



УКРАЇНА

(19) UA

(11) 123628

(13) C2

(51) МПК

C07D 413/12 (2006.01)

C07D 471/12 (2006.01)

C07D 271/113 (2006.01)

A01N 43/82 (2006.01)

A01N 43/84 (2006.01)

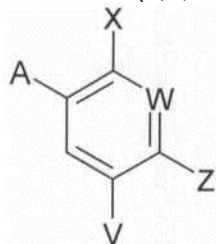
НАЦІОНАЛЬНИЙ ОРГАН
ІНТЕЛЕКТУАЛЬНОЇ
ВЛАСНОСТІ
ДЕРЖАВНЕ ПІДПРИЄМСТВО
"УКРАЇНСЬКИЙ ІНСТИТУТ
ІНТЕЛЕКТУАЛЬНОЇ
ВЛАСНОСТІ"

(12) ОПИС ДО ПАТЕНТУ НА ВІНАХІД

| | | | |
|---|----------------------------------|--|--|
| (21) Номер заявки: | а 2018 00717 | (72) Винахідник(и): | Кон Арнім (DE), Вальдрафф Крістіан (DE), Аренс Хартмут (DE), Хайнеманн Інес (DE), Браун Ральф (DE), Дітріх Хансйорг (DE), Розінгер Крістофер Хью (DE), Гатцвайлер Ельмар (DE) |
| (22) Дата подання заявки: | 29.06.2016 | (73) Володілець (володільці): | БАЄР КРОПСАЄНС АКЦІЕНГЕЗЕЛЬШАФТ, Alfred-Nobel-Str. 50, 40789 Monheim am Rhein, Germany (DE) |
| (24) Дата, з якої є чинними права інтелектуальної власності: | 06.05.2021 | (74) Представник: | Шамріна Олена Олексіївна, реєстр. №141 |
| (31) Номер попередньої заявки відповідно до Паризької конвенції: | 15175277.1 | (56) Перелік документів, взятих до уваги експертизою: | WO 2012/126932 A1, 27.09.2012 WO 2013/087577 A1, 20.06.2013 WO 2014/126070 A1, 21.08.2014 |
| (32) Дата подання попередньої заявки відповідно до Паризької конвенції: | 03.07.2015 | | |
| (33) Код держави-учасниці Паризької конвенції, до якої подано попередню заявку: | EP | | |
| (41) Публікація відомостей про заявку: | 10.04.2018, Бюл.№ 7 | | |
| (46) Публікація відомостей про державну реєстрацію: | 05.05.2021, Бюл.№ 18 | | |
| (86) Номер та дата подання міжнародної заявки, поданої відповідно до Договору РСТ | PCT/EP2016/065091, 29.06.2016 | | |

(54) ГЕРБІЦИДНО АКТИВНІ ПОХІДНІ N-(1,3,4-ОКСАДІАЗОЛ-2-ІЛ)АРИЛКАРБОКСАМІДУ**(57) Реферат:**

Описані N-(1,3,4-оксадіазол-2-іл)арилкарбоксамід-похідні загальної формули (I) як гербіциди



(I).

У цій формулі (I) V, X і Z означають залишки, такі як водень, органічні залишки, такі як алкіл, та інші залишки, такі як галоген. А означає оксадіазольний залишок. W означає СУ або N.

UA 123628 C2

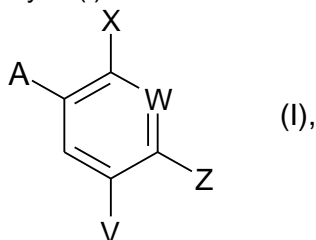
Винахід стосується технічної галузі гербіцидів, зокрема гербіцидів для селективної боротьби з бур'яновими рослинами та травами в культурах корисних рослин.

Із публікації WO2012/126932 A1 відомі N-(1,3,4-оксадіазол-2-іл)арилкарбоксаміди як гербіциди. У публікації WO2013/087577 A1 також як гербіциди описані N-(1,3,4-оксадіазол-2-іл)арил-карбоксаміди, які заміщені на амідному атомі азоту. Із публікації WO 2014/126070 A1 відомі гербіцидно активні триазинон-карбоксаміди, які заміщені на амідному атомі азоту.

Задачею винаходу було одержання гербіцидно активних сполук із поліпшеними властивостями порівняно з властивостями сполук, відомих із рівня техніки.

Було виявлено, що певні похідні N-(1,3,4-оксадіазол-2-іл)арилкарбоксаміду, які заміщені спеціальними залишками на оксадіазолільному залишку або на карбамоїльній групі, є особливо добре придатними до застосування як гербіциди.

Таким чином, предметом винаходу є похідні N-(1,3,4-оксадіазол-2-іл)арил-карбоксаміду формули (I)



в якій символи та індекси мають наведені далі значення:

W означає N або CY,

X і Z означають незалежно один від одного в кожному випадку водень, нітро, галоген, ціано, форміл, родано, (C₁-C₆)-алкіл, (C₁-C₆)-галогеналкіл, (C₂-C₆)-алкеніл, (C₂-C₆)-галогеналкеніл, (C₂-C₆)-алкініл, (C₃-C₆)-галогеналкініл, (C₃-C₆)-циклоалкіл, (C₃-C₆)-галогенциклоалкіл, (C₃-C₆)-циклоалкіл-(C₁-C₆)-алкіл, (C₃-C₆)-галогенциклоалкіл-(C₁-C₆)-алкіл, COR¹, OR¹, OCOR¹, OSO₂R², S(O)_nR², SO₂OR¹, SO₂N(R¹)₂, NR¹SO₂R², NR¹COR¹, (C₁-C₆)-алкіл-S(O)_nR², (C₁-C₆)-алкіл-OR¹, (C₁-C₆)-алкіл-OCOR¹, (C₁-C₆)-алкіл-OSO₂R², (C₁-C₆)-алкіл-CO₂R¹, (C₁-C₆)-алкіл-SO₂OR¹, (C₁-C₆)-алкіл-CON(R¹)₂, (C₁-C₆)-алкіл-SO₂N(R¹)₂, (C₁-C₆)-алкіл-NR¹COR¹, (C₁-C₆)-алкіл-NR¹SO₂R², NR¹R², P(O)(OR⁵)₂, або

