopecurus*, *Avena*, *Brachiaria*, *Bromus*, *Cenchrus*, *Cyperus*, *Digitaria*, *Echinochloa*, *Eleusine*, *Lolium*, *Monochoria*, *Rottboellia*, *Sagittaria*, *Scirpus*, *Setaria* та *Sorghum*, так і види дводольних рослин, наприклад *Abutilon*, *Amaranthus*, *Ambrosia*, *Chenopodium*, *Chrysanthemum*, *Conyza*, *Galium*, *Ipomoea*, *Nasturtium*, *Sida*, *Sinapis*, *Solanum*, *Stellaria*, *Veronica*, *Viola* та *Xanthium*.

У додатковому аспекті даного винаходу передбачене застосування сполуки формули (I), описаної в даному документі, як гербіцид.

Сполуки за даним винаходом можна одержувати згідно з наступними схемами.

У всьому тексті застосовуються наступні типові скорочення:

Ac = ацетат;

br = широкий;

d = дублет;

DABCO = 1,4-діазабіцикло[2.2.2]октан;

DCM = дихлорметан;

DEAD = діетилазодикарбоксилат;

DIAD = діізопропілазодикарбоксилат;

DMF = N,N-диметилформамід;

Et = етил;

Et₂O = діетиловий етер;

EtOAc = етилацетат;

HPLC = вискоєфективна рідинна хроматографія;

LiHMDS = біс(триметилсиліл)амід літію;

m = мультиплет;

Me = метил;

MeCN = ацетонітрил;

MeOH = метанол;

Ms = мезилат;

PG = захисна група;

Ph = феніл;

Ph₂O = дифеніловий естер;

q = квартет;

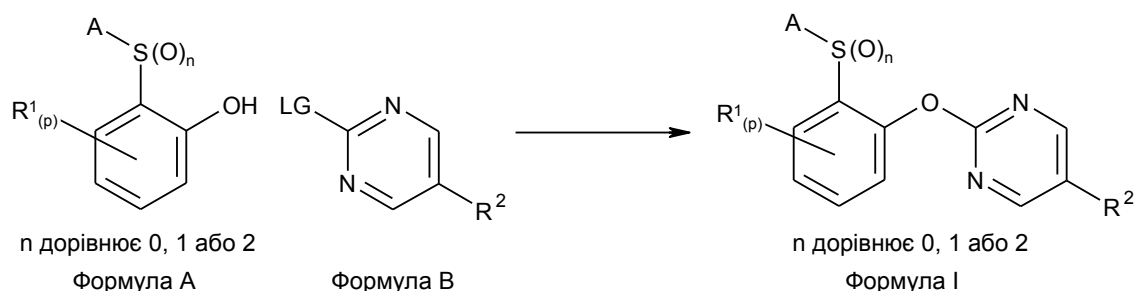
к. т. = кімнатна температура;

s = синглет;

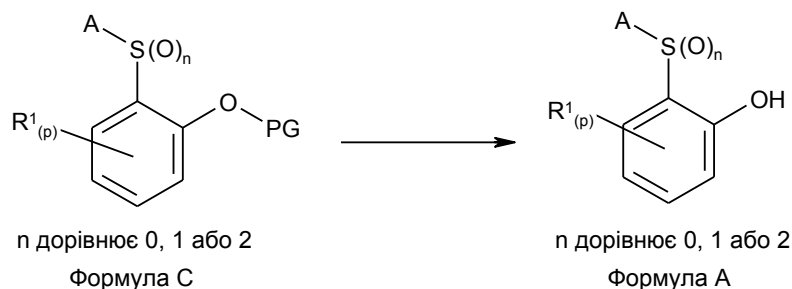
t = триплет;
 TBAF = фторид тетрабутиламонію;
 TIPS = триізопропілсиліл;
 Tf = трифлат;
 THF = тетрагідрофуран;
 Ts = тозилат.

Способи одержання сполук, наприклад сполук формули (I)

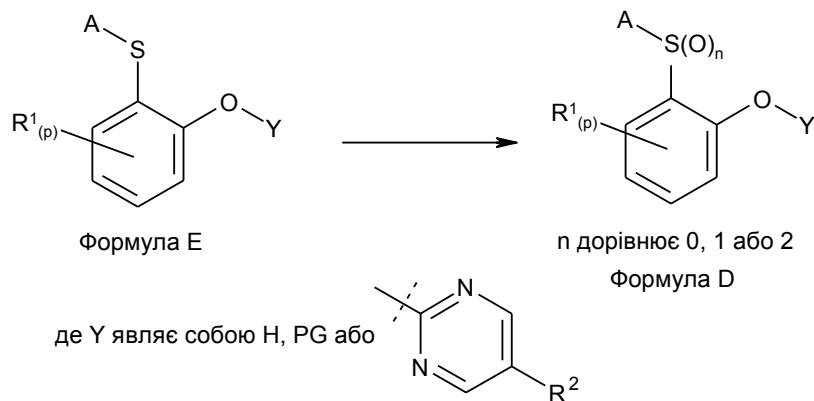
Способи одержання сполук, наприклад сполук формули (I) (що необов'язково можуть являти собою їх агрохімічно прийнятну сіль), описуються далі та являють собою додаткові аспекти даного винаходу.



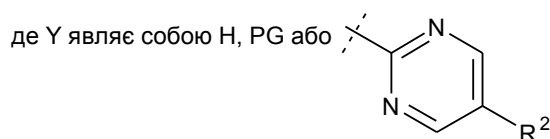
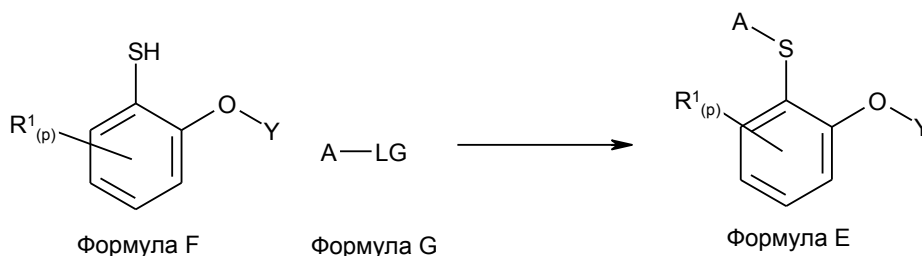
Сполука формули I може бути одержана зі сполуки формули A за допомогою здійснення реакції зі сполукою формули B (де LG являє собою придатну відхідну групу, таку як Br, Cl, F або SO₂Me) необов'язково за наявності придатної основи та в придатному розчиннику. Придатні основи можуть включати K₂CO₃ або Cs₂CO₃. Придатні розчинники можуть включати DMF або MeCN. Сполуки формули B є комерційно доступними або можуть бути одержані за допомогою способів, відомих із літератури.



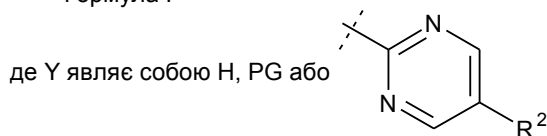
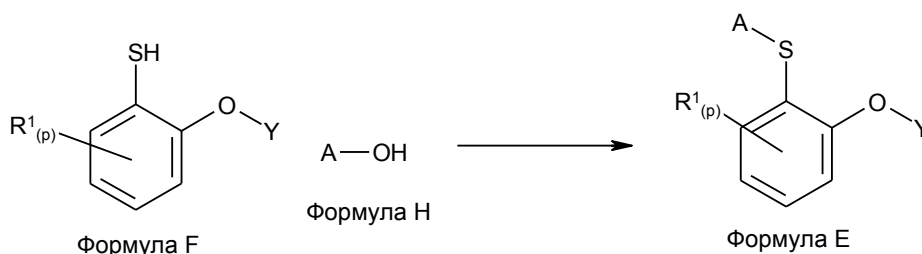
Сполука формули A може бути одержана зі сполуки формули C (де PG являє собою придатну захисну групу, таку як Me або Ac) за допомогою реакції видалення захисної групи. Придатні умови для видалення захисної групи, у випадку якщо PG являє собою Me, включають використання BBr₃ у придатному розчиннику, такому як DCM. Придатні умови для видалення захисної групи, у випадку якщо PG являє собою Ac, включають використання K₂CO₃ або NH₄OAc у придатному розчиннику, такому як MeOH або MeOH/H₂O.



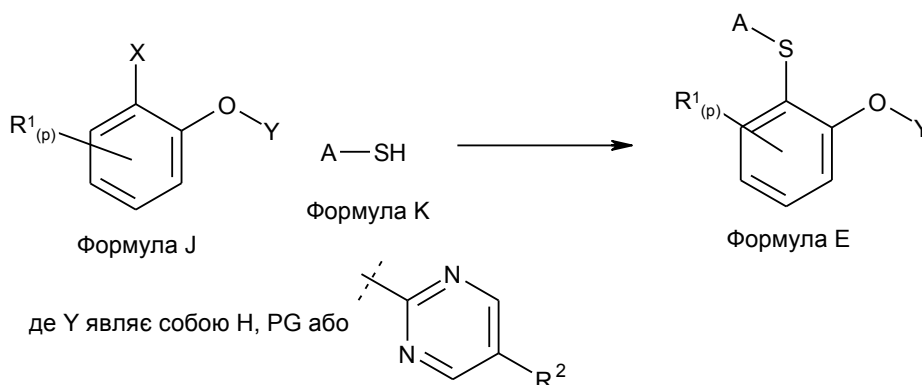
Сполука формули D (яке включає сполуки формули I, A і C, де n дорівнює 1 або 2) може бути одержана зі сполуки формули E (яке включає сполуки формул I, A і C, де n дорівнює 0) за допомогою здійснення реакції з придатним окиснювальним реагентом у придатному розчиннику. Придатні окиснювальні реагенти можуть включати мета-хлорпероксибензойну кислоту. Придатні розчинники можуть включати DCM. Придатні умови для одержання сполук формули D, де n дорівнює 1, можуть включати використання одного мольного еквівалента окиснювального реагенту. Придатні умови для одержання сполук формули D, де n дорівнює 2, можуть включати використання двох або більше мольних еквівалентів окиснювального реагенту.



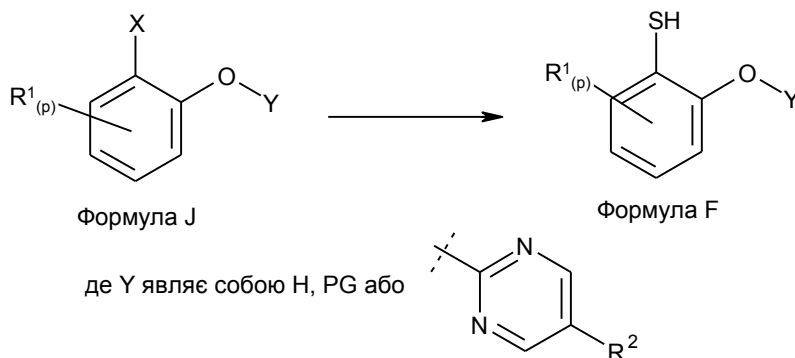
Сполука формули E (яка включає сполуки формул I, A і C, де n дорівнює 0) може бути одержана зі сполуки формули F за допомогою реакції з алкілювальним реагентом формули G (де LG являє собою придатну відхідну групу, таку як Br, Cl, OMs або OTs) необов'язково у присутності придатної основи і у придатному розчиннику. Придатні основи можуть включати K₂CO₃ або Cs₂CO₃. Придатні розчинники можуть включати DMF або MeCN. Сполуки формули G є комерційно доступними або можуть бути одержані за допомогою способів, відомих у літературі. Сполуки формули F, де Y являє собою H або PG (наприклад, Me), є комерційно доступними або можуть бути одержані за допомогою способів, відомих у літературі (приклад див. нижче).



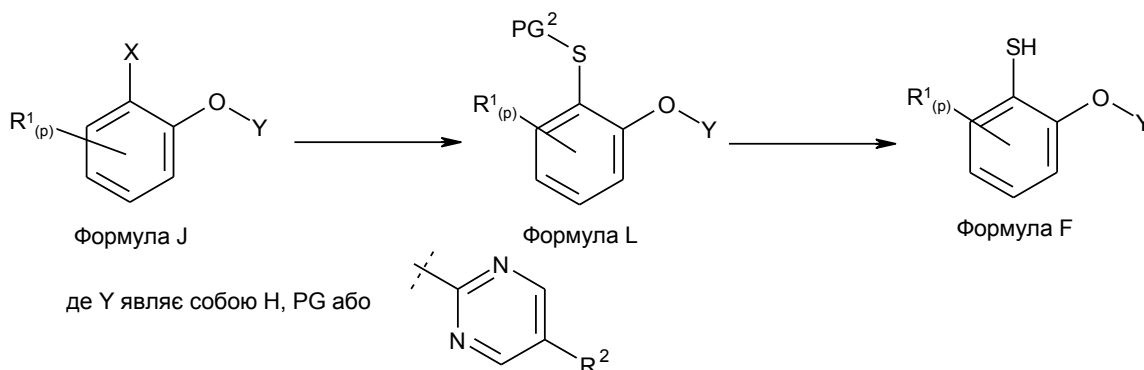
В альтернативному підході сполука формули E (яка включає сполуки формул I, A і C, де n дорівнює 0) може бути одержана зі сполуки формули F за допомогою реакції Міцунобу зі спиртом формули H у присутності азодикарбоксилатного реагенту і фосфіну у придатному розчиннику. Придатні азодикарбоксилатні реагенти можуть включати діетилазодикарбоксилат (DEAD) або діізопропілазодикарбоксилат (DIAD). Придатні фосфіни можуть включати трифенілфосфін. Придатні розчинники можуть включати THF. Сполуки формули F, де Y являє собою H або PG (наприклад, Me), є комерційно доступними або можуть бути одержані за допомогою способів, відомих у літературі (приклад див. нижче).



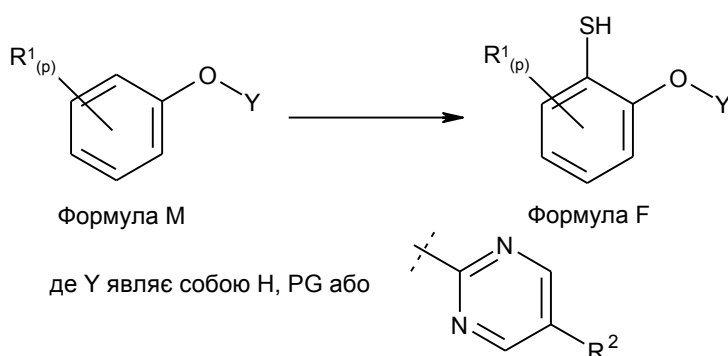
У додатковому альтернативному підході сполука формули E (яка включає сполуки формул I, A і C, де n дорівнює 0) може бути одержана зі сполуки формули J (де X являє собою придатний галоген, такий як F, Cl, Br або I, або придатний псевдогалоген, такий як OTf) за допомогою реакції з тіолом формули K необов'язково у присутності придатної комбінації каталізатора/ліганду, у присутності придатної основи і у придатному розчиннику. Придатні каталізатори можуть включати метансульфонат [(4,5-біс(дифенілфосфіно)-9,9-диметилксантен)-2-(2'-аміно-1,1'-біфеніл)]паладію(II). Придатні основи можуть включати N,N-діізопропілетиламін або K₂CO₃. Придатні розчинники можуть включати 1,4-діоксан або DMF. Сполуки формули K є комерційно доступними або можуть бути одержані за допомогою способів, відомих у літературі. Сполуки формули J, де Y являє собою H або PG (наприклад, Me), є комерційно доступними або можуть бути одержані за допомогою способів, відомих у літературі.



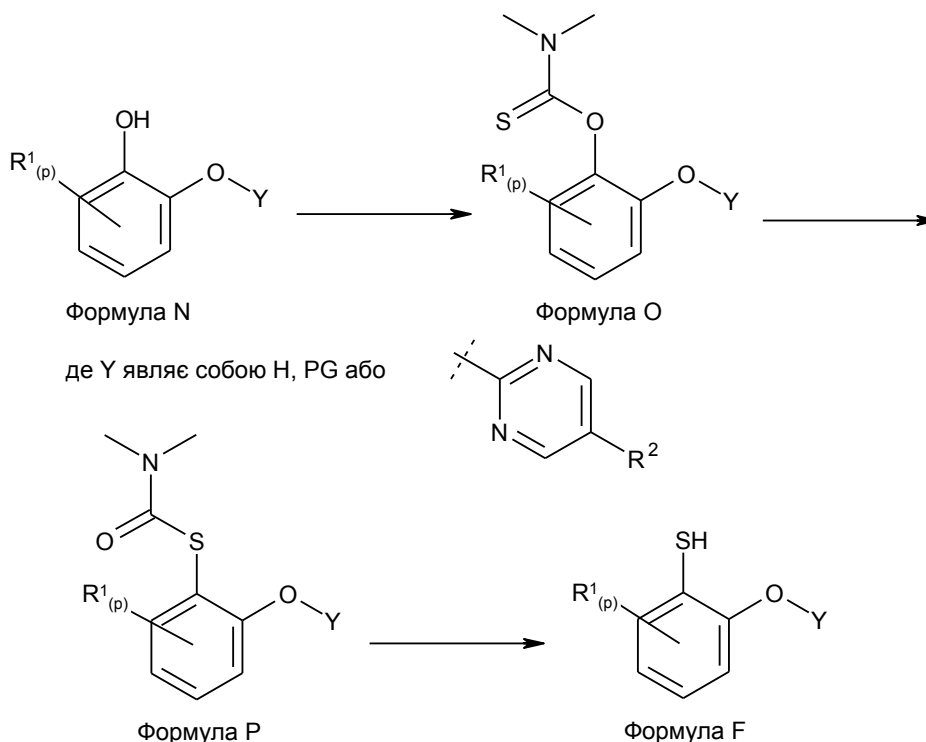
Сполука формули F може бути одержана зі сполуки формули J (де X являє собою придатний галоген, такий як F або Cl) за допомогою здійснення реакції ароматичного нуклеофільного заміщення з H₂S або придатним замінником H₂S необов'язково у присутності придатної основи і у придатному розчиннику. Придатні замінники H₂S можуть включати Na₂S, NaSH або Li₂S. Придатні розчинники можуть включати DMF. Сполуки формули J, де Y являє собою H або PG (наприклад, Me), є комерційно доступними або можуть бути одержані за допомогою способів, відомих у літературі.



В альтернативному підході сполука формули F може бути одержана зі сполуки формули J (де X являє собою придатний галоген, такий як F, Cl, Br або I, або придатний псевдогалоген, такий як OTf) під час двостадійної послідовності. На першій стадії сполука формули L (де PG² являє собою придатну захисну групу, таку як TIPS) може бути одержана зі сполуки формули J за допомогою реакції із замінником H₂S необов'язково у присутності придатної комбінації каталізатора/ліганду, у присутності придатної основи і у придатному розчиннику. Придатні замінники H₂S можуть включати TIPS-SH. Придатні каталізатори можуть включати каталізатор, який складається з Pd(OAc)₂ і (2R)-1-[(1R)-1-[біс(1,1-диметилетил)фосфіно]етил]-2-(дициклогексилфосфіно)фероцену. Придатні основи можуть включати LiHMDS. Придатні розчинники можуть включати толуол. На другій стадії сполука формули F може бути одержана зі сполуки формули L за допомогою реакції видалення захисної групи. Придатні умови для видалення захисної групи, у випадку якщо PG² являє собою TIPS, можуть включати застосування TBAF у придатному розчиннику, такому як толуол. Сполуки формули J, де Y являє собою H або PG (наприклад, Me), є комерційно доступними або можуть бути одержані за допомогою способів, відомих у літературі.



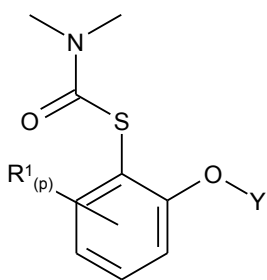
У додатковому альтернативному підході сполука формули F може бути одержана зі сполуки формули M за допомогою орто-літування з придатним алкіллітієвим реагентом і наступним проведенням реакції з елементарною сіркою у придатному розчиннику за придатної температури реакції. Придатні алкіллітієві реагенти можуть включати н-бутиллітій. Придатні розчинники можуть включати THF. Придатні температури реакції можуть становити від -78 °C до 20 °C. Сполуки формули M, де Y являє собою H або PG (наприклад, Me), є комерційно доступними або можуть бути одержані за допомогою способів, відомих у літературі.



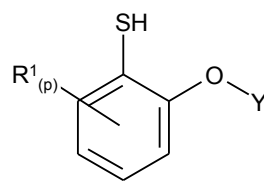
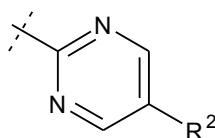
Формула N

Формула O

де Y являє собою H, PG або



Формула P



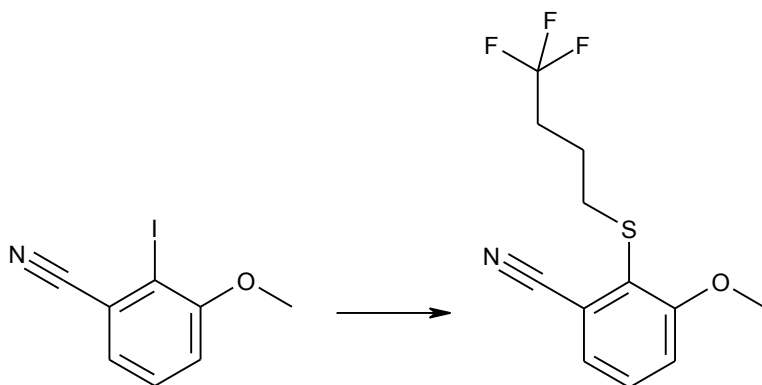
Формула F

У ще одному альтернативному підході сполука формули F може бути одержана під час тристадійної послідовності зі сполуки формули N. На першій стадії сполука формули O може бути одержана зі сполуки формули N за допомогою здійснення реакції з N,N-диметилтіокарбомойлхлоридом у присутності придатної основи й у придатному розчиннику. Придатні основи можуть включати DABCO або NaH. Придатні розчинники можуть включати DMF. На другій стадії сполука формули P може бути одержана за допомогою проведення щодо сполуки формули O перегрупування Ньюмана-Кварта в діапазоні придатних умов. Придатні умови для перегрупування можуть включати нагрівання за температур у діапазоні від 180 °C до 300 °C або в чистому вигляді, або у придатному розчиннику, такому як Ph₂O. На третій стадії сполука формули F може бути одержана зі сполуки формули P за допомогою здійснення реакції з NaOH або KOH у придатному розчиннику. Придатні розчинники можуть включати H₂O або MeOH. Сполуки формули N, де Y являє собою H або PG (наприклад, Me), є комерційно доступними або можуть бути одержані за допомогою способів, відомих у літературі.

У наступних необмежувальних прикладах передбачені конкретні способи синтезу для ілюстративних сполук за даним винаходом, вказаних у таблицях нижче.

Приклад 1. Синтез 3-(5-хлорпіримідин-2-іл)окси-2-(4,4,4-трифторбутилсульфаніл)бензонітрилу – сполуки A28

Стадія 1. Синтез 3-метокси-2-(4,4,4-трифторбутилсульфаніл)бензонітрилу

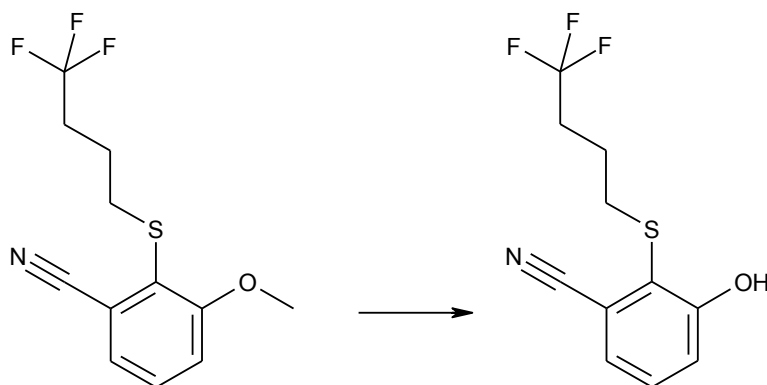


До перемішаного розчину 2-йод-3-метоксибензонітрилу (1,0 г, 3,9 ммоль) і N,N-діізопропілетиламіну (1,0 г, 1,3 мл, 7,7 ммоль) в 1,4-діоксані (15 мл) в атмосфері азоту додавали

метансульфонат [(4,5-біс(дифенілфосфіно)-9,9-диметилксантен)-2-(2'-аміно-1,1'-біфеніл)]паладію(II) (0,39 г, 0,39 ммоль) і 4,4,4-трифторбутан-1-тіол (0,61 г, 4,2 ммоль). Реакційну суміш нагрівали за 120 °С протягом 2 годин шляхом обробки мікрохвильовим опроміненням, після чого розчинник видаляли за зниженого тиску. Неочищений залишок очищували за допомогою флеш-хроматографії на силікагелі із застосуванням градієнта 0-30 % етилацетату в циклогексані як елюенту з одержанням необхідного продукту (0,95 г, 72 %).

¹H ЯМР (400 МГц, CDCl₃) δ 7,44 - 7,37 (m, 1H), 7,30 (dd, 1H), 7,12 (dd, 1H), 3,94 (s, 3H), 3,01 (t, 2H), 2,40 - 2,24 (m, 2H), 1,83 - 1,70 (m, 2H)

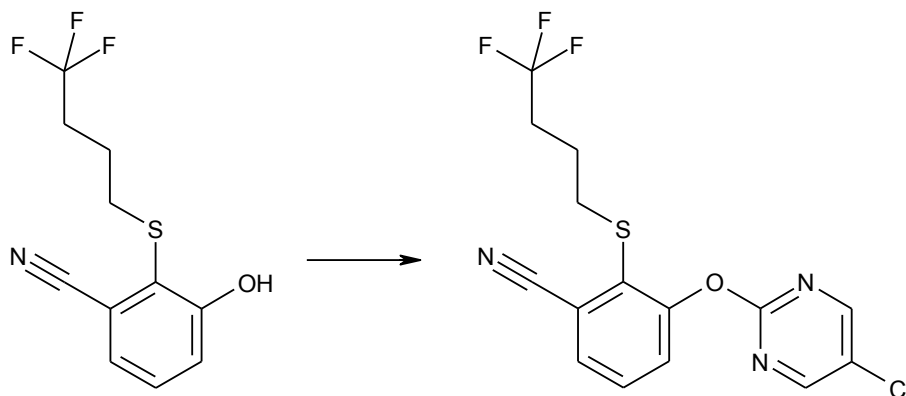
Стадія 2. Синтез 3-гідрокси-2-(4,4,4-трифторбутилсульфаніл)бензонітрилу



До перемішаного розчину 3-метокси-2-(4,4,4-трифторбутилсульфаніл)бензонітрилу (0,95 г, 3,5 ммоль) в DCM (35 мл) за 0 °С в атмосфері N₂ додавали BBr₃ (8,6 мл 1 М розчину в DCM, 8,6 ммоль). Забезпечували нагрівання реакційної суміші до кімнатної температури протягом 1 години і потім її перемішували протягом ночі, після чого суміш гасили насиченим розчином NaHCO₃ й екстрагували за допомогою DCM (x3). Об'єднані органічні екстракти пропускали через гідрофобну фриту і концентрували за зниженого тиску. Неочищений залишок очищували за допомогою флеш-хроматографії на силікагелі із застосуванням градієнта 0-60 % EtOAc в циклогексані як елюенту з одержанням необхідного продукту (0,76 г, 84 %).

¹H ЯМР (400 МГц, CDCl₃) δ 7,42 - 7,37 (m, 1H), 7,32 (dd, 1H), 7,26 (dd, 1H), 6,93 (br s, 1H), 2,92 (t, 2H), 2,34 - 2,20 (m, 2H), 1,92 - 1,81 (m, 2H)

Стадія 3. Синтез 3-(5-хлорпіримідин-2-іл)окси-2-(4,4,4-трифторбутилсульфаніл)бензонітрилу



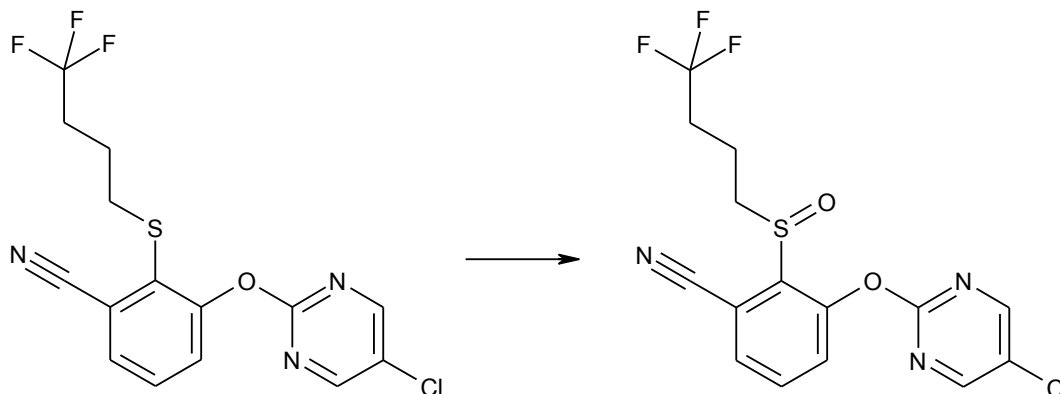
До перемішаного розчину 3-гідрокси-2-(4,4,4-трифторбутилсульфаніл)бензонітрилу (0,30 г, 1,1 ммоль) і карбонату калію (0,32 г, 2,3 ммоль) у диметилформаміді (3 мл) додавали 2,5-дихлорпіримідин (0,21 г, 1,4 ммоль). Реакційну суміш нагрівали за 80 °С протягом 4 годин і потім забезпечували її охолодження до к. т. Реакційну суміш розбавляли за допомогою EtOAc і H₂O, фази розділяли і водну фазу екстрагували додатковою кількістю EtOAc. Об'єднані органічні речовини висушували над MgSO₄, фільтрували і випарювали до сухого стану за зниженого тиску. Неочищений залишок очищували за допомогою флеш-хроматографії на силікагелі із застосуванням градієнта 0-30 % EtOAc в циклогексані як елюенту з одержанням необхідного продукту (0,33 г, 77 %).

¹H ЯМР (400 МГц, CDCl₃) δ 8,48 (s, 2H), 7,66 (dd, 1H), 7,53 (t, 1H), 7,48 - 7,42 (m, 1H), 3,05 -

2,99 (m, 2H), 2,35 - 2,17 (m, 2H), 1,81 - 1,72 (m, 2H)

Приклад 2. Синтез 3-(5-хлорпіримідин-2-іл)окси-2-(4,4,4-трифторбутилсульфініл)бензонітрилу – сполуки A29

3-(5-хлорпіримідин-2-іл)окси-2-(4,4,4-

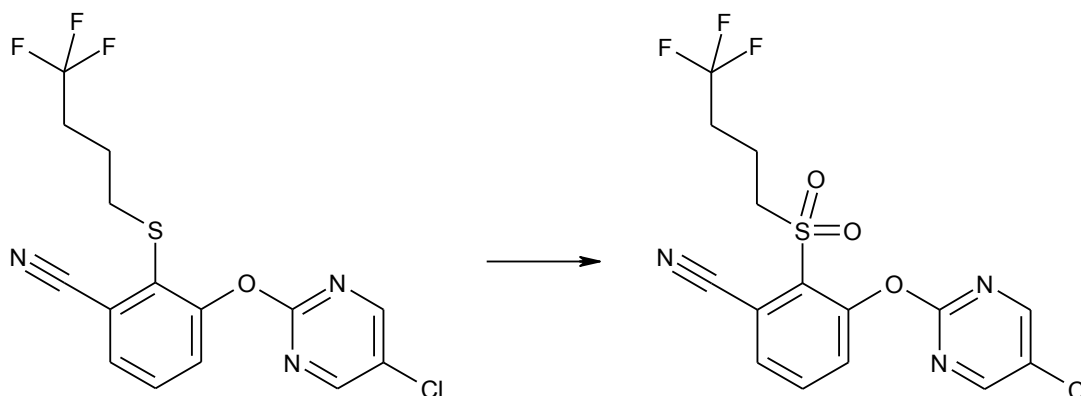


5

До перемішаного розчину 3-(5-хлорпіримідин-2-іл)окси-2-(4,4,4-трифторбутилсульфаніл)бензонітрилу (0,10 г, 0,27 ммоль) в DCM (2,7 мл) за 0 °C додавали 3-хлорпербензойну кислоту ($\leq 77\%$, 0,060 г, 0,27 ммоль). Реакційну суміш перемішували за 0 °C протягом 20 хвилин і потім розбавляли за допомогою DCM і насиченого розчину $\text{Na}_2\text{S}_2\text{O}_5$. Фази розділяли й органічну фазу промивали додатковими порціями насиченого розчину $\text{Na}_2\text{S}_2\text{O}_5$ (x2). Органічну фазу потім промивали насиченим розчином NaHCO_3 , пропускали через гідрофобну фритту і концентрували за зниженого тиску. Неочищений залишок очищували за допомогою флеш-хроматографії на силікагелі із застосуванням градієнта 0-100 % EtOAc в циклогексані як елюенту з одержанням необхідного продукту (0,089 г, 85 %).