гетероарил, гетероцикліл або феніл, в кожному випадку заміщений s залишками, вибраними із групи, яка включає метил, етил, метокси, нітро, трифторметил і галоген,

Y означає водень, нітро, галоген, ціано, родано, (C₁-C₆)-алкіл, галоген-(C₁-C₆)-алкіл, (C₂-C₆)-алкеніл, галоген-(C₂-C₆)-алкеніл, (C₂-C₆)-алкініл, галоген-(C₂-C₆)-алкініл, (C₃-C₆)-циклоалкіл, (C₃-C₆)-циклоалкеніл, галоген-(C₃-C₆)-циклоалкіл, (C₃-C₆)-циклоалкіл-(C₁-C₆)-алкіл, галоген-(C₃-C₆)-циклоалкіл-(C₁-C₆)-алкіл, COR¹, CO₂R¹, OCO₂R¹, NR¹CO₂R¹, C(O)N(R¹)₂, NR¹C(O)N(R¹)₂, °C(O)N(R¹)₂, C(O)N(R¹)OR¹, NR¹SO₂R², NR¹COR¹, OR¹, OSO₂R², S(O)_nR², SO₂OR¹, SO₂N(R¹)₂, (C₁-C₆)-алкіл-S(O)_nR², (C₁-C₆)-алкіл-OR¹, (C₁-C₆)-алкіл-OCOR¹, (C₁-C₆)-алкіл-OSO₂R², (C₁-C₆)-алкіл-CO₂R¹, (C₁-C₆)-алкіл-CN, (C₁-C₆)-алкіл-SO₂OR¹, (C₁-C₆)-алкіл-CON(R¹)₂, (C₁-C₆)-алкіл-SO₂N(R¹)₂, (C₁-C₆)-алкіл-NR¹COR¹, (C₁-C₆)-алкіл-NR¹SO₂R², N(R¹)₂, P(O)(OR⁵)₂, CH₂P(O)(OR⁵)₂, CH=NOR¹, (C₁-C₆)-алкіл-CH=NOR¹, (C₁-C₆)-алкіл-O-N=C(R¹)₂, (C₁-C₆)-алкіл-феніл, (C₁-C₆)-алкіл-гетероарил, (C₁-C₆)-алкіл-гетероцикліл, феніл, гетероарил або гетеро-цикліл,

причому b вказаних останніми залишків в кожному випадку заміщені s залишками, вибраними з групи, що включає галоген, нітро, ціано, (C₁-C₆)-алкіл, галоген-(C₁-C₆)-алкіл, (C₃-C₆)-циклоалкіл, S(O)_n-(C₁-C₆)-алкіл, (C₁-C₆)-алкокси, галоген-(C₁-C₆)-алкокси, (C₁-C₆)-алкокси-(C₁-C₄)-алкіл і ціанометил, і

причому гетероцикліл містить n оксогруп, або

Y і Z разом із обома атомами, до яких вони приєднані, утворюють 5-, 6- або 7-членне, ненасичене, частково насичене або насичене кільце, яке поряд із атомами вуглецю в кожному випадку містить s атомів азоту, n атомів кисню, n атомів сірки і n елементів S(O), S(O)₂, C=N-R⁸, C(OR⁹)₂, C[-O-(CH₂)₂-O-] або C(O) як члени кільця,

атоми вуглецю якого в кожному випадку заміщені s залишками, вибраними з групи, що включає галоген, ціано, (C₁-C₆)-алкіл, (C₂-C₁₀)-алкеніл, (C₂-C₁₀)-алкініл, (C₁-C₆)-галоалкіл, (C₁-C₆)-алкокси, фенокси, галоген-(C₁-C₆)-алкокси, (C₃-C₈)-циклоалкіл, (C₂-C₈)-алкоксіалкіл і феніл,

атоми азоту якого в кожному випадку заміщені n залишками, вибраними з групи, що включає (C₁-C₆)-алкіл і феніл,

і в якій вищевказані фенільні залишки в кожному випадку заміщені s залишками, вибраними з групи, що включає ціано, нітро, галоген, (C₁-C₆)-алкіл, (C₁-C₆)-галоалкіл і (C₁-C₆)-алкокси,

V означає водень, нітро, галоген, ціано, (C₁-C₄)-алкіл, (C₁-C₄)-галогеналкіл або OR¹, S(O)_nR²,
 R¹ означає водень, (C₁-C₆)-алкіл, (C₁-C₆)-галогеналкіл, (C₂-C₆)-алкеніл, (C₂-C₆)-
 галогеналкеніл, (C₂-C₆)-алкініл, (C₂-C₆)-галогеналкініл, (C₃-C₆)-циклоалкіл, (C₃-C₆)-циклоалкеніл,
 (C₃-C₆)-галогенциклоалкіл, (C₁-C₆)-алкіл-O-(C₁-C₆)-алкіл, (C₃-C₆)-циклоалкіл-(C₁-C₆)-алкіл, феніл,
 5 феніл-(C₁-C₆)-алкіл, гетероарил, (C₁-C₆)-алкіл-гетероарил, гетероцикліл, (C₁-C₆)-алкіл-
 гетероцикліл, (C₁-C₆)-алкіл-O-гетероарил, (C₁-C₆)-алкіл-O-гетероцикліл, (C₁-C₆)-алкіл-NR³-
 гетероарил, (C₁-C₆)-алкіл-NR³-гетероцикліл, причому 21 вказані останніми залишки заміщені s
 залишками, вибраними з групи, що включає ціано, галоген, нітро, родано, OR³, S(O)_nR⁴, N(R³)₂,
 NR³OR³, COR³, OCOR³, SCOR⁴, NR³COR³, NR³SO₂R⁴, CO₂R³, COSR⁴, CON(R³)₂ і (C₁-C₄)-алкокси-
 10 (C₂-C₆)-алкоксикарбоніл, і