^1H ЯМР (400 МГц, CDCl_3) δ 8,50 (s, 2H), 7,80 (dd, 1H), 7,70 (t, 1H), 7,47 (dd, 1H), 3,50 - 3,41 (m, 1H), 3,23 - 3,12 (m, 1H), 2,40 - 2,25 (m, 2H), 2,19 - 2,06 (m, 2H)

Приклад 3. Синтез 3-(5-хлорпіримідин-2-іл)окси-2-(4,4,4-трифторбутилсульфоніл)бензонітрилу – сполуки A30



20

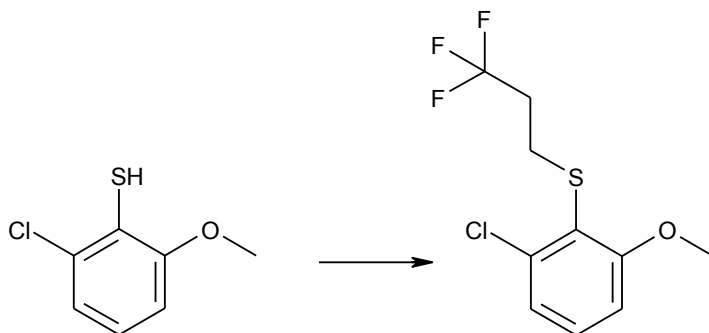
До перемішаного розчину 3-(5-хлорпіримідин-2-іл)окси-2-(4,4,4-трифторбутилсульфаніл)бензонітрилу (0,13 г, 0,35 ммоль) в DCM (3,5 мл) за 0 °C додавали 3-хлорпербензойну кислоту ($\leq 77\%$, 0,390 г, 1,74 ммоль). Реакційну суміш перемішували за 0 °C протягом 3 годин і потім розбавляли за допомогою DCM і насиченого розчину $\text{Na}_2\text{S}_2\text{O}_5$. Фази розділяли й органічну фазу промивали додатковими порціями насиченого розчину $\text{Na}_2\text{S}_2\text{O}_5$ (x2). Органічну фазу потім промивали насиченим розчином NaHCO_3 , пропускали через гідрофобну фритту і концентрували за зниженого тиску. Неочищений залишок очищували за допомогою флеш-хроматографії на силікагелі із застосуванням градієнта 0-100 % EtOAc в циклогексані як елюенту з одержанням необхідного продукту (0,129 г, 91 %).

^1H ЯМР (400 МГц, CDCl_3) δ 8,49 (s, 2H), 7,90 - 7,83 (m, 2H), 7,61 (dd, 1H), 3,59 (t, 2H), 2,42 - 2,29 (m, 2H), 2,16 - 2,07 (m, 2H)

Приклад 4. Синтез 5-хлор-2-[3-хлор-2-(3,3,3-трифторпропілсульфаніл)фенокси]піримідину – сполуки A10

Стадія 1. Синтез 1-хлор-3-метокси-2-(3,3,3-трифторпропілсульфаніл)бензолу

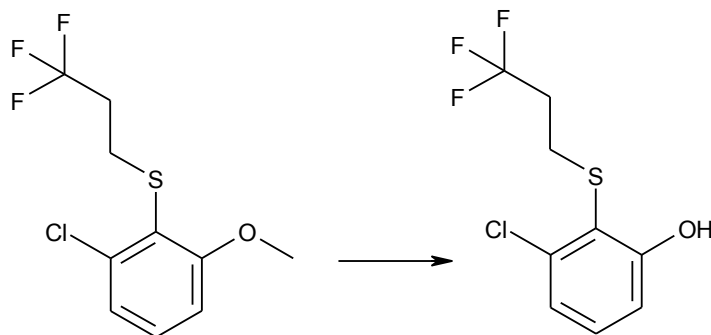
35



До перемішаного розчину 2-хлор-6-метоксибензолтіолу (0,30 г, 1,7 ммоль) і карбонату калію (0,47 г, 3,4 ммоль) у диметилформаміді (3 мл) додавали 1,1,1-трифтор-3-йодпропан (0,46 г, 0,24 мл, 2,1 ммоль). Реакційну суміш перемішували протягом ночі за кімнатної температури і потім розбавляли за допомогою Et₂O і води. Фази розділяли і водну фазу повторно екстрагували за допомогою Et₂O. Об'єднані органічні речовини висушували над MgSO₄ і випарювали до сухого стану за зниженого тиску. Неочищений залишок очищували за допомогою флеш-хроматографії на силікагелі із застосуванням градієнта 0-20 % EtOAc в циклогексані як елюенту з одержанням необхідного продукту (0,44 г, 94 %).

¹H ЯМР (400 МГц, CDCl₃) δ 7,32 - 7,28 (m, 1H), 7,14 (dd, 1H), 6,87 (dd, 1H), 3,95 (s, 3H), 3,09 - 3,02 (m, 2H), 2,41 - 2,27 (m, 2H)

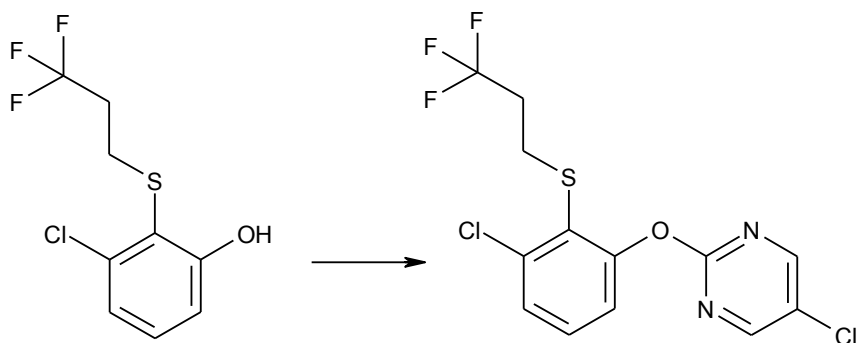
Стадія 2. Синтез 3-хлор-2-(3,3,3-трифторпропілсульфаніл)фенолу



До перемішаного розчину 1-хлор-3-метокси-2-(3,3,3-трифторпропілсульфаніл)бензолу (0,40 г, 1,5 ммоль) в DCM (15 мл) за 0 °C в атмосфері N₂ додавали BBr₃ (3,7 мл 1 М розчину в DCM, 3,7 ммоль). Забезпечували нагрівання реакційної суміші до кімнатної температури і її перемішували протягом 4 годин, після чого суміш гасили насиченим розчином NaHCO₃ й екстрагували за допомогою DCM (x2). Об'єднані органічні екстракти пропускали через гідрофобну фриту і концентрували за зниженого тиску. Неочищений залишок очищували за допомогою флеш-хроматографії на силікагелі із застосуванням градієнта 0-15 % EtOAc в циклогексані як елюенту з одержанням необхідного продукту (0,30 г, 78 %).

¹H ЯМР (400 МГц, CDCl₃) δ 7,25 (t, 1H), 7,06 (dd, 1H), 6,96 (dd, 1H), 6,94 (s, 1H), 3,00 - 2,92 (m, 2H), 2,42 - 2,28 (m, 2H)

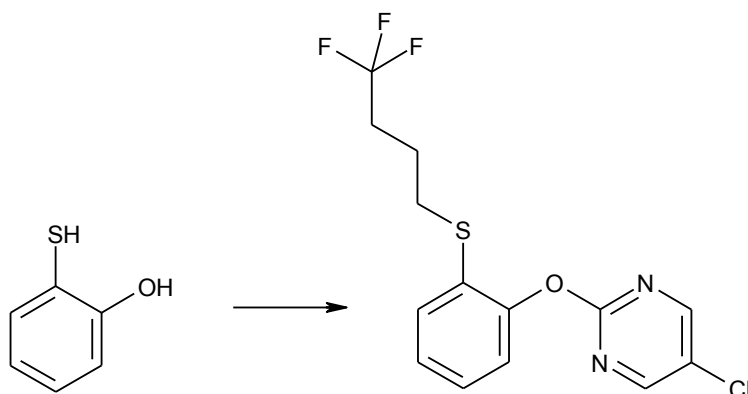
Стадія 3. Синтез 5-хлор-2-[3-хлор-2-(3,3,3-трифторпропілсульфаніл)феноксипіримідину



До перемішаного розчину 3-хлор-2-(3,3,3-трифторпропілсульфаніл)фенолу (0,18 г, 0,70 ммоль) і карбонату калію (0,19 г, 1,4 ммоль) у диметилформаміді (1,8 мл) додавали 2,5-дихлорпіримідин (0,13 г, 0,84 ммоль). Реакційну суміш нагрівали за 80 °С протягом 3 годин і потім забезпечували її охолодження до к. т. Реакційну суміш розбавляли за допомогою EtOAc і H₂O, фази розділяли і водну фазу екстрагували додатковою кількістю EtOAc. Об'єднані органічні речовини висушували над MgSO₄, фільтрували і випарювали до сухого стану за зниженого тиску. Неочищений залишок очищували за допомогою флеш-хроматографії на силікагелі із застосуванням градієнта 0-20 % EtOAc в циклогексані як елюенту з одержанням необхідного продукту (0,16 г, 63 %).

¹H ЯМР (400 МГц, CDCl₃) δ 8,48 (s, 2H), 7,49 - 7,43 (m, 1H), 7,43 - 7,37 (m, 1H), 7,18 (dd, 1H), 3,01 - 2,95 (m, 2H), 2,36 - 2,23 (m, 2H)

Приклад 5. Синтез 5-хлор-2-[2-(4,4,4-трифторбутилсульфаніл)феноксипіримідину – сполуки A4

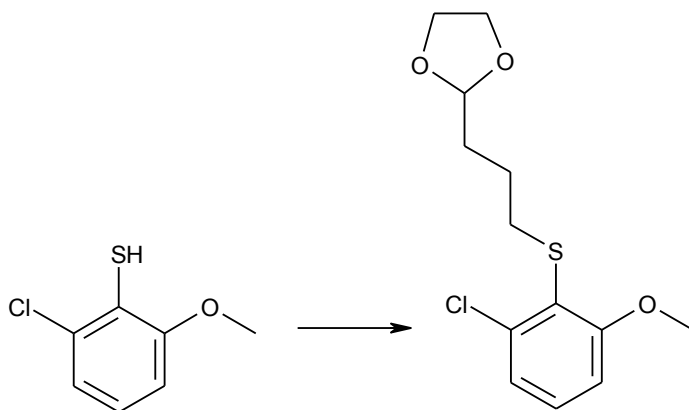


До перемішаного розчину 2-сульфанілфенолу (0,75 г, 0,60 ммоль) і карбонату калію (0,82 г, 5,9 ммоль) у диметилформаміді (7,5 мл) додавали 4-бром-1,1,1-трифторбутан (1,14 г, 0,74 ммоль). Реакційну суміш перемішували за кімнатної температури протягом 1,5 години, після чого додавали карбонат калію (0,90 г, 6,5 ммоль) і 2,5-дихлорпіримідин (1,06 г, 7,1 ммоль). Реакційну суміш нагрівали за 80 °С протягом 1 години і потім забезпечували її охолодження до к. т. Реакційну суміш розбавляли за допомогою Et₂O і H₂O, фази розділяли і водну фазу екстрагували за допомогою додаткової кількості Et₂O. Об'єднані органічні речовини висушували над MgSO₄, фільтрували і випарювали до сухого стану за зниженого тиску. Неочищений залишок очищували за допомогою флеш-хроматографії на силікагелі із застосуванням градієнта 0-20 % EtOAc в циклогексані як елюенту з одержанням необхідного продукту (1,38 г, 66 %).

¹H ЯМР (400 МГц, CDCl₃) δ 8,48 (s, 2H), 7,48 (dd, 1H), 7,40 - 7,31 (m, 1H), 7,31 - 7,24 (m, 1H), 7,19 (dd, 1H), 2,92 (t, 2H), 2,25 - 2,12 (m, 2H), 1,85 - 1,77 (m, 2H)

Приклад 6. Синтез 5-хлор-2-[3-хлор-2-(4,4-дифторбутилсульфаніл)феноксипіримідину – сполуки A105

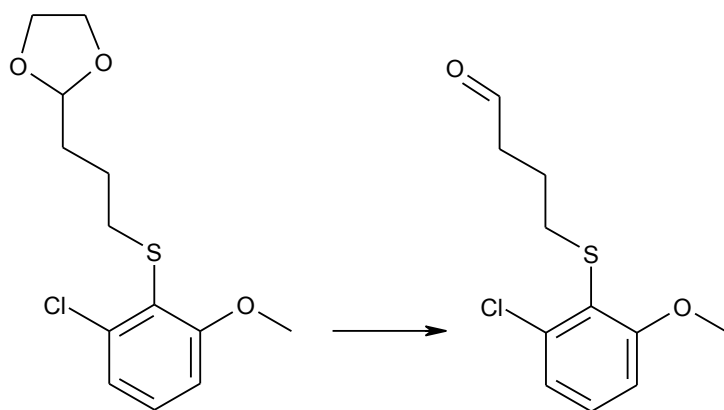
Стадія 1. Синтез 2-[3-(2-хлор-6-метоксифеніл)сульфанілпропіл]-1,3-діоксолану



До перемішаного розчину 2-хлор-6-метоксибензолтіолу (0,75 г, 4,29 ммоль) і 2-(3-хлорпропіл)-1,3-діоксолану (0,776 г, 5,15 ммоль) в DMF (7,5 мл) додавали K_2CO_3 (1,19 г, 8,59 ммоль). Реакційну суміш перемішували протягом ночі за к. т., потім розбавляли водою й екстрагували за допомогою EtOAc (x3). Об'єднані органічні екстракти промивали сольовим розчином, висушували над $MgSO_4$ і випарювали до сухого стану за зниженого тиску. Неочищений продукт очищували за допомогою флеш-хроматографії на силікагелі із застосуванням градієнта 0-20 % EtOAc/циклогексан як елюенту з одержанням необхідного продукту (0,72 г, 58 %) у вигляді безбарвного масла.