причому гетероцикліл містить n оксогруп,

R² означає (C₁-C₆)-алкіл, (C₁-C₆)-галогеналкіл, (C₂-C₆)-алкеніл, (C₂-C₆)-галогеналкеніл, (C₂-
 C₆)-алкініл, (C₂-C₆)-галогеналкініл, (C₃-C₆)-циклоалкіл, (C₃-C₆)-циклоалкеніл, (C₃-C₆)-
 галогенциклоалкіл, (C₁-C₆)-алкіл-O-(C₁-C₆)-алкіл, (C₃-C₆)-циклоалкіл-(C₁-C₆)-алкіл, феніл, феніл-
 15 (C₁-C₆)-алкіл, гетероарил, (C₁-C₆)-алкіл-гетероарил, гетероцикліл, (C₁-C₆)-алкіл-гетероцикліл,
 (C₁-C₆)-алкіл-O-гетероарил, (C₁-C₆)-алкіл-O-гетероцикліл, (C₁-C₆)-алкіл-NR³-гетероарил, (C₁-C₆)-
 алкіл-NR³-гетероцикліл, причому 21 вказаних останніми залишків заміщені s залишками,
 вибраними з групи, що включає ціано, галоген, нітро, родано, OR³, S(O)_nR⁴, N(R³)₂, NR³OR³,
 COR³, OCOR³, SCOR⁴, NR³COR³, NR³SO₂R⁴, CO₂R³, COSR⁴, CON(R³)₂ та (C₁-C₄)-алкокси-(C₂-
 20 C₆)-алкоксикарбоніл, і

причому гетероцикліл містить n оксогруп,

R³ означає водень, (C₁-C₆)-алкіл, (C₂-C₆)-алкеніл, (C₂-C₆)-алкініл, (C₃-C₆)-циклоалкіл або (C₃-
 C₆)-циклоалкіл-(C₁-C₆)-алкіл,

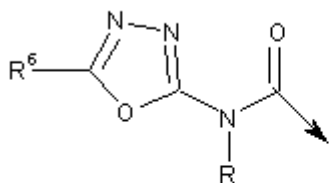
R⁴ означає (C₁-C₆)-алкіл, (C₂-C₆)-алкеніл або (C₂-C₆)-алкініл, (C₃-C₆)-циклоалкіл або (C₃-C₆)-
 25 циклоалкіл-(C₁-C₆)-алкіл,

R⁵ означає (C₁-C₄)-алкіл,

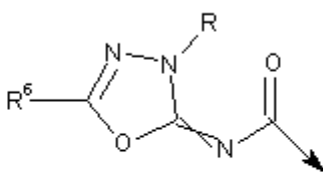
n означає 0, 1 або 2,

s означає 0, 1, 2 або 3,

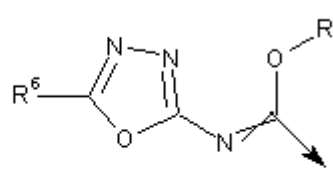
A означає залишок A1, A2, або A3



A1



A2



A3

R означає (C₁-C₆)-алкіл-OC(O)N(R³)₂ або (C₁-C₆)-алкіл-OC(O)OR¹⁰,

R⁶ означає водень, (C₁-C₆)-алкіл, R¹O-(C₁-C₆)-алкіл, CH₂R⁷, (C₃-C₇)-циклоалкіл, галоген-(C₁-
 C₆)-алкіл, (C₂-C₆)-алкеніл, галоген-(C₂-C₆)-алкеніл, (C₂-C₆)-алкініл, галоген-(C₂-C₆)-алкініл, OR¹,
 NHR¹, метоксикарбоніл, етоксикарбоніл, метоксикарбонілметил, етоксикарбонілметил,
 35 метилкарбоніл, трифторметилкарбоніл, диметиламіно, ацетиламіно, метилсульфеніл,
 метилсульфініл, метилсульфоніл або означає гетероарил, гетероцикліл, бензил або феніл, в
 кожному випадку заміщений s залишками, вибраними з групи, що включає галоген, нітро, ціано,
 (C₁-C₆)-алкіл, галоген-(C₁-C₆)-алкіл, (C₃-C₆)-циклоалкіл, S(O)_n-(C₁-C₆)-алкіл, (C₁-C₆)-алкокси,
 галоген-(C₁-C₆)-алкокси, (C₁-C₆)-алкокси-(C₁-C₄)-алкіл,

R⁷ означає ацетокси, ацетамідо, N-метилацетамідо, бензоїлокси, бензамідо, N-метил-
 бензамідо, метоксикарбоніл, етоксикарбоніл, бензоїл, метилкарбоніл, піперидинілкарбоніл,
 морфолінілкарбоніл, трифторметилкарбоніл, амінокарбоніл, метиламінокарбоніл,
 диметиламінокарбоніл, (C₁-C₆)-алкокси, (C₃-C₆)-циклоалкіл або означає гетероарил,
 гетероцикліл або феніл, в кожному випадку заміщений s залишками, вибраними з групи, що
 45 включає метил, етил, метокси, трифторметил і галоген,

R⁸ означає (C₁-C₆)-алкіл, галоген-(C₁-C₆)-алкіл, (C₁-C₆)-алкокси або галоген-(C₁-C₆)-алкокси,

R⁹ означає (C₁-C₆)-алкіл або галоген-(C₁-C₆)-алкіл,

R¹⁰ означає (C₁-C₆)-алкіл, галоген-(C₁-C₆)-алкіл або (C₁-C₆)-циклоалкіл.

Переважними є сполуки загальної формули (I), в якій

R^6 означає водень, (C_1-C_6) -алкіл, $R^1O-(C_1-C_6)$ -алкіл, галоген- (C_1-C_6) -алкіл або (C_2-C_6) -алкеніл,

а інші замісники та індекси мають наведені вище значення.

Особливо переважними є сполуки загальної формули (I), в якій

5 W означає CY ,

X і Z означають незалежно один від одного в кожному випадку водень, галоген, (C_1-C_6) -алкіл, (C_1-C_6) -галогеналкіл, (C_2-C_6) -алкеніл, (C_3-C_6) -циклоалкіл, (C_3-C_6) -галогенциклоалкіл, OR^1 , $S(O)_nR^2$, $SO_2N(R^1)_2$, $NR^1SO_2R^2$, NR^1COR^1 , (C_1-C_6) -алкіл- $S(O)_nR^2$, (C_1-C_6) -алкіл- OR^1 , або

гетероарил, гетероцикліл або феніл, в кожному випадку заміщений s залишками, вибраними з групи, що включає метил, етил, метокси, нітро, трифторметил і галоген,

10 Y означає водень, (C_2-C_6) -алкеніл, COR^1 , CO_2R^1 , OCO_2R^1 , $NR^1CO_2R^1$, $C(O)N(R^1)_2$, $NR^1C(O)N(R^1)_2$, $^{\circ}C(O)N(R^1)_2$, $C(O)N(R^1)OR^1$, $NR^1SO_2R^2$, NR^1COR^1 , OR^1 , $S(O)_nR^2$, $SO_2N(R^1)_2$, (C_1-C_6) -алкіл- $S(O)_nR^2$, (C_1-C_6) -алкіл- OR^1 , (C_1-C_6) -алкіл- $OCOR^1$, (C_1-C_6) -алкіл- CO_2R^1 , (C_1-C_6) -алкіл- $CON(R^1)_2$, (C_1-C_6) -алкіл- $SO_2N(R^1)_2$, (C_1-C_6) -алкіл- NR^1COR^1 , (C_1-C_6) -алкіл- $NR^1SO_2R^2$, $N(R^1)_2$, $CH=NOR^1$, (C_1-C_6) -алкіл- $CH=NOR^1$, (C_1-C_6) -алкіл-гетероарил, (C_1-C_6) -алкіл-гетероцикліл,

15 гетероарил або гетероцикліл, причому

4 вказаних останніми залишки в кожному випадку заміщені s залишками, вибраними з групи, що включає галоген, нітро, ціано, (C_1-C_6) -алкіл, галоген- (C_1-C_6) -алкіл, (C_3-C_6) -циклоалкіл, $S(O)_n$ - (C_1-C_6) -алкіл, (C_1-C_6) -алкокси, галоген- (C_1-C_6) -алкокси, (C_1-C_6) -алкокси- (C_1-C_4) -алкіл і

20 ціанометил, і

причому гетероцикліл містить n оксогруп,

V означає водень, Cl, OMe, метил або етил,

R^6 означає метил, етил, метоксиметил або метоксіетил,

а інші замісники та індекси мають наведені вище значення.

25 Цілком переважними є сполуки загальної формули (I), в якій

X означає F, Cl, Br, метил, етил, циклопропіл, трифторметил, метокси, метоксиметил, метоксіетоксиметил, SMe або SO_2Me ,

Z означає водень, F, Cl, Br, I, метил, етил, трифторметил, дифторметил, пентафтор-етил, метилсульфоніл або етилсульфоніл,

30 Y означає водень, SMe, $S(O)Me$, SO_2Me , SEt, $S(O)Et$, SO_2Et , CH_2OMe , CH_2OEt , $CH_2OCH_2CF_3$, CH_2SMe , $CH_2S(O)Me$, CH_2SO_2Me , вініл, $C(O)Me$, $C(O)Et$, $C(O)cPr$, CO_2Me , $CHN=OMe$, 4,5-дигідро-1,2-оксазол-3-іл, 5-метил-4,5-дигідро-1,2-оксазол-3-іл, 5-метил-4,5-дигідро-1,2-оксазол-3-іл, 5-ціанометил-4,5-дигідро-1,2-оксазол-3-іл, 4,5-дигідро-1,2-оксазол-5-іл, 3-метил-4,5-дигідро-1,2-оксазол-5-іл, 1H-піразол-1-іл, 1H-1,2,3-тріазол-1-іл, 2H-1,2,3-тріазол-2-іл, 1H-1,2,4-тріазол-1-іл, піролідін-2-он-1-іл, морфолін-3-он-4-іл, OMe, OEt, OnPr, OCH_2cPr , OCH_2CH_2F , OCH_2CH_2OMe або $OCH_2CH_2CH_2OMe$,

V означає водень,

R означає CH_2OCO_2Et , $CH(CH_3)OCO_2Me$, $CH(CH_3)OCO_2Et$, $CH(CH_3)OCO_2$ -ц-гексил, $CH(CH_3)OCO_2$ -i-Pr або $CH(CH_3)OCO_2$ -t-Bu,

40 R^6 означає метил,

а інші замісники та індекси мають наведені вище значення.

У формулі (I) та всіх наступних формулах алкільні залишки, що містять понад два атоми вуглецю, можуть бути нерозгалуженими або розгалуженими. Алкільні залишки означають, наприклад, метил, етил, n- або i-пропіл, n-, i-, t- або 2-бутил, пентили, гексили, такі як n-гексил, i-гексил і 1,3-диметилбутил. Аналогічно алкеніл означає, наприклад, аліл, 1-метилпроп-2-ен-1-іл, 2-метилпроп-2-ен-1-іл, бут-2-ен-1-іл, бут-3-ен-1-іл, 1-метилбут-3-ен-1-іл і 1-метилбут-2-ен-1-іл. Алкініл означає, наприклад, пропаргіл, бут-2-ін-1-іл, бут-3-ін-1-іл, 1-метилбут-3-ін-1-іл. Кратний зв'язок у кожному випадку може перебувати в будь-якому положенні ненасиченого залишку. Циклоалкіл означає карбоциклічну, насичену кільцеву систему, що містить від трьох до шести атомів вуглецю, наприклад циклопропіл, циклобутил, циклопентил або циклогексил. Аналогічно циклоалкеніл означає моноциклічну алкенільну групу, що містить від трьох до шести членів вуглецевого кільця, наприклад, циклопропеніл, циклобутеніл, циклопентеніл і циклогексеніл, причому подвійний зв'язок може перебувати в будь-якому положенні.

Галоген означає фтор, хлор, бром або йод.