1H ЯМР (400 МГц, $CDCl_3$) δ = 7,19 (t, 1H), 7,07 (d, 1H), 6,79 (d, 1H), 4,81 (t, 1H), 3,94-3,85 (m, 2H), 3,88 (s, 3H), 3,84-3,78 (m, 2H), 2,90 (t, 2H), 1,82-1,73 (m, 2H), 1,68-1,58 (m, 2H)

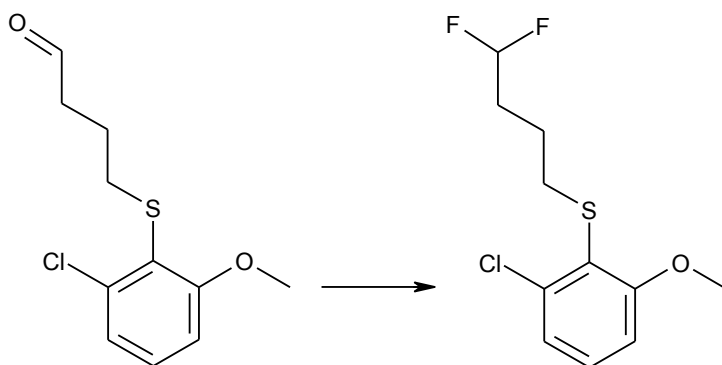
Стадія 2. Синтез 4-(2-хлор-6-метоксифеніл)сульфанілбутаналю



До розчину 2-[3-(2-хлор-6-метоксифеніл)сульфанілпропіл]-1,3-діоксолану (0,72 г, 2,49 ммоль) в CH_3CN (6 мл) додавали 2 М HCl (2 мл). Реакційну суміш перемішували за к. т. протягом ночі, додавали додаткову кількість 2 М HCl (1 мл) і реакційну суміш нагрівали за 60 °C протягом ночі. Забезпечували охолодження реакційної суміші до к. т., розбавляли водою й екстрагували за допомогою EtOAc (x3). Об'єднані органічні екстракти промивали сольовим розчином, висушували над $MgSO_4$ і випарювали до сухого стану за зниженого тиску з одержанням неочищеного продукту (0,64 г) у вигляді оранжевого масла, яке застосовували без додаткового очищення.

1H ЯМР (400 МГц, $CDCl_3$) δ = 9,75 (s, 1H), 7,19 (t, 1H), 7,07 (d, 1H), 6,80 (d, 1H), 3,89 (s, 3H), 2,90 (t, 2H), 2,63 (t, 2H), 1,82-1,72 (m, 2H)

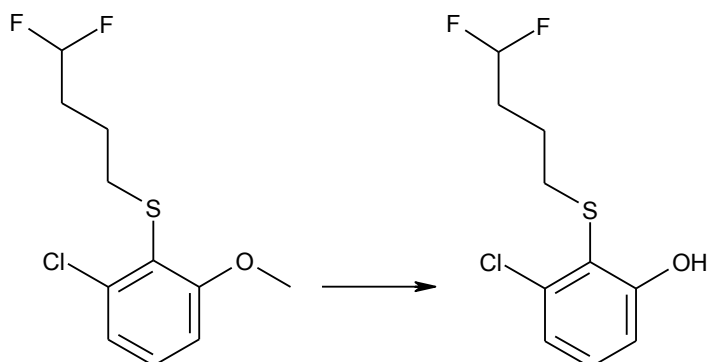
Стадія 3. Синтез 1-хлор-2-(4,4-дифторбутилсульфаніл)-3-метоксибензолу



До перемішаного розчину 4-(2-хлор-6-метоксифеніл)сульфанілбутаналю (644 мг, 2,63 ммоль) в DCM (10 мл) по краплях додавали трифторид діаміносікри (0,773 мл, 5,26 ммоль). Реакційну суміш перемішували за к. т. протягом 2 годин, потім охолоджували до 0 °С, гасили водою, розбавляли насиченим водним розчином бікарбонату натрію, потім екстрагували за допомогою EtOAc (x3). Об'єднані органічні екстракти промивали сольовим розчином, висушували над MgSO₄ і випарювали до сухого стану за зниженого тиску. Неочищений продукт очищували за допомогою флеш-хроматографії на силікагелі із застосуванням градієнта 0-50 % EtOAc/циклогексан як елюенту з одержанням необхідного продукту (0,395 г, 56 %) у вигляді блідо-жовтого масла.

¹H ЯМР (400 МГц, CDCl₃) δ = 7,19 (t, 1H), 7,09 (d, 1H), 6,80 (d, 1H), 5,78 (tt, 1H), 3,90 (s, 3H), 2,90 (t, 3H), 1,91-2,09 (m, 2H), 1,69-1,58 (m, 2H)

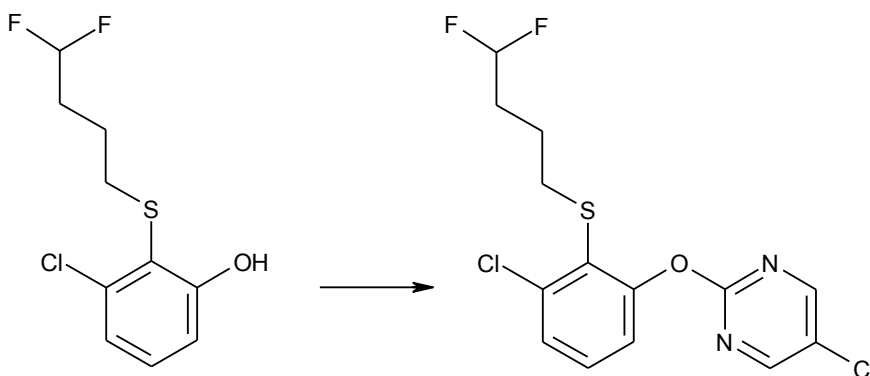
Стадія 4. Синтез 3-хлор-2-(4,4-дифторбутилсульфаніл)фенолу



До перемішаного розчину 1-хлор-2-(4,4-дифторбутилсульфаніл)-3-метоксибензолу (100 мг, 0,396 ммоль) в DMF (1,14 мл) при к. т. в атмосфері N₂ додавали 1-додекантіол (0,193 мл, 0,791 ммоль) і LiO^tBu (0,79 мл 1 М розчину в THF, 0,79 ммоль). Реакційну суміш нагрівали за 100 °С протягом 90 хвилин, забезпечували її охолодження до к. т., розбавляли водою й екстрагували за допомогою EtOAc (x3). Об'єднані органічні екстракти промивали сольовим розчином, висушували над MgSO₄ і випарювали до сухого стану за зниженого тиску. Неочищений продукт очищували за допомогою флеш-хроматографії на силікагелі із застосуванням градієнта 0-30 % EtOAc/циклогексан як елюенту з одержанням необхідного продукту у вигляді суміші з 1-додекантіолом, яку застосовували без додаткового очищення.

¹H ЯМР (400 МГц, CDCl₃) δ 7,19 (t, 1H), 7,02 (d, 1H), 7,00 (s, 1H), 6,91 (d, 1H), 5,79 (tt, 1H), 2,81 (t, 2H), 2,03-1,88 (m, 2H), 1,79-1,67 (m, 2H)

Стадія 5. Синтез 5-хлор-2-[3-хлор-2-(4,4-дифторбутилсульфаніл)феноксипіримідину - сполуку A105

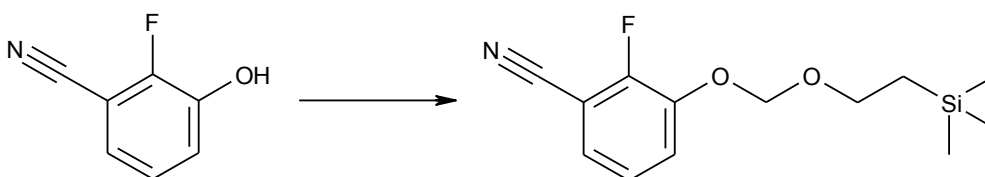


Суміш 3-хлор-2-(4,4-дифторбутилсульфаніл)фенолу (0,469 г, 1,86 ммоль), 2,5-дихлорпіримідину (0,332 г, 2,23 ммоль), K_2CO_3 (0,513 г, 3,71 ммоль) в DMF (3 мл) нагрівали за 140 °С в умовах мікрохвильового опромінення протягом 30 хвилин. Реакційну суміш розбавляли водою й екстрагували за допомогою EtOAc (x3). Об'єднані органічні екстракти промивали сольовим розчином, висушували над $MgSO_4$ і випарювали до сухого стану за зниженого тиску. Неочищений продукт очищували за допомогою флеш-хроматографії на силікагелі із застосуванням градієнта 0-30 % EtOAc/циклогексан як елюенту з одержанням необхідного продукту (0,0487 г, 72 %) у вигляді брудно-білої напівтвердої речовини.

1H ЯМР (400 МГц, $CDCl_3$) δ 8,47 (s, 2H), 7,41 (d, 1H), 7,33 (t, 1H), 7,13 (d, 1H), 5,78 (tt, 1H), 2,89 (t, 2H), 2,00-1,85 (m, 2H), 1,67-1,58 (m, 2H)

Приклад 7. Синтез 3-(5-хлорпіримідин-2-іл)окси-2-[3-(трифторметокси)пропілсульфаніл]бензонітрилу – сполуки A116

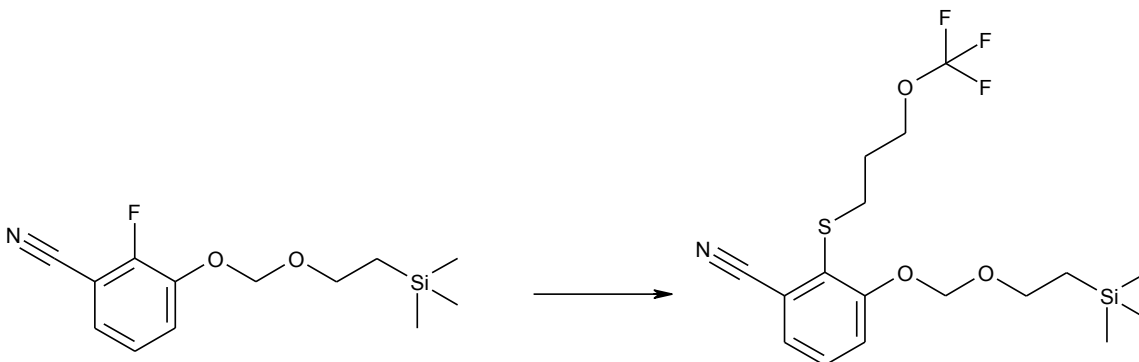
Стадія 1. Синтез 2-фтор-3-(2-триметилсилілетоксиметокси)бензонітрилу



До розчину 2-фтор-3-гідроксибензонітрилу (0,50 г, 3,60 ммоль) в DCM (18 мл) додавали Et_3N (1,0 мл, 7,3 ммоль) і 2-(хлорметокси)етилтриметилсилан (0,70 мл, 4,0 ммоль) і реакційну суміш перемішували за к. т. протягом 72 годин. Реакційну суміш розбавляли додатковою кількістю DCM, промивали водою і сольовим розчином, висушували над $MgSO_4$ і випарювали до сухого стану за зниженого тиску. Неочищений продукт очищували за допомогою флеш-хроматографії на силікагелі із застосуванням градієнта 0-30 % EtOAc/циклогексан як елюенту з одержанням необхідного продукту (0,50 г, 51 %).

1H ЯМР (400 МГц, $CDCl_3$) δ 7,47 (dt, 1H), 7,25 - 7,19 (m, 1H), 7,16 (dd, 1H), 5,29 (s, 2H), 3,79 (dd, 2H), 0,99 - 0,91 (m, 2H), 0,02 - -0,02 (m, 9H).

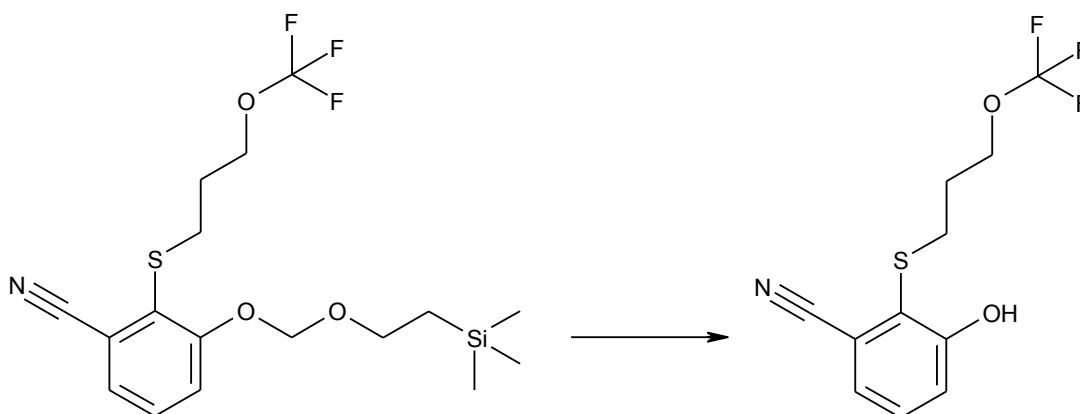
Стадія 2. Синтез 2-[3-(трифторметокси)пропілсульфаніл]-3-(2-триметилсилілетоксиметокси)бензонітрилу



Суміш 2-фтор-3-(2-триметилсилілетоксиметокси)бензонітрилу (0,25 г, 0,93 ммоль), сульфід натрію (0,103 г, 1,87 ммоль) в DMF (2,5 мл) в атмосфері N₂ нагрівали за 50 °С протягом ночі. Забезпечували охолодження реакційної суміші до к. т., потім додавали K₂CO₃ (0,129 г, 0,93 ммоль) і 1-бром-3-(трифторметокси)пропан (0,213 г, 1,03 ммоль) і перемішували за к. т. протягом 1,5 години. Реакційну суміш розбавляли водою й екстрагували за допомогою EtOAc (x3). Об'єднані органічні екстракти промивали сольовим розчином, висушували над MgSO₄ і випарювали до сухого стану за зниженого тиску. Неочищений продукт очищували за допомогою флеш-хроматографії на силікагелі із застосуванням градієнта 0-20 % EtOAc/циклогексан як елюенту з одержанням необхідного продукту (0,286 г, 61 %).

¹H ЯМР (400 МГц, CDCl₃) δ 7,32 - 7,42 (m, 3H) 5,32 - 5,35 (m, 2H) 4,12 (t, 2H) 3,79 (dd, 2H) 3,07 (t, 2H) 1,91 (t, 2H) 0,95 (dd, 2H) -0,01 - 0,02 (m, 9H).

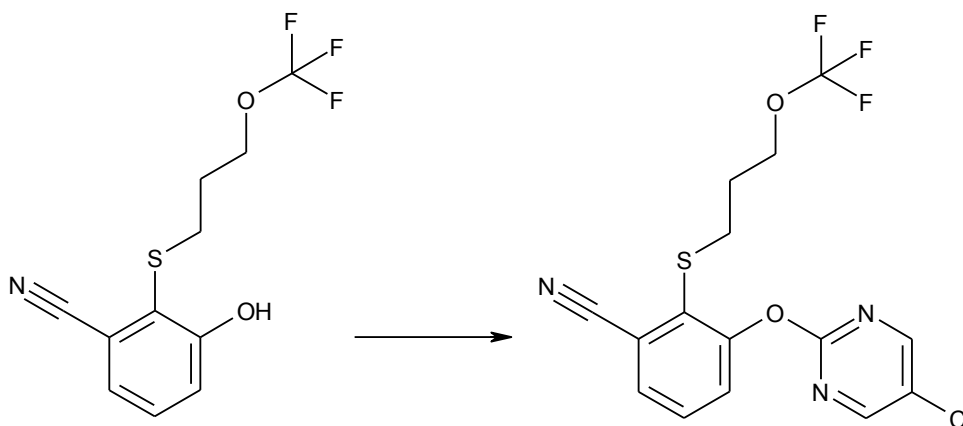
Стадія 3. Синтез 3-гідрокси-2-[3-(трифторметокси)пропілсульфаніл]бензонітрилу



До перемішаного розчину 2-[3-(трифторметокси)пропілсульфаніл]-3-(2-триметилсилілетоксиметокси)бензонітрилу (0,286 г, 0,70 ммоль) в MeOH (2,1 мл) і THF (3,5 мл) додавали 2 M HCl (2,1 мл) і реакційну суміш нагрівали за 75 °С протягом 2 годин. Забезпечували охолодження реакційної суміші до к. т., розбавляли водою й екстрагували за допомогою EtOAc (x3). Об'єднані органічні екстракти висушували над MgSO₄ і випарювали до сухого стану за зниженого тиску. Неочищений продукт очищували за допомогою флеш-хроматографії на силікагелі із застосуванням градієнта 0-30 % EtOAc/циклогексан як елюенту з одержанням необхідного продукту (0,154 г, 79 %).

¹H ЯМР (400 МГц, CDCl₃) δ 7,35 - 7,42 (m, 1H) 7,28 - 7,33 (m, 1H) 7,22 - 7,27 (m, 1H) 6,96 (s, 1H) 4,10 (t, 2H) 2,96 (t, 2H) 1,98 (quin, 2H).