55 Гетероцикліл означає насичений, частково насичений або ненасичений циклічний залишок, який містить від 3 до 6 кільцевих атомів, із яких від 1 до 4 походять із групи, що включає кисень, азот і сірку, та який додатково може бути анельований бензотріциклом. Наприклад, гетероцикліл означає піперидиніл, піролідиніл, тетрагідрофураніл, дигідрофураніл і оксетаніл,

60 Гетероарил означає ароматичний циклічний залишок, що містить від 3 до 6 кільцевих атомів, із яких від 1 до 4 походять із групи, що включає кисень, азот і сірку, і який додатково

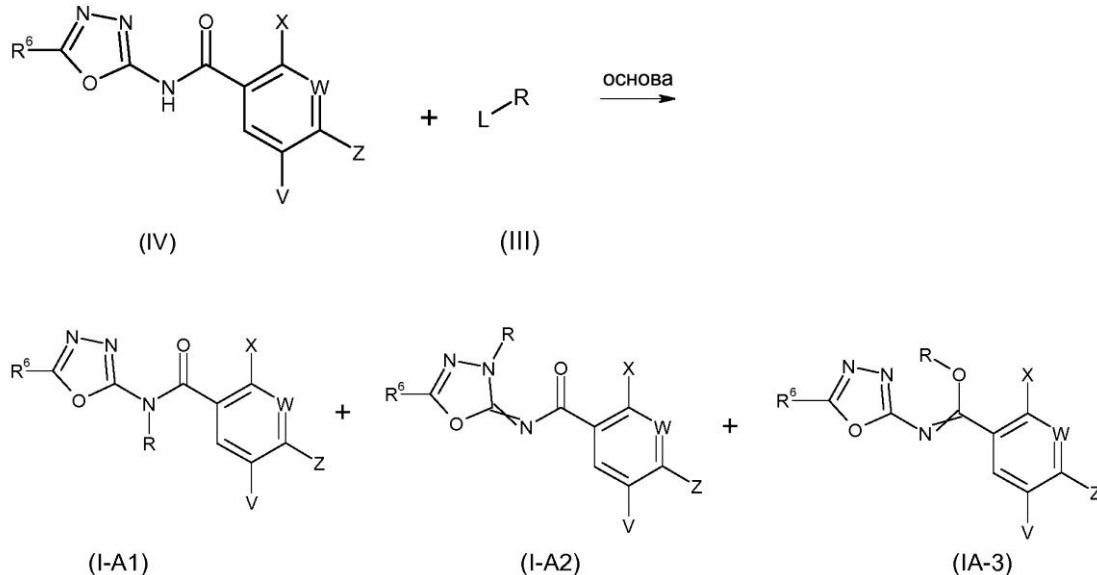
може бути анельований бензокільцем. Наприклад, гетероарил означає бензімідазол-2-іл, фураніл, імідазоліл, ізоксазоліл, ізотіазоліл, оксазоліл, піразиніл, піримідиніл, піридазиніл, піридиніл, бензізоксазоліл, тіазоліл, піроліл, піразоліл, тіофеніл, 1,2,3-оксадіазоліл, 1,2,4-оксадіазоліл, 1,2,5-оксадіазоліл, 1,3,4-оксадіазоліл, 1,2,4-триазоліл, 1,2,3-триазоліл, 1,2,5-триазоліл, 1,3,4-триазоліл, 1,2,4-триазоліл, 1,2,4-тіадіазоліл, 1,3,4-тіадіазоліл, 1,2,3-тіадіазоліл, 1,2,5-тіадіазоліл, 2Н-1,2,3,4-тетразоліл, 1Н-1,2,3,4-тетразоліл, 1,2,3,4-окса-триазоліл, 1,2,3,5-оксатриазоліл, 1,2,3,4-тіатриазоліл і 1,2,3,5-тіатриазоліл.

Якщо група багаторазово заміщена залишками, це слід розуміти таким чином, що ця група заміщена одним або декількома однаковими або різними вказаними залишками. Аналогічне є чинним стосовно побудови структури кільцевих систем різними атомами та елементами.

Сполуки загальної формули (I) залежно від виду та місця приєднання замісників можуть перебувати в формі стереоізомерів. За наявності, наприклад, одного або декількох асиметричних атомів вуглецю вони можуть перебувати в формі енантіомерів і діастереомерів. Вони перебувають у формі стереоізомерів також у тому випадку, якщо $n=1$ (сульфоксиди). Стереоізомери можуть бути одержані з утворюваних в процесі виготовлення сумішей традиційними способами розділення, наприклад, шляхом хроматографування. Так само стереоізомери можуть бути одержані шляхом здійснення стереоселективних реакцій із застосуванням оптично активних вихідних і/або допоміжних речовин. Винахід стосується також усіх стереоізомерів та їх сумішей, які охоплені загальною формулою (I), проте, не мають специфічного визначення. Відповідні винаходіві сполуки внаслідок оксиметричної структури можуть перебувати також у формі геометричних ізомерів (E-/Z-ізомерів). Винахід стосується також усіх E-/Z-ізомерів та їх сумішей, які охоплені загальною формулою (I), проте, не мають специфічного визначення.

Відповідні винаходіві сполуки можуть бути одержані, наприклад, згідно зі схемою 1 шляхом перетворення амідів N-(1,3,4-оксадіазол-2-іл)-арилкарбонової кислоти (IV) із застосуванням сполуки загальної формули (III), причому L означає вихідну групу, таку як, наприклад, хлор, бром, йод, мезилокси, тозилокси, трифторсульфонілокси тощо:

Схема 1



Відповідні винаходіві сполуки формули (I) в принципі перебувають у формі суміші сполук формул (I-A1), (I-A2) і (I-A3) і можуть бути виділені простими, відомими фахівцям способами, такими як розділення способом хроматографії, перекристалізації.

Аміди N-(1,3,4-оксадіазол-3-іл)-арилкарбонової кислоти формули (IV) в принципі відомі та можуть бути одержані, наприклад, описаними в публікації WO 2012/ 126932 A1 способами. Сполуки формули (III), в яких L означає вихідну групу, таку як хлор, бром, йод, метилсульфонілокси, тозилокси або трифторсульфонілокси, є або комерційно доступними, або можуть бути одержані відомими, описаними в літературі способами.

Колекції сполук формули (I), які можуть бути синтезовані шляхом здійснення вищевказаних реакцій, можна одержувати також паралельно, причому це може відбуватися в ручному, частково автоматизованому або повністю автоматизованому режимі. При цьому можна, наприклад, автоматизувати процес здійснення реакції, обробки або очищення продуктів чи проміжних ступенів. У цілому під цим розуміють такий порядок дій, який описаний, наприклад, у

публікації D. Tiebes, *Combinatorial Chemistry – Synthesis, Analysis, Screening* (відповідальний редактор видання Günther Jung), видавництво Wiley, 1999, на сторінках 1-34.

Для паралельного здійснення реакції і обробки можна застосовувати різні комерційно доступні пристрої, наприклад, реакційні блоки Calypso (Calypso reaction blocks) компанії Barnstead International, Дуб'юк, штат Айова 52004-0797, США, або реакційні станції (reaction stations) компанії Radleys, Шайр Хілл, Сафрон-Уолден, Есекс, CB11 3AZ, Англія, або автоматизовані робочі станції MultiPROBE Automated Workstations компанії Perkin Elmer, Уолтем, штат Массачусетс 02451, США. Для паралельного очищення сполук загальної формули (I) чи при одержанні утворюваних проміжних продуктів можна застосовувати, зокрема, апаратуру для хроматографії, наприклад, компанії ISCO, Inc., 4700 Superior Street, Лінкольн, NE 68504, США.

Вищевказана апаратура працює за модульним принципом, при якому окремі робочі операції автоматизовані, проте, між ними деякі операції необхідно здійснювати вручну. Цього можна уникнути шляхом застосування частково або повністю інтегрованих автоматизованих систем, у яких для керування відповідними автоматизованими модулями передбачені роботи. Подібні автоматизовані системи є комерційно доступними, наприклад, компанії Caliper, Хопкінтон, штат Массачусетс MA 01748, США.

Для підтримки здійснення окремих або кількох стадій синтезу можна застосовувати реагенти на полімерній основі/акцепторні смоли. У спеціальній літературі описані різні протоколи досліджень, наприклад, у виданні ChemFiles, том 4, № 1, Polymer-Supported Scavengers and Reagents for Solution-фаза Synthesis (компанія Sigma-Aldrich Chemie GmbH).

Поряд із описаними вище способами для одержання сполук загальної формули (I) можна застосовувати повністю або частково твердофазні методи. Для цього окремі або всі проміжні стадії синтезу або узгодженого з відповідним порядком дій синтезу здійснюють із застосуванням синтез-смоли як твердої фази. Твердофазні методи синтезу достатньо описані в літературі, наприклад, у публікаціях Barry A. Bunin, "The Combinatorial Index", видавництво Academic Press, 1998, та *Combinatorial Chemistry – Synthesis, Analysis, Screening* (відповідальний редактор видання Günther Jung), видавництво Wiley, 1999. Застосування твердофазних методів синтезу дозволяє реалізувати ряд відомих із літератури протоколів, які також можна здійснювати у ручному або автоматичному режимі. Реакції можна здійснювати, наприклад, із застосуванням технології IRORl в мікрореакторах (англ. microreactors) компанії Nexus Biosystems, 12140 Community Road, Повей, CA92064, США.

Здійснення окремих або кількох стадій синтезу як у твердій, так і в рідкій фазі можна підтримувати шляхом застосування мікрохвильової технології. В спеціальній літературі описаний ряд протоколів досліджень, наприклад, у виданні *Microwaves in Organic i Medicinal Chemistry* (відповідальні редактори С. О. Kappe і а. Stadler), видавництво Wiley, 2005.

Описаними вище способами одержують сполуки формули (I) в формі колекцій речовин, які називають бібліотеками. Предметом винаходу є також бібліотеки, що містять принаймні дві сполуки формули (I).

Відповідні винаходіві сполуки формули (I), далі називані "відповідними винаходіві сполуками", проявляють надзвичайно високу гербіцидну ефективність проти широкого спектра економічно важливих однорічних одно- та дводольних бур'янових рослин. Високою є також ефективність активних речовин проти багатолітніх бур'янів, які важко піддаються знищенню, що виростають з ризом, кореневищ або інших зимуючих органів.

Тому предметом винаходу є також спосіб боротьби з небажаними рослинами або регулювання росту рослин, переважно в таких культурах рослин, в якому одну або кілька відповідних винаходіві сполук наносять на рослини (наприклад бур'янові рослини, такі як одно- чи дводольні бур'яни, або небажані культурні рослини), посівний матеріал (наприклад зерна, насіння або органи вегетативного розмноження, такі як бульби або ділянки пагонів із бруньками), або на ділянку, засаджену рослинами (наприклад посівну ділянку). При цьому відповідні винаходіві сполуки можуть бути нанесені, наприклад, у процесі передпосівної (при необхідності також шляхом внесення в ґрунт), перед- або післясходової обробки. Зокрема, можна назвати деякі приклади представників одно- та дводольних бур'янових рослин, які можна контролювати за допомогою відповідних винаходіві сполук, причому наведений перелік не є підставою для обмеження їх застосування певними видами рослин:

Однорічні бур'янові рослини, які належать до родів: Aegilops, Agropyron, Agrostis, Alopecurus, Apera, Avena, Brachiaria, Bromus, Cenchrus, Commelina, Cynodon, Cyperus, Dactyloctenium, Digitaria, Echinochloa, Eleocharis, Eleusine, Eragrostis, Eriochloa, Festuca, Fimbristylis, Heteranthera, Imperata, Ischaemum, Leptochloa, Lolium, Monochoria, Panicum, Paspalum, Phalaris, Phleum, Poa, Rottboellia, Sagittaria, Scirpus, Setaria, Sorghum.