Стадія 4. Синтез 3-(5-хлорпіримідин-2-іл)окси-2-[3-(трифторметокси)пропілсульфаніл]бензонітрилу – сполуки A116



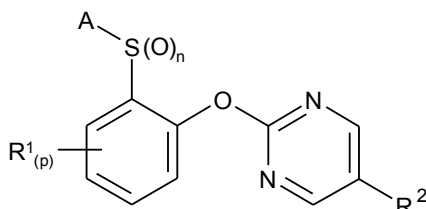
Суміш 3-гідрокси-2-[3-(трифторметокси)пропілсульфаніл]бензонітрилу (0,154 г, 0,56 ммоль), 5-хлор-2-метилсульфонілпіримідину (0,128 г, 0,67 ммоль) і K₂CO₃ (0,092 г, 0,67 ммоль) в DMF (1,5 мл) перемішували за к. т. протягом ночі. Реакційну суміш розбавляли водою й екстрагували

за допомогою EtOAc (x3). Об'єднані органічні екстракти висушували над $MgSO_4$ і випарювали до сухого стану за зниженого тиску. Неочищений продукт очищували за допомогою флеш-хроматографії на силікагелі із застосуванням градієнта 0-30 % EtOAc/циклогексан як елюенту з одержанням необхідного продукту (0,175 г, 81 %).

5 1H ЯМР (400 МГц, $CDCl_3$) δ 8,45 - 8,52 (m, 2H) 7,66 (dd, 1H) 7,53 (t, 1H) 7,43 - 7,49 (m, 1H) 4,07 (t, 2H) 3,05 (t, 2H) 1,89 (quin, 2H)

У наступних таблицях представлені приклади конкретних сполук за даним винаходом.

Таблиця 1



n дорівнює 0, R^1 являє собою H, і R^2 являє собою Cl.

Сполука	A
1.001	проп-1-іл
1.002	бут-1-ил
1.003	пент-1-ил
1.004	гекс-1-ил
1.005	3,3,3-трифторпроп-1-іл
1.006	4,4,4-трифторбут-1-ил
1.007	5,5,5-трифторпент-1-ил
1.008	6,6,6-трифторгект-1-ил
1.009	E- $CH_2CH=CHCF_3$
1.010	$CH_2CH_2OCH_2CF_3$
1.011	$CH_2CH_2OCF_3$
1.012	гептафторпроп-1-іл
1.013	нонафторбут-1-ил
1.014	3,3-дифторпроп-1-іл
1.015	4,4-дифторбут-1-ил
1.016	2,2,3,3-тетрафторпроп-1-іл
1.017	2,2,3,3,3-пентафторпроп-1-іл

10 Додаткові сполуки за даним винаходом указані за допомогою додаткових таблиць, представлених нижче. У кожній таблиці розкриті різні варіанти n, R^1 і R^2 , і їх треба інтерпретувати як такі, що розкривають варіанти A, показані в таблиці 1 вище. Таким чином, у таблиці 2 розкриті сполуки 2.001-2.017, в таблиці 3 розкриті сполуки 3.001-3.017, тощо.

Таблиця 2

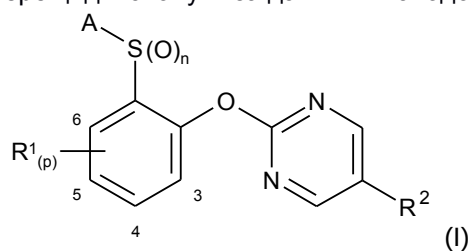
	n	R^1	R^2
2	1	H	Cl
3	2	H	Cl
4	0	F	Cl
5	1	F	Cl
6	2	F	Cl
7	0	Cl	Cl
8	1	Cl	Cl
9	2	Cl	Cl
10	0	Br	Cl
11	1	Br	Cl
12	2	Br	Cl
13	0	CN	Cl

Таблиця 2

	n	R ¹	R ²
14	1	CN	Cl
15	2	CN	Cl
16	0	H	Br
17	1	H	Br
18	2	H	Br
19	0	F	Br
20	1	F	Br
21	2	F	Br
22	0	Cl	Br
23	1	Cl	Br
24	2	Cl	Br
25	0	Br	Br
26	1	Br	Br
27	2	Br	Br
28	0	CN	Br
29	1	CN	Br
30	2	CN	Br
31	0	H	F
32	1	H	F
33	2	H	F
34	0	F	F
35	1	F	F
36	2	F	F
37	0	Cl	F
38	1	Cl	F
39	2	Cl	F
40	0	Br	F
41	1	Br	F
42	2	Br	F
43	0	CN	F
44	1	CN	F
45	2	CN	F

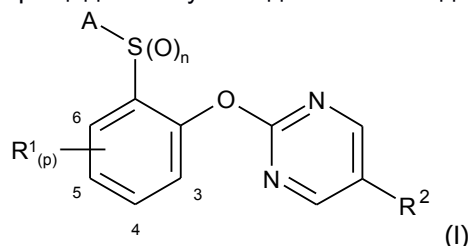
Таблиця С1

Гербіцидні сполуки за даним винаходом



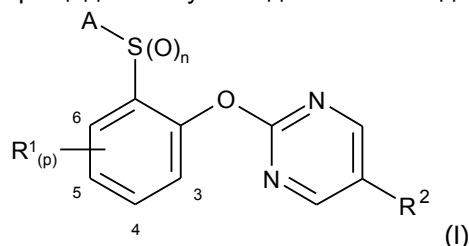
Сполука	n	A	R ²	R ¹	¹ H ЯМР (400 МГц, CDCl ₃ , якщо не вказано інше)
A1	0	3,3,3-трифторпроп-1-іл	Cl	-	8,48 (s, 2H), 7,51 (dd, 1H), 7,42 - 7,36 (m, 1H), 7,33 - 7,27 (m, 1H), 7,21 (dd, 1H), 3,04 - 2,97 (m, 2H), 2,42 - 2,27 (m, 2H)
A2	1	3,3,3-трифторпроп-1-іл	Cl	-	8,52 (s, 2H), 7,92 (dd, 1H), 7,64 - 7,58 (m, 1H), 7,58 - 7,52 (m, 1H), 7,23 (dd, 1H), 3,28 (ddd, 1H), 3,06 (ddd, 1H), 2,75 - 2,58 (m, 1H), 2,26 - 2,10 (m, 1H)

Гербіцидні сполуки за даним винаходом



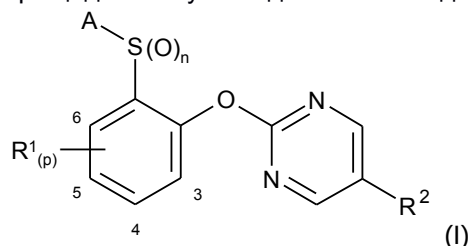
Сполука	n	A	R ²	R ¹	¹ H ЯМР (400 МГц, CDCl ₃ , якщо не вказано інше)
A3	2	3,3,3-трифторпроп-1-іл	Cl	-	8,49 (s, 2H), 8,06 (dd, 1H), 7,79 (dt, 1H), 7,52 (dt, 1H), 7,38 (dd, 1H), 3,66 - 3,58 (m, 2H), 2,63 - 2,50 (m, 2H)
A4	0	4,4,4-трифторбут-1-ил	Cl	-	8,48 (s, 2H), 7,48 (dd, 1H), 7,40 - 7,31 (m, 1H), 7,31 - 7,24 (m, 1H), 7,19 (dd, 1H), 2,92 (t, 2H), 2,25 - 2,12 (m, 2H), 1,85 - 1,77 (m, 2H)
A5	1	4,4,4-трифторбут-1-ил	Cl	-	8,51 (s, 2H), 7,95 (dd, 1H), 7,70 - 7,48 (m, 2H), 7,21 (dd, 1H), 3,10 (br d, 1H), 3,01 - 2,85 (m, 1H), 2,37 - 1,77 (m, 4H)
A6	2	4,4,4-трифторбут-1-ил	Cl	-	8,49 (s, 2H), 8,07 (dd, 1H), 7,77 (dt, 1H), 7,51 (dt, 1H), 7,36 (dd, 1H), 3,48 (t, 2H), 2,36 - 2,21 (m, 2H), 2,07 - 1,96 (m, 2H)
A7	0	3,3,3-трифторпроп-1-іл	Cl	6-F	8,48 (s, 2H), 7,43 (dt, 1H), 7,14 - 7,05 (m, 2H), 2,98 - 2,92 (m, 2H), 2,35 - 2,23 (m, 2H)
A8	1	3,3,3-трифторпроп-1-іл	Cl	6-F	8,49 (s, 2H), 7,60 (dt, 1H), 7,18 (ddd, 1H), 7,10 - 7,05 (m, 1H), 3,73 - 3,64 (m, 1H), 3,34 - 3,25 (m, 1H), 2,66 - 2,54 (m, 2H)
A9	2	3,3,3-трифторпроп-1-іл	Cl	6-F	8,49 (s, 2H), 7,74 (dt, 1H), 7,28 - 7,22 (m, 1H), 7,16 (td, 1H), 3,62 - 3,55 (m, 2H), 2,70 - 2,57 (m, 2H)
A10	0	3,3,3-трифторпроп-1-іл	Cl	6-Cl	8,48 (s, 2H), 7,49 - 7,43 (m, 1H), 7,43 - 7,37 (m, 1H), 7,18 (dd, 1H), 3,01 - 2,95 (m, 2H), 2,36 - 2,23 (m, 2H)
A11	1	3,3,3-трифторпроп-1-іл	Cl	6-Cl	8,46 (s, 2H), 7,57 - 7,50 (m, 1H), 7,40 (dd, 1H), 7,19 (dd, 1H), 3,68 (ddd, 1H), 3,33 (ddd, 1H), 2,71 - 2,55 (m, 2H)
A12	2	3,3,3-трифторпроп-1-іл	Cl	6-Cl	8,48 (s, 2H), 7,68 - 7,62 (m, 1H), 7,55 (dd, 1H), 7,28 - 7,23 (m, 1H), 3,70 - 3,63 (m, 2H), 2,70 - 2,58 (m, 2H)
A13	0	3,3,3-трифторпроп-1-іл	Cl	6-CN	8,49 (s, 2H), 7,69 (dd, 1H), 7,57 (t, 1H), 7,48 (dd, 1H), 3,16 - 3,06 (m, 2H), 2,44 - 2,28 (m, 2H)
A14	1	3,3,3-трифторпроп-1-іл	Cl	6-CN	8,51 (s, 2H), 7,82 (dd, 1H), 7,72 (t, 1H), 7,48 (dd, 1H), 3,52 (ddd, 1H), 3,35 (ddd, 1H), 2,83 - 2,65 (m, 1H), 2,55 (m, 1H)
A15	2	3,3,3-трифторпроп-1-іл	Cl	6-CN	8,50 (s, 2H), 7,92 - 7,85 (m, 2H), 7,62 (dd, 1H), 3,76 - 3,70 (m, 2H), 2,75 - 2,63 (m, 2H)

Гербіцидні сполуки за даним винаходом



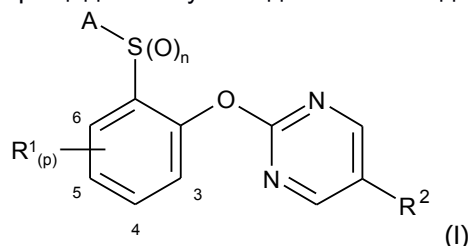
Сполука	n	A	R ²	R ¹	¹ H ЯМР (400 МГц, CDCl ₃ , якщо не вказано інше)
A16	0	бензил	Cl	-	8,46 (s, 2H), 7,39 - 7,35 (m, 1H), 7,35 - 7,28 (m, 1H), 7,28 - 7,16 (m, 7H), 4,06 (s, 2H)
A17	2	CH ₂ (4-тіазоліл)	Cl	-	8,68 (d, 1H), 8,50 (s, 2H), 7,79 (dd, 1H), 7,74 - 7,66 (m, 1H), 7,40 - 7,33 (m, 3H), 4,95 (s, 2H)
A18	0	CH ₂ (4-тіазоліл)	Cl	-	8,73 (d, 1H), 8,48 (s, 2H), 7,43 - 7,35 (m, 1H), 7,32 (s, 1H), 7,22 - 7,15 (m, 2H), 7,07 - 7,03 (m, 1H), 4,26 (s, 2H)
A19	2	бензил	Cl	-	8,51 (s, 2H), 7,70 - 7,65 (m, 2H), 7,36 - 7,21 (m, 7H), 4,64 (s, 2H)
A20	2	1-бутил	Cl	-	8,48 (s, 2H), 8,06 (dd, 1H), 7,74 (dt, 1H), 7,49 (dt, 1H), 7,33 (dd, 1H), 3,43 - 3,36 (m, 2H), 1,72 - 1,61 (m, 2H), 1,46 - 1,37 (m, 2H), 0,90 (t, 3H)
A21	0	1-бутил	Cl	-	8,47 (s, 2H), 7,45 (dd, 1H), 7,32 - 7,22 (m, 2H), 7,20 - 7,12 (m, 1H), 2,89 - 2,84 (m, 2H), 1,60 - 1,50 (m, 2H), 1,44 - 1,33 (m, 2H), 0,88 (t, 3H)
A22	1	1-бутил	Cl	-	8,51 (s, 2H), 7,96 (dd, 1H), 7,59 - 7,49 (m, 2H), 7,19 (dd, 1H), 3,03 (m, 1H), 2,86 (m, 1H), 1,91 - 1,69 (m, 1H), 1,63 - 1,52 (m, 1H), 1,52 - 1,30 (m, 2H), 0,90 (t, 3H)
A23	1	бензил	Cl	-	8,52 (s, 2H), 7,54 - 7,47 (m, 2H), 7,36 - 7,29 (m, 1H), 7,28 - 7,19 (m, 4H), 7,09 - 7,03 (m, 2H), 4,31 (d, 1H), 4,02 (d, 1H)
A24	2	4,4,4-трифторбут-1-ил	Cl	6-Cl	8,47 (s, 2H), 7,62 (t, 1H), 7,56 - 7,50 (m, 1H), 7,24 (dd, 1H), 3,52 (t, 2H), 2,37 - 2,25 (m, 2H), 2,14 - 2,04 (m, 2H)
A25	0	4,4,4-трифторбут-1-ил	Cl	6-Cl	8,48 (s, 2H), 7,47 - 7,40 (m, 1H), 7,40 - 7,33 (m, 1H), 7,16 (dd, 1H), 2,91 (t, 2H), 2,29 - 2,16 (m, 2H), 1,77 - 1,66 (m, 2H)
A26	1	4,4,4-трифторбут-1-ил	Cl	6-Cl	8,46 (s, 2H), 7,55 - 7,48 (m, 1H), 7,39 (dd, 1H), 7,18 (dd, 1H), 3,67 - 3,54 (m, 1H), 3,20 (td, 1H), 2,41 - 2,21 (m, 2H), 2,17 - 2,00 (m, 2H)
A27	0	CH ₂ (4-Cl-C ₆ H ₄)	Cl	-	8,46 (s, 2H), 7,38 - 7,29 (m, 2H), 7,21 - 7,11 (m, 6H), 4,01 (s, 2H)
A28	0	4,4,4-трифторбут-1-ил	Cl	6-CN	8,48 (s, 2H), 7,66 (dd, 1H), 7,53 (t, 1H), 7,48 - 7,42 (m, 1H), 3,05 - 2,99 (m, 2H), 2,35 - 2,17 (m, 2H), 1,81 - 1,72 (m, 2H)

Гербіцидні сполуки за даним винаходом



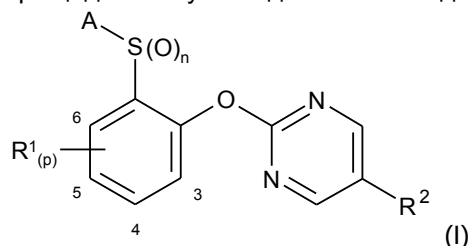
Сполука	n	A	R ²	R ¹	¹ H ЯМР (400 МГц, CDCl ₃ , якщо не вказано інше)
A29	1	4,4,4-трифторбут-1-ил	Cl	6-CN	8,50 (s, 2H), 7,80 (dd, 1H), 7,70 (t, 1H), 7,47 (dd, 1H), 3,50 - 3,41 (m, 1H), 3,23 - 3,12 (m, 1H), 2,40 - 2,25 (m, 2H), 2,19 - 2,06 (m, 2H)
A30	2	4,4,4-трифторбут-1-ил	Cl	6-CN	8,49 (s, 2H), 7,90 - 7,83 (m, 2H), 7,61 (dd, 1H), 3,59 (t, 2H), 2,42 - 2,29 (m, 2H), 2,16 - 2,07 (m, 2H)
A31	1	2-пентил	Cl	-	Характеристичні сигнали: 8,52 - 8,48 (m, 2H), 7,96 - 7,87 (m, 1H), 7,59 - 7,48 (m, 2H), 7,22 - 7,16 (m, 1H)
A32	2	2-пентил	Cl	-	8,47 (s, 2H), 8,05 (dd, 1H), 7,73 (dt, 1H), 7,48 (dt, 1H), 7,32 (dd, 1H), 3,62 - 3,54 (m, 1H), 1,90 - 1,69 (m, 1H), 1,56 - 1,42 (m, 2H), 1,28 (m, 4H), 0,90 (t, 3H)
A33	0	2-пентил	Cl	-	8,47 (s, 2H), 7,52 (dd, 1H), 7,38 - 7,29 (m, 1H), 7,28 - 7,21 (m, 1H), 7,21 - 7,16 (m, 1H), 3,33 - 3,23 (m, 1H), 1,58 - 1,31 (m, 4H), 1,20 (d, 3H), 0,86 (s, 3H)
A34	2	CH ₂ (4-Cl-C ₆ H ₄)	Cl	-	8,51 (s, 2H), 7,74 - 7,67 (m, 2H), 7,42 - 7,31 (m, 2H), 7,25 - 7,16 (m, 4H), 4,62 (s, 2H)
A35	2	CH ₂ (4-CN-C ₆ H ₄)	Cl	-	8,51 (s, 2H), 7,76 - 7,69 (m, 2H), 7,59 - 7,53 (m, 2H), 7,41 - 7,34 (m, 4H), 4,70 (s, 2H)
A36	0	CH ₂ (4-CN-C ₆ H ₄)	Cl	-	8,47 (s, 2H), 7,54 - 7,48 (m, 2H), 7,38 - 7,23 (m, 4H), 7,23 - 7,11 (m, 2H), 4,06 (s, 2H)
A37	0	E-CH ₂ CH=CHCl	Cl	-	8,48 (s, 2H), 7,48 (dd, 1H), 7,41 - 7,34 (m, 1H), 7,30 - 7,23 (m, 1H), 7,20 (dd, 1H), 5,99 - 5,85 (m, 2H), 3,47 (dd, 2H)
A38	2	E-CH ₂ CH=CHCl	Cl	-	8,49 (s, 2H), 8,01 (dd, 1H), 7,79 - 7,72 (m, 1H), 7,50 (dt, 1H), 7,35 (dd, 1H), 6,23 (dt, 1H), 5,88 (dt, 1H), 4,13 (dd, 2H)
A39	0	5,5,5-трифторпент-1-ил	Cl	6-CN	8,47 (s, 2H), 7,65 (dd, 1H), 7,52 (t, 1H), 7,49 - 7,42 (m, 1H), 2,97 (t, 2H), 2,13 - 1,99 (m, 2H), 1,67 - 1,56 (m, 4H)
A40	0	6,6,6-трифторгект-1-ил	Cl	6-CN	8,48 (s, 2H), 7,65 (dd, 1H), 7,53 - 7,47 (m, 1H), 7,47 - 7,42 (m, 1H), 2,96 (t, 2H), 2,11 - 1,97 (m, 2H), 1,58 - 1,44 (m, 6H)

Гербіцидні сполуки за даним винаходом



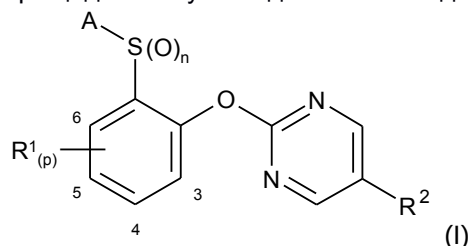
Сполука	n	A	R ²	R ¹	¹ H ЯМР (400 МГц, CDCl ₃ , якщо не вказано інше)
A41	0	2-метоксиетил	Cl	-	8,48 (s, 2H), 7,53 (d, 1H), 7,32 (t, 1H), 7,25 (t, 1H), 7,17 (d, 1H), 3,53 (t, 2H), 3,31 (s, 3H), 3,04 (t, 2H)
A42	2	2-метоксиетил	Cl	-	8,48 (s, 2H), 8,06 (d, 1H), 7,72 (d, 1H), 7,48 (t, 1H), 7,32 (d, 1H), 3,76 (t, 2H), 3,68 (t, 2H)
A43	2	пент-1-ил	Cl	-	8,48 (s, 2H), 8,06 (d, 1H), 7,73 (t, 1H), 7,48 (t, 1H), 7,33 (d, 1H), 3,48 (t, 2H), 1,72-1,65 (m, 2H), 1,39-1,25 (m, 4H), 0,87 (t, 3H)
A44	0	пент-1-ил	Cl	-	8,48 (s, 2H), 7,44 (d, 1H), 7,29-7,21 (m, 2H), 7,15 (d, 1H), 2,85 (t, 2H), 1,60-1,52 (m, 2H), 1,35-1,22 (m, 4H), 0,86 (t, 3H)
A45	0	проп-2-ініл	Cl	-	8,48 (s, 2H), 7,64 (d, 1H), 7,36 (t, 1H), 7,27 (t, 1H), 7,20 (d, 1H), 3,58 (s, 2H), 2,20 (t, 1H)
A46	2	проп-2-ініл	Cl	-	8,48 (s, 2H), 8,13 (d, 1H), 7,76 (t, 1H), 7,50 (t, 1H), 7,35 (d, 1H), 4,30 (s, 2H), 2,29 (t, 1H)
A47	0	аліл	Cl	-	8,48 (s, 2H), 7,47 (d, 1H), 7,31 (t, 1H), 7,25 (t, 1H), 7,15 (d, 1H), 5,85-5,75 (m, 1H), 5,12 (d, 1H), 5,04 (d, 1H), 3,51 (d, 2H)
A48	2	аліл	Cl	-	8,49 (s, 2H), 8,00 (d, 1H), 7,71 (t, 1H), 7,45 (t, 1H), 7,33 (d, 1H), 5,81-5,73 (m, 1H), 5,31-5,25 (m, 2H), 4,13 (d, 2H)
A49	0	проп-1-іл	Cl	-	8,48 (s, 2H), 7,45 (d, 1H), 7,31-7,22 (m, 2H), 7,15 (d, 1H), 2,84 (t, 2H), 1,62-1,55 (m, 2H), 0,96 (t, 3H)
A50	2	проп-1-іл	Cl	-	8,48 (s, 2H), 8,06 (d, 1H), 7,72 (t, 1H), 7,48 (t, 1H), 7,32 (d, 1H), 3,37 (t, 2H), 1,75-1,70 (m, 2H), 1,01 (t, 3H)
A51	2	CH ₂ циклопропіл	Cl	-	8,48 (s, 2H), 8,11 (d, 1H), 7,73 (t, 1H), 7,48 (t, 1H), 7,31 (t, 1H), 3,33 (d, 2H), 1,05-0,97 (m, 1H), 0,55-0,49 (m, 2H), 0,23-0,20 (m, 2H)
A52	0	3-метилбут-2-еніл	Cl	-	8,48 (s, 2H), 7,46 (d, 1H), 7,31 (t, 1H), 7,24 (t, 1H), 7,15 (d, 1H), 5,22 (t, 1H), 3,49 (d, 2H), 1,68 (s, 3H), 1,55 (s, 3H)
A53	0	гекс-1-ил	Cl	-	8,48 (s, 2H), 7,45 (d, 1H), 7,30-7,21 (m, 2H), 7,15 (d, 1H), 2,85 (t, 2H), 1,60-1,52 (m, 2H), 1,38-1,30 (m, 2H), 1,29-1,18 (m, 4H), 0,86 (t, 3H)

Гербіцидні сполуки за даним винаходом



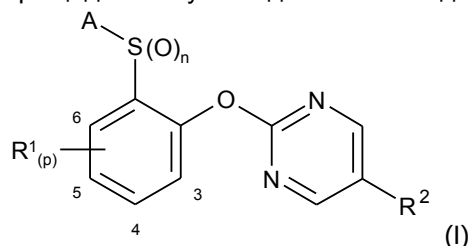
Сполука	n	A	R ²	R ¹	¹ H ЯМР (400 МГц, CDCl ₃ , якщо не вказано інше)
A54	0	CH ₂ CH ₂ OCF ₃	Cl	-	8,48 (s, 2H), 7,55 (dd, 1H), 7,39 (t, 1H), 7,30 (t, 1H), 7,21 (dd, 1H), 4,02 (t, 2H), 3,13 (t, 2H)
A55	0	CH ₂ CF ₃	Cl	-	8,49 (s, 2H), 7,63 (d, 1H), 7,44 (t, 1H), 7,26 (t, 1H), 7,20 (d, 1H), 3,42 (q, 2H)
A56	0	3-метоксипроп-1-іл	Cl	-	8,48 (s, 2H), 7,48 (d, 1H), 7,32-7,24 (m, 2H), 7,16 (d, 1H), 3,40 (t, 2H), 3,30 (s, 3H), 2,94 (t, 2H), 1,85-1,80 (m, 2H)
A57	0	2-(4-хлорпіразол-1-іл)етил	Cl	-	8,49 (s, 2H), 7,50 (d, 1H), 7,40 (s, 1H), 7,38-7,34 (m, 3H), 7,25 (t, 1H), 7,20 (d, 1H), 4,20 (t, 2H), 3,25 (t, 2H)
A58	0	CH ₂ циклогексил	Cl	-	8,48 (s, 2H), 7,43 (d, 1H), 7,29-7,20 (m, 2H), 7,15 (d, 1H), 2,75 (d, 2H), 1,84-1,80 (m, 2H), 1,71-1,60 (m, 3H), 1,50-1,40 (m, 1H), 1,25-1,10 (m, 3H), 0,95-0,85 (m, 2H)
A59	0	3-фторпроп-1-іл	Cl	-	8,48 (s, 2H), 7,49 (d, 1H), 7,33 (t, 1H), 7,25 (t, 1H), 7,15 (d, 1H), 4,55 (t, 1H), 4,45 (t, 1H), 3,00 (t, 2H), 1,98-1,88 (m, 2H)
A60	0	2-фторетил	Cl	-	8,48 (s, 2H), 7,55 (d, 1H), 7,35 (t, 1H), 7,26 (t, 1H), 7,18 (d, 1H), 4,55 (t, 1H), 4,45 (t, 1H), 3,20-3,10 (m, 2H)
A61	0	2,2-дифторетил	Cl	-	8,48 (s, 2H), 7,60 (d, 1H), 7,41 (t, 1H), 7,25 (t, 1H), 7,20 (d, 1H), 5,85 (dt, 1H), 3,19 (dq, 2H)
A62	0	2-метилаліл	Cl	-	8,48 (s, 2H), 7,45 (d, 1H), 7,30 (t, 1H), 7,22 (t, 1H), 7,15 (d, 1H), 4,78 (d, 2H), 3,45 (s, 2H), 1,80 (s, 3H)
A63	0	4-метилпент-3-еніл	Cl	-	8,48 (s, 2H), 7,46 (d, 1H), 7,30-7,20 (m, 2H), 7,15 (d, 1H), 5,10 (t, 1H), 2,85 (t, 2H), 2,25 (q, 2H), 1,66 (s, 3H), 1,55 (s, 3H)
A64	0	2-етилбут-1-ил	Cl	-	8,48 (s, 2H), 7,45 (d, 1H), 7,30-7,21 (m, 2H), 7,13 (d, 1H), 2,85 (d, 2H), 1,46-1,30 (m, 5H), 0,84 (t, 6H)
A65	0	втор-бутил	Cl	-	8,48 (s, 2H), 7,54 (d, 1H), 7,33 (t, 1H), 7,23 (t, 1H), 7,18 (d, 1H), 3,27-3,20 (m, 1H), 1,62-1,55 (m, 1H), 1,50-1,43 (m, 1H), 1,20 (d, 3H), 0,92 (t, 3H)
A66	0	(3-хлорфеніл)метил	Cl	-	8,47 (s, 2H), 7,36-7,30 (m, 2H), 7,20-7,12 (m, 5H), 7,06 (d, 1H), 4,01 (s, 2H)
A67	0	(2-хлорфеніл)метил	Cl	-	8,45 (s, 2H), 7,38-7,30 (m, 3H), 7,20-7,05 (m, 5H), 4,14 (s, 2H)

Гербіцидні сполуки за даним винаходом



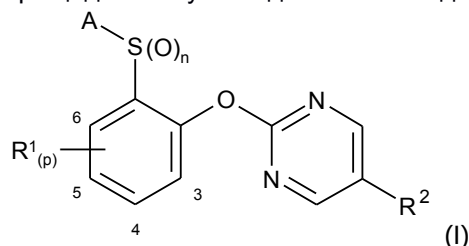
Сполука	n	A	R ²	R ¹	¹ H ЯМР (400 МГц, CDCl ₃ , якщо не вказано інше)
A68	0	3,4,4-трифторбут-3-еніл	Cl	-	8,48 (s, 2H), 7,50 (d, 1H), 7,34 (t, 1H), 7,25 (t, 1H), 7,20 (d, 1H), 3,04 (t, 2H), 2,59-2,45 (m, 2H)
A69	0	2-метилпент-1-ил	Cl	-	8,48 (s, 2H), 7,45 (d, 1H), 7,30-7,20 (m, 2H), 7,14 (d, 1H), 2,88 (dd, 1H), 2,66 (dd, 1H), 1,70-1,60 (m 1H), 1,40-1,10 (m, 4H), 0,94 (d, 3H), 0,85 (t, 3H)
A70	0	ізопентил	Cl	-	8,48 (s, 2H), 7,45 (d, 1H), 7,31-7,22 (m, 2H), 7,15 (d, 1H), 2,86 (t, 2H), 1,7-1,62 (m, 1H), 1,48-1,40 (m, 2H), 0,85 (d, 6H)
A71	0	бут-3-еніл	Cl	-	8,48 (s, 2H), 7,48 (d, 1H), 7,32-7,20 (m, 2H), 7,17 (d, 1H), 5,82-5,73 (m, 1H), 5,05-5,00 (m, 2H), 2,92 (t, 2H), 2,30 (q, 2H)
A72	0	ізобутил	Cl	-	8,48 (s, 2H), 7,45 (d, 1H), 7,30-7,20 (m, 2H), 7,15 (d, 1H), 2,75 (d, 2H), 1,81-1,70 (m, 1H), 0,98 (d, 6H)
A73	2	3,4,4-трифторбут-3-еніл	Cl	-	8,49 (s, 2H), 8,08 (dd, 1H), 7,76 (t, 1H), 7,51 (t, 1H), 7,35 (d, 1H), 3,62 (t, 2H), 2,80-2,70 (m, 2H)
A74	2	2-метилпент-1-ил	Cl	-	8,48 (s, 2H), 8,08 (d, 1H), 7,72 (t, 1H), 7,48 (t, 1H), 7,32 (d, 1H), 3,45 (dd, 1H), 3,23 (dd, 1H), 2,11-2,05 (m, 1H), 1,45-1,20 (m, 4H), 1,04 (d, 3H), 0,83 (t, 3H)
A75	2	ізопентил	Cl	-	8,48 (s, 2H), 8,05 (dd, 1H), 7,74 (t, 1H), 7,48 (t, 1H), 7,32 (d, 1H), 3,41-3,36 (m, 2H), 1,70-1,61 (m, 1H), 1,60-1,52 (m, 2H), 0,90 (d, 6H)
A76	2	ізобутил	Cl	-	8,48 (s, 2H), 8,06 (dd, 1H), 7,71 (t, 1H), 7,49 (t, 1H), 7,31 (d, 1H), 3,31 (d, 2H), 2,25-2,18 (m, 1H), 1,05 (d, 6H)
A77	2	гекс-1-ил	Cl	-	8,48 (s, 2H), 8,05 (dd, 1H), 7,72 (t, 1H), 7,48 (t, 1H), 7,33 (d, 1H), 3,41-3,35 (m, 2H), 1,70-1,65 (m, 2H), 1,40-1,35 (m, 2H), 1,25-1,20 (m, 4H), 0,85 (t, 3H)
A78	2	2,2,2-трифторетил	Cl	-	8,49 (s, 2H), 8,11 (dd, 1H), 7,80 (t, 1H), 7,52 (t, 1H), 7,48 (d, 1H), 4,26 (q, 2H)