Дводольні бур'янові рослини, які належать до родів: *Abutilon*, *Amaranthus*, *Ambrosia*, *Anoda*, *Anthemis*, *Aphanes*, *Artemisia*, *Atriplex*, *Bellis*, *Bidens*, *Capsella*, *Carduus*, *Cassia*, *Centaurea*, *Chenopodium*, *Cirsium*, *Convolvulus*, *Datura*, *Desmodium*, *Emex*, *Erysimum*, *Euphorbia*, *Galeopsis*, *Galinsoga*, *Galium*, *Hibiscus*, *Ipomoea*, *Kochia*, *Lamium*, *Lepidium*, *Lindernia*, *Matricaria*, *Mentha*, *Mercurialis*, *Mullugo*, *Myosotis*, *Papaver*, *Pharbitis*, *Plantago*, *Polygonum*, *Portulaca*, *Ranunculus*, *Raphanus*, *Rorippa*, *Rotala*, *Rumex*, *Salsola*, *Senecio*, *Sesbania*, *Sida*, *Sinapis*, *Solanum*, *Sonchus*, *Sphenoclea*, *Stellaria*, *Taraxacum*, *Thlaspi*, *Trifolium*, *Urtica*, *Veronica*, *Viola*, *Xanthium*.

У разі нанесення відповідних винаходів сполук на поверхню ґрунту перед проростанням зерен повністю унеможливується проростання зародків бур'янових рослин або бур'янові рослини виростають до стадії утворення зародкових листків, але потім їх ріст припиняється, і врешті-решт вони зовсім гинуть через три-чотири тижні.

Після нанесення активних речовин на зелені частини рослин у процесі післясходової обробки ріст бур'янових рослин припиняється і вони застигають у стадії, в якій перебували на момент нанесення активних речовин, або повністю гинуть через певний період часу, отже, в такий спосіб завчасно і на тривалий період усувається шкідлива для культурних рослин конкуренція бур'янів.

Хоча відповідні винаходів сполуки відрізняються надзвичайною гербіцидною активністю проти одно- та дводольних бур'янів, вони ушкоджують лише незначно або взагалі не ушкоджують культурні рослини, що належать до економічно важливих культур, наприклад дводольних культур із таких родів, як *Arachis*, *Beta*, *Brassica*, *Cucumis*, *Cucurbita*, *Helianthus*, *Daucus*, *Glycine*, *Gossypium*, *Ipomoea*, *Lactuca*, *Linum*, *Lycopersicon*, *Nicotiana*, *Phaseolus*, *Pisum*, *Solanum*, *Vicia*, або однодольних культур із родів *Allium*, *Ananas*, *Asparagus*, *Avena*, *Hordeum*, *Oryza*, *Panicum*, *Saccharum*, *Secale*, *Sorghum*, *Triticale*, *Triticum*, *Zea*, зокрема *Zea* і *Triticum*, залежно від структури конкретних відповідних винаходів сполук та норми їх витрати. З цих причин описані гербіцидні засоби дуже добре придатні для селективної боротьби проти небажаного росту рослин у рослинних культурах на ділянках, засаджених сільськогосподарськими корисними рослинами або декоративними рослинами.

Окрім цього, відповідні винаходів сполуки (залежно від структури конкретних відповідних винаходів сполук та норми їх витрати) мають надзвичайно ефективну здатність до регулювання росту культурних рослин. Вони втручаються в обмін речовин рослин, регулюючи його, і тому можуть бути застосовані для цілеспрямованого впливу на речовини, що входять до складу рослин, і полегшення процесу збирання врожаю, наприклад за рахунок десикації та скорочення міжвузль. Вони можуть бути також застосовані для загального регулювання і гальмування небажаної вегетації без девіталізації рослин. Гальмування вегетації має велике значення для багатьох одно- та дводольних культур, оскільки дозволяє зменшити або взагалі уникнути полягання рослин.

Завдяки гербіцидним властивостям і здатності до регулювання росту рослин активні речовини можуть бути застосовані також для боротьби з бур'яновими рослинами в культурах рослин, створених способами генної інженерії або традиційного мутагенезу. Трансгенні рослини зазвичай відрізняються особливо переважними властивостями, наприклад стійкістю до певних пестицидів, насамперед певних гербіцидів, стійкістю до хвороб рослин або таких збудників хвороб рослин, як певні комахи чи мікроорганізми, наприклад гриби, бактерії або віруси. Іншими особливими властивостями є, наприклад, кількість, якість та придатність зібраного врожаю до тривалого зберігання, його склад і особливі компоненти. Наприклад, відомі трансгенні рослини з підвищеним вмістом або зміненою якістю крохмалю, або з іншим складом жирних кислот у зібраному врожаї.

Переважним стосовно трансгенних культур є застосування відповідних винаходів сполук в економічно важливих трансгенних культурах корисних і декоративних рослин, наприклад у злакових культурах, таких як пшениця, ячмінь, жито, овес, просо, рис і кукурудза, або в культурах цукрового буряка, бавовника, сої, рапсу, картоплі, томатів, гороху та інших видів овочів. Переважно відповідні винаходів сполуки можуть бути застосовані як гербіциди в культурах корисних рослин, які є або за допомогою технологій генної інженерії були зроблені резистентними до фітотоксичної дії гербіцидів.

Переважним є застосування відповідних винаходів сполук в економічно важливих трансгенних культурах корисних і декоративних рослин, наприклад злаків, таких як пшениця, ячмінь, жито, овес, просо, рис, маніока і кукурудза, а також у культурах цукрового буряка, бавовника, сої, рапсу, картоплі, томатів, гороху та інших видів овочів. Переважно відповідні винаходів сполуки можуть бути застосовані як гербіциди в культурах корисних рослин, які є або за допомогою технологій генної інженерії були зроблені резистентними до фітотоксичної дії гербіцидів.

Класичними способами створення нових рослин із модифікованими порівняно з існуючими рослинами властивостями є, наприклад, класичні способи розведення, а також створення мутантів. Альтернативно нові рослини зі зміненими властивостями можуть бути створені за допомогою технологій генної інженерії (див. наприклад, публікації EP-A-0221044, EP-A-0131624). Наприклад, у багатьох випадках описані

- генноінженерні зміни культурних рослин з метою модифікації синтезованих у рослинах крохмалів (наприклад публікації WO 92/11376, WO 92/14827, WO 91/19806),

- трансгенні культурні рослини, які є стійкими до дії певних гербіцидів типу гліфосинатів (див. наприклад, публікації EP-A-0242236, EP-A-242246) або гліфосатів (WO 92/00377), або сульфонілкарбамідів (EP-A-0257993, US-A-5013659),

- трансгенні культурні рослини, наприклад бавовник, які здатні продукувати токсини *Bacillus thuringiensis* (Bt-токсини), що надають цим рослинам резистентність до певних шкідників (EP-A-0142924, EP-A-0193259).