Гербіцидні сполуки за даним винаходом



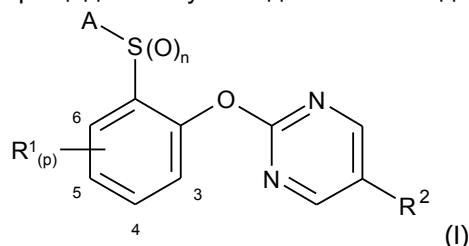
Сполука	n	A	R ²	R ¹	¹ H ЯМР (400 МГц, CDCl ₃ , якщо не вказано інше)
A79	2	3-метоксипроп-1-іл	Cl	-	8,48 (s, 2H), 8,05 (dd, 1H), 7,72 (t, 1H), 7,49 (t, 1H), 7,31 (d, 1H), 3,51-3,45 (m, 2H), 3,42 (t, 2H), 3,29 (s, 3H), 1,99-1,92 (m, 2H)
A80	2	2-(4-хлорпіразол-1-іл)етил	Cl	-	8,48 (s, 2H), 7,90 (dd, 1H), 7,70 (t, 1H), 7,44 (t, 1H), 7,35 (s, 1H), 7,30 (d, 1H), 7,21 (s, 1H), 4,52 (t, 2H), 4,01 (t, 2H)
A81	2	CH ₂ циклогексил	Cl	-	8,48 (s, 2H), 8,07 (dd, 1H), 7,73 (t, 1H), 7,48 (t, 1H), 7,31 (d, 1H), 3,30 (d, 2H), 2,02-1,91 (m, 1H), 1,88-1,80 (m, 2H), 1,70-1,58 (m, 4H), 1,28-1,02 (m, 4H)
A82	2	3-фторпроп-1-іл	Cl	-	8,49 (s, 2H), 8,08 (dd, 1H), 7,73 (t, 1H), 7,50 (t, 1H), 7,33 (d, 1H), 4,58 (t, 1H), 4,48 (t, 1H), 3,54 (t, 2H), 2,20-2,05 (m, 2H)
A83	2	2-фторетил	Cl	-	8,48 (s, 2H), 8,08 (dd, 1H), 7,75 (t, 1H), 7,50 (t, 1H), 7,35 (d, 1H), 4,87 (t, 1H), 4,75 (t, 1H), 3,85 (t, 1H), 3,81 (t, 1H)
A84	2	2,2-дифторетил	Cl	-	8,49 (s, 2H), 8,05 (dd, 1H), 7,89 (t, 1H), 7,51 (t, 1H), 7,38 (d, 1H), 6,22 (tt, 1H), 4,01 (dt, 2H)
A85	2	2-метилаліл	Cl	-	8,48 (s, 2H), 8,08 (dd, 1H), 7,75 (t, 1H), 7,51 (t, 1H), 7,34 (d, 1H), 3,85 (d, 1H), 3,40 (d, 1H), 2,85 (d, 1H), 2,53 (d, 1H), 1,52 (s, 3H)
A86	2	4-метилпент-3-еніл	Cl	-	8,48 (s, 2H), 8,04 (dd, 1H), 7,73 (t, 1H), 7,48 (t, 1H), 7,33 (d, 1H), 3,67 (t, 2H), 2,95 (t, 2H), 2,66-2,58 (m, 1H), 1,12 (s, 3H), 1,10 (s, 3H)
A87	2	2-етилбут-1-ил	Cl	-	8,48 (s, 2H), 8,07 (dd, 1H), 7,72 (t, 1H), 7,48 (t, 1H), 7,33 (d, 1H), 3,35 (d, 2H), 1,90-1,85 (m, 1H), 1,48-1,40 (m, 4H), 0,84 (t, 6H)
A88	2	втор-бутил	Cl	-	8,48 (s, 2H), 8,04 (dd, 1H), 7,73 (t, 1H), 7,48 (t, 1H), 7,32 (d, 1H), 3,55-3,45 (m, 1H), 1,98-1,85 (m, 1H), 1,60-1,50 (m, 1H), 1,30 (d, 3H), 1,01 (t, 3H)
A89	2	(3-хлорфеніл)метил	Cl	-	8,51 (s, 2H), 7,75-7,65 (m, 2H), 7,37-7,32 (m, 2H), 7,28-7,26 (m, 2H), 7,20-7,12 (m, 2H), 4,62 (s, 2H)
A90	2	(2-хлорфеніл)метил	Cl	-	8,49 (s, 2H), 7,77-7,68 (m, 2H), 7,38-7,30 (m, 4H), 7,27-7,15 (m, 2H), 4,85 (s, 2H)

Гербіцидні сполуки за даним винаходом



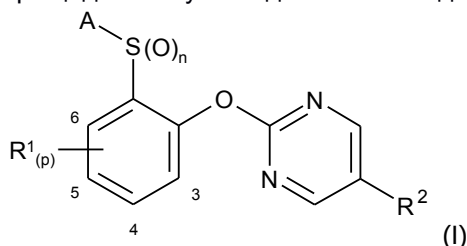
Сполука	n	A	R ²	R ¹	¹ H ЯМР (400 МГц, CDCl ₃ , якщо не вказано інше)
A91	2	5,5,5-трифторпент-1-ил	Cl	2-CN	8,48 (s, 2H), 7,90 - 7,81 (m, 2H), 7,59 (dd, 1H), 3,56 - 3,49 (m, 2H), 2,22 - 2,07 (m, 2H), 1,93 (quin, 2H), 1,81 - 1,70 (m, 2H)
A92	2	6,6,6-трифторгект-1-ил	Cl	2-CN	8,51 - 8,45 (m, 2H), 7,91 - 7,80 (m, 2H), 7,58 (dd, , 1H), 3,55 - 3,46 (m, 2H), 2,16 - 1,99 (m, 2H), 1,93 - 1,78 (m, 2H), 1,66 - 1,50 (m, 4H)
A93	0	1,1,2,2,3,3,3-гептафторпроп-1-іл	Cl	2-CN	8,48 (s, 2H), 7,70-7,77 (m, 2H), 7,55-7,57 (dd, 1H)
A94	0	3,3-дифторпроп-1-іл	Cl	2-Cl	8,48 (s, 2H), 7,44 (d, 1H), 7,38 (t, 1H), 7,17 (d, 1H), 5,93 (tt, 1H), 2,93 (t, 2H), 2,06-1,91 (m, 2H)
A95	1	3,3-дифторпроп-1-іл	Cl	2-Cl	8,46 (s, 2H), 7,51 (t, 1H), 7,38 (d, 1H), 7,17 (d, 1H), 6,00 (tt, 1H), 3,65-3,57 (m, 1H), 3,33-3,23 (m, 1H), 2,42-2,38 (m, 2H)
A96	2	3,3-дифторпроп-1-іл	Cl	2-Cl	8,48 (s, 2H), 7,61 (t, 1H), 7,52 (d, 1H), 7,22 (d, 1H), 6,00 (tt, 1H), 3,60 (t, 2H), 2,42-2,28 (m, 2H)
A97	2	3,3-дифторпроп-1-іл	Cl	2-CN	8,48 (s, 2H), 7,90-7,81 (m, 2H), 7,59 (d, 1H), 6,03 (tt, 1H), 3,68 (t, 2H), 2,48-2,31 (m, 2H)
A98	1	3,3-дифторпроп-1-іл	Cl	2-CN	8,49 (s, 2H), 7,79 (d, 1H), 7,69 (t, 1H), 7,46 (d, 1H), 6,01 (tt, 1H), 3,51-3,41 (m, 1H), 3,34-3,23 (m, 1H), 2,53-2,21 (m, 2H)
A99	0	3,3-дифторпроп-1-іл	Cl	2-CN	8,48 (s, 2H), 7,68 (d, 1H), 7,56 (t, 1H), 7,48 (d, 1H), 5,94 (tt, 1H), 3,06 (t, 2H), 2,12-1,98 (m, 2H)
A100	0	4,4-дифторбут-1-ил	Cl	2-CN	8,48 (s, 2H), 7,63 (d, 1H), 7,52 (t, 1H), 7,42 (d, 1H), 5,79 (tt, 1H), 2,99 (t, 2H), 2,01-1,85 (m, 2H), 1,71-1,61 (m, 2H)
A101	1	4,4-дифторбут-1-ил	Cl	2-CN	8,49 (s, 2H), 7,78 (d, 1H), 7,67 (t, 1H), 7,43 (d, 1H), 5,84 (tt, 1H), 3,49-3,39 (m, 1H), 3,22-3,12 (m, 1H), 2,12-1,91 (m, 4H)
A102	2	4,4-дифторбут-1-ил	Cl	2-CN	8,48 (s, 2H), 7,89-7,78 (m, 2H), 7,57 (d, 1H), 5,86 (tt, 1H), 3,54 (t, 2H), 2,12-1,98 (m, 4H)
A103	2	4,4-дифторбут-1-ил	Cl	2-Cl	8,48 (s, 2H), 7,60 (t, 1H), 7,52 (d, 1H), 7,21 (d, 1H), 5,81 (tt, 1H), 3,49 (t, 2H), 2,08-1,92 (m, 4H)

Гербіцидні сполуки за даним винаходом



Сполука	n	A	R ²	R ¹	¹ H ЯМР (400 МГц, CDCl ₃ , якщо не вказано інше)
A104	1	4,4-дифторбут-1-ил	Cl	2-Cl	8,45 (s, 2H), 7,50 (t, 1H), 7,38 (d, 1H), 7,16 (d, 1H), 5,84 (tt, 1H), 3,61-3,52 (m, 1H), 3,24-3,15 (m, 1H), 2,11-1,89 (m, 4H)
A105	0	4,4-дифторбут-1-ил	Cl	2-Cl	8,47 (s, 2H), 7,41 (d, 1H), 7,33 (t, 1H), 7,13 (d, 1H), 5,78 (tt, 1H), 2,89 (t, 2H), 2,00-1,85 (m, 2H), 1,67-1,58 (m, 2H)
A106	0	2-трифторметоксиетил	Cl	2-CN	8,49 (s, 2H), 7,65 (d, 1H), 7,53 (t, 1H), 7,45 (d, 1H), 4,05 (t, 2H), 3,22 (t, 2H)
A107	0	2-(2,2,2-трифторетокси)етил	Cl	2-CN	8,51 - 8,45 (m, 2H), 7,65 (dd, 1H), 7,53 (t, 1H), 7,48 - 7,42 (m, 1H), 3,89 - 3,69 (m, 4H), 3,14 (t, 2H)
A108	2	2-(2,2,2-трифторетокси)етил	Cl	2-CN	8,52 - 8,46 (m, 2H), 7,85 - 7,77 (m, 2H), 7,56 (dd, 1H), 4,17 - 4,07 (m, 2H), 3,84 - 3,79 (m, 2H), 3,75 (q, 2H)
A109	2	1,1,2,2,3,3,3-гептафторпроп-1-іл	Cl	2-CN	8,48 (s, 2H), 7,70-7,78 (m, 2H), 7,55-7,57 (dd, 1H)
A110	0	2,2,3,3,3-пентафторпроп-1-іл	Cl	2-CN	8,48 (s, 2H), 7,65-7,67 (d, 1H), 7,54-7,58 (t, 1H), 7,46-7,47 (d, 1H), 3,52 (t, 2H)
A111	0	2,2,3,3-тетрафторпроп-1-іл	Cl	2-CN	8,47 (s, 2H), 7,65-7,66 (d, 1H), 7,54-7,58 (t, 1H), 7,46-7,48 (d, 1H), 6,06 (t, 1H), 3,46 (t, 2H)
A112	2	4,4,4-трифторбут-1-ил	OCH ₃	2-CN	8,19 - 8,23 (m, 2H) 7,78 - 7,85 (m, 2H) 7,58 (dd, 1H), 3,90 (s, 3H) 3,61 (t, 2H) 2,28 - 2,42 (m, 2H) 2,07 - 2,19 (m, 2H)
A113	0	4,4,4-трифторбут-1-ил	OCH ₃	2-CN	8,21 (s, 2H) 7,62 (dd, 1H) 7,47 - 7,52 (m, 1H) 7,41 - 7,47 (m, 1H) 3,89 (s, 3H) 3,04 (t, 2H) 2,16 - 2,29 (m, 2H) 1,72 - 1,81 (m, 2H)
A114	0	4,4,4-трифторбут-1-ил	CH ₃	2-CN	8,36 (d, 2H) 7,63 (dd, 1H) 7,48 - 7,54 (m, 1H) 7,42 - 7,48 (m, 1H) 3,03 (t, 2H) 2,29 (s, 3H) 2,15 - 2,27 (m, 2H) 1,70 - 1,81 (m, 2H)
A115	2	4,4,4-трифторбут-1-ил	CH ₃	2-CN	8,37 (d, 2H) 7,80 - 7,86 (m, 2H) 7,59 (dd, 1H) 3,61 (t, 2H) 2,35 (dt, 2H) 2,29 (s, 3H) 2,07 - 2,18 (m, 2H)
A116	0	3-трифторметоксипроп-1-іл	Cl	2-CN	8,45 - 8,52 (m, 2H) 7,66 (dd, 1H) 7,53 (t, 1H) 7,43 - 7,49 (m, 1H) 4,07 (t, 2H) 3,05 (t, 2H) 1,89 (quin, 2H)
A117	2	3-трифторметоксипроп-1-іл	Cl	2-CN	8,47- 8,51 (m, 2H) 7,82 - 7,90 (m, 2H) 7,60 (dd, 1H) 4,09-4,15 (m, 2H) 3,59-3,66 (m, 2H) 2,19 - 2,33 (m, 2H)

Гербіцидні сполуки за даним винаходом



Сполука	n	A	R ²	R ¹	¹ H ЯМР (400 МГц, CDCl ₃ , якщо не вказано інше)
A118	2	4,4,4-трифторбут-1-ил	Br	2-CN	8,56 - 8,59 (m, 2H) 7,82 - 7,90 (m, 2H) 7,60 (dd, 1H) 3,58 (t, 2H) 2,29 - 2,42 (m, 2H) 2,06 - 2,19 (m, 2H)
A119	0	4,4,4-трифторбут-1-ил	Br	2-CN	8,53-8,59 (m, 2H) 7,66 (dd, 1H) 7,53 (t, 1H) 7,44 - 7,49 (m, 1H) 3,03 (t, 2H) 2,17- 2,30 (m, 2H) 1,72-1,81 (m, 2H)
A120	2	5,5,5-трифторпент-1-ил	Br	2-CN	8,57 (s, 2H), 7,88-7,81 (m, 2H), 7,58 (dd, 1H), 3,54-3,50 (m, 2H), 2,17-2,10 (m, 2H), 1,95-1,91 (m, 2H), 1,78-1,70 (m, 2H)
A121	0	5,5,5-трифторпент-1-ил	Br	2-CN	8,56 (s, 2H), 7,65 (dd, 1H), 7,51 (t, 1H), 7,49-7,43 (m, 1H), 2,97 (t, 2H), 2,08-2,03 (m, 2H), 1,65-1,58 (m, 4H)

Біологічні приклади

Тест 1

- Насіння ряду тестових видів висівали у стандартний ґрунт у горщиках (*Lolium perenne* (LOLPE), *Solanum nigrum* (SOLNI), *Amaranthus retroflexus* (AMARE), *Setaria faberi* (SETFA), *Echinochloa crus-galli* (ECHCG) і *Ipomoea hederacea* (IPOHE)). Після культивування протягом одного дня (до появи сходів) або після 8 днів культивування (після появи сходів) у контрольованих умовах у теплиці (за температури 24/16 °С, день/ніч; 14-годинний світловий період; вологість 65 %) рослини обприскували водним розчином для обприскування, одержаним зі складу з технічним активним інгредієнтом у розчині ацетон/вода (50:50), що містить 0,5 % Tween 20 (поліоксиетиленсорбітанмонолаурат, CAS RN 9005-64-5). Сполуки застосовували із розрахунку 250 г/га, якщо не вказане інше. Потім тестовані рослини вирощували в теплиці у контрольованих тепличних умовах (за температури 24/16 °С, день/ніч; 14-годинний світловий період; вологість 65 %) та поливали двічі на добу. Через 13 днів після застосування до і після появи сходів тестовану рослину оцінювали щодо ступеня пошкодження, що було завдане рослині, у відсотках. Значення біологічної активності (% фітотоксичності) показані в таблицях В1 і В2 нижче із використанням п'ятибальної шкали (5 становить 81-100 %; 4 становить 61-80 %; 3 становить 41-60 %; 2 становить 21-40 %; 1 становить 0-20 %).

Таблиця В1

Застосування після появи сходів

Сполука	AMARE	SOLNI	SETFA	LOLPE	ECHCG	IPOHE
A1	5	4	4	4	4	4
A2	5	5	4	4	4	4
A3	5	5	4	4	4	3
A4	5	5	5	4	4	4
A5	5	5	5	5	5	4
A6	5	5	4	2	3	3
A7	5	5	5	2	4	2
A8	5	4	3	1	1	2
A9	5	5	4	3	3	3

Застосування після появи сходів

Сполука	AMARE	SOLNI	SETFA	LOLPE	ECHCG	ІПОНЕ
A10	5	5	5	5	5	4
A11	5	5	5	4	5	5
A12	5	5	5	5	5	4
A13	5	5	5	5	5	4
A14	5	5	5	4	5	5
A15	5	5	5	4	5	5
A16	4	3	2	1	1	1
A20	2	н. т.	3	н. т.	2	1
A21	4	н. т.	4	н. т.	4	3
A22	3	н. т.	4	н. т.	4	2
A24	5	5	5	5	5	5
A25	5	5	5	5	5	3
A26	5	5	5	5	5	5
A27	5	3	2	1	2	2
A28	5	5	5	5	5	5
A29	5	5	5	5	5	5
A30	5	5	5	5	5	4
A33	3	н. т.	2	н. т.	2	1
A36	5	н. т.	4	н. т.	3	3
A37	4	н. т.	2	н. т.	2	2
A38	2	н. т.	1	н. т.	1	3
A39	5	н. т.	5	н. т.	5	3
A40	5	н. т.	4	н. т.	4	3
A41	3	н. т.	2	н. т.	3	3
A42	2	н. т.	1	н. т.	1	1
A43	3	н. т.	2	н. т.	2	1
A44	5	н. т.	2	н. т.	4	1
A45	3	н. т.	2	н. т.	3	1
A46	1	н. т.	1	н. т.	1	1
A48	2	н. т.	1	н. т.	1	1
A49	4	н. т.	4	н. т.	4	4
A50	4	н. т.	1	н. т.	1	2
A51	3	н. т.	1	н. т.	1	1
A52	3	н. т.	3	н. т.	4	1
A53	4	н. т.	1	н. т.	1	1
A55	5	н. т.	4	н. т.	4	4
A56	2	н. т.	1	н. т.	1	1
A57	5	н. т.	4	н. т.	4	2
A59	5	н. т.	2	н. т.	4	2
A60	3	н. т.	1	н. т.	1	2
A61	5	н. т.	2	н. т.	2	2
A62	1	н. т.	3	н. т.	4	1
A64	2	н. т.	2	н. т.	1	2
A65	1	н. т.	3	н. т.	4	3
A66	4	н. т.	3	н. т.	4	2
A68	5	н. т.	4	н. т.	5	5
A69	4	н. т.	2	н. т.	4	1
A70	2	н. т.	4	н. т.	5	4
A71	5	н. т.	3	н. т.	4	4
A72	3	н. т.	2	н. т.	3	2
A73	4	н. т.	3	н. т.	3	1
A74	3	н. т.	1	н. т.	1	1
A75	2	н. т.	2	н. т.	3	2

Таблиця В1

Застосування після появи сходів

Сполука	AMARE	SOLNI	SETFA	LOLPE	ECHCG	ІПОНЕ
A76	1	н. т.	1	н. т.	2	2
A77	2	н. т.	1	н. т.	1	1
A82	3	н. т.	1	н. т.	1	3
A87	1	н. т.	1	н. т.	1	1
A88	2	н. т.	1	н. т.	1	1
A89	3	н. т.	1	н. т.	1	1
A91	5	н. т.	4	н. т.	5	4
A92	5	н. т.	2	н. т.	3	2
A94	5	н. т.	5	н. т.	5	3
A95	4	н. т.	1	н. т.	2	4
A96	5	н. т.	5	н. т.	5	5
A97	5	н. т.	2	н. т.	4	4
A98	5	н. т.	4	н. т.	4	4
A99	5	н. т.	4	н. т.	5	4
A100	5	н. т.	4	н. т.	5	5
A101	5	н. т.	4	н. т.	4	4
A102	5	н. т.	4	н. т.	4	4
A103	4	н. т.	1	н. т.	1	2
A104	5	н. т.	5	н. т.	5	5
A105	5	н. т.	5	н. т.	5	4
A106	5	н. т.	4	н. т.	5	3
A107	5	н. т.	4	н. т.	5	2
A108	4	н. т.	1	н. т.	1	2
A112	2	н. т.	1	н. т.	1	2
A113	5	н. т.	2	н. т.	3	3
A114	3	н. т.	3	н. т.	4	4
A115	4	н. т.	3	н. т.	4	4
A116	5	н. т.	4	н. т.	4	4
A117	5	н. т.	4	н. т.	4	3
A118	5	н. т.	4	н. т.	4	4
A119	5	н. т.	4	н. т.	4	4
A120	4	н. т.	3	н. т.	3	4
A121	5	н. т.	4	н. т.	3	3

Таблиця В2

Застосування до появи сходів

Сполука	AMARE	SOLNI	SETFA	LOLPE	ECHCG	ІПОНЕ
A1	5	4	5	3	4	3
A2	5	5	5	3	5	2
A3	5	4	5	4	5	3
A4	5	4	5	4	5	3
A5	5	5	5	5	5	5
A6	5	3	5	2	4	2
A7	5	4	5	4	5	2
A8	5	4	4	2	2	2
A9	5	5	5	4	4	4
A10	5	4	5	4	5	3
A11	5	5	5	5	5	5
A12	5	5	5	5	5	5
A13	5	5	5	5	5	4
A14	5	5	5	3	5	5

Застосування до появи сходів

Сполука	AMARE	SOLNI	SETFA	LOLPE	ECHCG	ІПОНЕ
A15	5	5	5	5	5	5
A16	4	1	2	1	2	1
A20	3	н. т.	4	н. т.	4	1
A21	4	н. т.	5	н. т.	5	2
A22	4	н. т.	5	н. т.	5	5
A24	5	5	5	4	5	5
A25	5	5	5	5	5	1
A26	5	5	5	5	5	5
A27	5	2	4	1	4	1
A28	5	5	5	5	5	5
A29	5	5	5	5	5	5
A30	5	5	5	5	5	5
A33	1	н. т.	3	н. т.	1	1
A36	5	н. т.	5	н. т.	4	2
A37	4	н. т.	3	н. т.	4	1
A38	2	н. т.	1	н. т.	1	1
A39	5	н. т.	5	н. т.	5	2
A40	5	н. т.	5	н. т.	4	1
A41	1	н. т.	2	н. т.	2	2
A42	1	н. т.	1	н. т.	1	1
A43	5	н. т.	4	н. т.	4	1
A44	5	н. т.	5	н. т.	5	1
A45	3	н. т.	3	н. т.	3	1
A46	1	н. т.	1	н. т.	1	1
A48	1	н. т.	1	н. т.	1	1
A49	5	н. т.	5	н. т.	5	3
A50	5	н. т.	5	н. т.	4	2
A51	4	н. т.	2	н. т.	1	1
A52	1	н. т.	1	н. т.	2	1
A53	3	н. т.	3	н. т.	2	1
A55	5	н. т.	5	н. т.	5	2
A56	2	н. т.	2	н. т.	1	2
A57	4	н. т.	4	н. т.	3	1
A59	5	н. т.	4	н. т.	5	2
A60	4	н. т.	3	н. т.	2	1
A61	5	н. т.	4	н. т.	3	2
A62	1	н. т.	3	н. т.	3	1
A64	1	н. т.	1	н. т.	1	1
A65	3	н. т.	4	н. т.	4	1
A66	1	н. т.	2	н. т.	2	1
A68	5	н. т.	5	н. т.	5	4
A69	1	н. т.	4	н. т.	3	1
A70	2	н. т.	5	н. т.	5	1
A71	5	н. т.	5	н. т.	5	1
A72	4	н. т.	4	н. т.	4	1
A73	5	н. т.	4	н. т.	5	1
A74	1	н. т.	1	н. т.	1	1
A75	5	н. т.	4	н. т.	4	1
A76	5	н. т.	4	н. т.	3	2
A77	4	н. т.	1	н. т.	3	1
A78	3	н. т.	1	н. т.	1	1
A82	5	н. т.	3	н. т.	3	1
A87	1	н. т.	1	н. т.	1	1

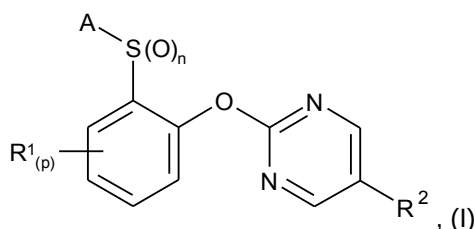
Застосування до появи сходів

Сполука	AMARE	SOLNI	SETFA	LOLPE	ECHCG	IPOHE
A88	5	н. т.	5	н. т.	1	2
A89	1	н. т.	1	н. т.	1	1
A91	5	н. т.	5	н. т.	5	5
A92	5	н. т.	4	н. т.	4	1
A94	5	н. т.	5	н. т.	5	3
A95	5	н. т.	5	н. т.	5	5
A96	5	н. т.	5	н. т.	5	5
A97	5	н. т.	4	н. т.	4	5
A98	5	н. т.	5	н. т.	5	5
A99	5	н. т.	5	н. т.	5	5
A100	5	н. т.	5	н. т.	5	5
A101	5	н. т.	5	н. т.	5	5
A102	5	н. т.	5	н. т.	5	5
A103	4	н. т.	2	н. т.	2	4
A104	5	н. т.	5	н. т.	5	5
A105	5	н. т.	5	н. т.	5	4
A106	5	н. т.	5	н. т.	5	2
A107	5	н. т.	5	н. т.	5	3
A108	5	н. т.	1	н. т.	1	1
A112	3	н. т.	1	н. т.	1	3
A113	5	н. т.	2	н. т.	4	3
A114	5	н. т.	4	н. т.	4	4
A115	5	н. т.	3	н. т.	4	5
A116	5	н. т.	5	н. т.	5	5
A117	5	н. т.	5	н. т.	4	5
A118	5	н. т.	5	н. т.	5	5
A119	5	н. т.	5	н. т.	5	5
A120	4	н. т.	4	н. т.	3	5
A121	5	н. т.	5	н. т.	3	2

ФОРМУЛА ВИНАХОДУ

1. Сполука формули (I):

5



де

A вибраний із групи, яка складається з C₃-C₈алкілу, C₃-C₈алкенілу, C₃-C₈алкінілу, C₃-C₈галогеналкілу, C₃-C₈галогеналкенілу, C₃-C₈галогеналкінілу, C₁-C₄алкокси-C₁-C₃алкіл-, C₁-C₄галогеналкокси-C₁-C₃алкіл-, C₁-C₄алкокси-C₁-C₃галогеналкіл- і -(CH₂)_mR³;

10

R¹ незалежно вибраний із групи, яка складається з галогену, -CN, нітро, C₁-C₄алкіл-, C₂-C₄алкеніл-, C₂-C₄алкініл-, C₁-C₄галогеналкіл-, C₁-C₄алкокси-, C₁-C₄галогеналкокси-, -S(O)_nC₁-C₄алкілу і C₃-C₆циклоалкіл-;

15

R² вибраний із групи, яка складається з галогену, -CN, нітро, C₁-C₄алкілу, C₂-C₄алкеніл-, C₂-C₄алкініл-, C₁-C₄галогеналкіл-, C₁-C₄алкокси-, C₁-C₄галогеналкокси-, -S(O)_nC₁-C₄алкілу і C₃-C₆циклоалкіл-;

m дорівнює 1, 2, 3 або 4;

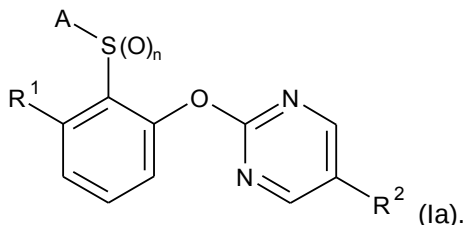
n дорівнює 0, 1 або 2;

p дорівнює 0, 1 або 2;

R^3 вибраний з C_3 - C_6 циклоалкілу, фенілу і 5- або 6-членного гетероарилу, який містить від 1 до 4 гетероатомів, кожний з яких незалежно вибраний із групи, яка складається з кисню, азоту і сірки, і при цьому указана фенільна або гетероарильна група необов'язково заміщена одним, двома або трьома замісниками, незалежно вибраними з групи, яка складається з галогену, ціано, C_1 - C_4 алкілу, C_1 - C_4 галогеналкілу, C_1 - C_4 алкокси і C_1 - C_4 галогеналкокси;

або її прийнята з погляду сільського господарства сіль.

2. Сполука за п. 1, де сполука формули (I) являє собою сполуку формули (Ia):



3. Сполука за будь-яким із попередніх пунктів, де A вибраний із групи, яка складається з C_3 - C_8 алкілу, C_3 - C_8 алкенілу, C_3 - C_8 алкінілу, C_3 - C_8 галогеналкілу, C_3 - C_8 галогеналкенілу, C_3 - C_8 галогеналкінілу, C_1 - C_4 алкокси- C_1 - C_3 алкіл-, C_1 - C_4 галогеналкокси- C_1 - C_3 алкіл- і C_1 - C_4 алкокси- C_1 - C_3 галогеналкіл-.

4. Сполука за будь-яким із попередніх пунктів, де A вибраний із групи, яка складається з C_3 - C_8 алкілу, C_3 - C_8 галогеналкілу, C_3 - C_8 галогеналкенілу, C_3 - C_8 галогеналкінілу і C_1 - C_4 галогеналкокси- C_1 - C_3 алкіл-.

5. Сполука за будь-яким із попередніх пунктів, де R^1 являє собою галоген або $-CN$.

6. Сполука за будь-яким із попередніх пунктів, де R^2 вибраний із групи, яка складається з галогену, C_1 - C_4 алкілу, C_2 - C_4 алкенілу, C_2 - C_4 алкінілу, C_1 - C_4 галогеналкілу, C_1 - C_4 алкокси і C_1 - C_4 галогеналкокси.

7. Сполука за будь-яким із попередніх пунктів, де R^2 вибраний із групи, яка складається з метилу, метокси- і галогену.

8. Сполука за будь-яким із попередніх пунктів, де R^2 являє собою галоген.

9. Сполука за будь-яким із попередніх пунктів, де R^2 являє собою хлор.

10. Гербіцидна композиція, яка містить сполуку за будь-яким із попередніх пунктів і прийнятний з погляду сільського господарства допоміжний засіб для складання.

11. Гербіцидна композиція за п. 10, яка додатково містить щонайменше один додатковий пестицид.

12. Гербіцидна композиція за п. 11, де додатковий пестицид являє собою гербіцид або антидот гербіциду.

13. Спосіб контролю бур'янів у місці зростання, відповідно до якого щодо зазначеного місця зростання застосовують достатню для контролю бур'янів кількість композиції за будь-яким із пп. 10-12.

14. Застосування сполуки формули (I) за п. 1 як гербіциду.