- трансгенні культурні рослини з модифікованим складом жирних кислот (WO 91/13972).

- культурні рослини, змінені способами генної інженерії, з новими складовими або вторинними речовинами, наприклад новими фітоалексинами, які сприяють підвищенню стійкості до захворювань (EPA 309862, EPA0464461),

- культурні рослини, змінені способами генної інженерії, зі зниженою фотореспірацією, вищою врожайністю та підвищеною стресостійкістю (EPA 0305398),

- трансгенні культурні рослини, які продукують фармацевтично або діагностично важливі білки ("молекулярний фармінг", англ. molecular pharming),

- трансгенні культурні рослини, які відрізняються вищою врожайністю або кращою якістю,

- трансгенні культурні рослини, які відрізняються вищою врожайністю або кращою якістю,

- трансгенні культурні рослини, які відрізняються комбінацією, наприклад, наведених вище нових властивостей ("стекинг генів", англ. gene stacking)

Численні молекулярно-біологічні технології, за допомогою яких можуть бути створені нові трансгенні рослини зі зміненими властивостями, в принципі відомі; див. наприклад публікацію I. Potrykus, G. Spangenberg (ред.) *Gene Transfer to Plants*, Springer Lab Manual (1995), видавництво Springer Verlag Berlin, Гейдельберг, або Christou, "Trends in Plant Science", 1 (1996) 423-431).

Для подібних маніпуляцій способами генної інженерії в плазміді можна вводити молекули нуклеїнової кислоти, які уможливають мутагенез або послідовні зміни шляхом рекомбінації послідовностей ДНК. За допомогою вищенаведеного стандартного способу можна здійснювати, наприклад, катіонний обмін, видаляти часткові послідовності або додавати природні чи синтетичні послідовності. Для з'єднання фрагментів ДНК між собою можна застосовувати до фрагментів адаптери або лінкери, див., наприклад, публікації B. Sambrook et al., 1989, *Molecular Cloning*, A Laboratory Manual, 2-е видання, Cold Spring Harbor Laboratory Press, Колд Спринг Харбор, Нью-Йорк; або Winnacker "Gene und Klon", видавництво VCH, Вайнхайм, 2-е видання 1996.

Створювати рослинні клітини зі зменшеною активністю генопродукту можна, наприклад, шляхом експресії принаймні однієї відповідної антисмислової РНК, смислової РНК для досягнення ефекту косупресії, або експресії принаймні однієї рибосоми відповідної структури, яка здійснює специфічне розщеплення транскриптів вищевказаного генопродукту. Для цього можна застосовувати, по-перше, молекули ДНК, які охоплюють всю кодуючу послідовність генопродукту, включаючи можливі фланкуючі послідовності, а також молекули ДНК, які охоплюють лише ділянки кодуючої послідовності, причому ці ділянки мають бути достатньо довгими, щоб викликати антисмисловий ефект у клітинах. Можливим є також застосування ДНК-послідовностей, які характеризуються високим ступенем гомології з кодуючими послідовностями генопродукту, але не є повністю ідентичними.

При експресії молекул нуклеїнової кислоти в рослинах синтезований протеїн може бути локалізований у будь-якому компартменті рослинної клітини. Проте, для забезпечення локалізації в певному компартменті можна, наприклад, зв'язати кодуючу ділянку з ДНК-послідовностями, які забезпечують локалізацію в певному компартменті. Такі послідовності відомі спеціалістам (див. наприклад публікації Braun et al., EMBO J. 11 (1992), 3219-3227; Wolter et al., Proc. Natl. Acad. Sci. USA 85 (1988), 846-850; Sonnewald et al., Plant J. 1 (1991), 95-106). Експресія молекул нуклеїнової кислоти може відбуватися також в органеллах клітин рослини.

Трансгенні рослинні клітини можна регенерувати за допомогою відомих технологій для отримання цілих рослин. Трансгенними рослинами можуть бути в принципі рослини будь-якого виду, тобто як однодольні, так і дводольні.

Отже, трансгенні рослини зі зміненими властивостями можуть бути одержані шляхом надекспресії, супресії або інгібування гомологічних (тобто природних) генів чи генних послідовностей, або експресії гетерологічних (тобто чужих) генів чи генних послідовностей.

Переважно відповідні винаходів сполуки можуть бути застосовані у трансгенних культурах, які є резистентними до ростових речовин, таких як, наприклад, дикамба, або до гербіцидів, які пригнічують незамінні рослинні ферменти, наприклад ацетолактатсинтази (АЛС), ЕПШФ синтази, глутамінсинтази (ГС) або гідроксифенілпіруват діоксигенази (ГФПД), та до гербіцидів, які належать до групи, що включає сульфонкарбаміди, гліфосати, глүфосинати або бензоїлізоксазоли та аналогічні активні речовини.

При застосуванні відповідних винаходу активних речовин у трансгенних культурах, окрім їх дії на бур'янові рослини, яку можна спостерігати в інших культурах, часто виникають ефекти, які є специфічними для застосування у відповідній трансгенній культурі, наприклад змінений або спеціально розширений спектр бур'янів, які можна знищити, змінені норми витрати препаратів, переважно добра сумісність з гербіцидами, резистентною до яких є трансгенна культура, а також вплив на ріст і врожайність трансгенних культурних рослин.

Тому предметом винаходу є також застосування відповідних винаходу сполук як гербіцидів для боротьби з бур'яновими рослинами в трансгенних культурних рослинах.

Додатковою перевагою відповідних винаходу сполук є також низька токсичність стосовно таких організмів, як комахи, амфібії, риби і ссавці.

Відповідні винаходу сполуки можуть бути застосовані в формі змочуваних порошків, здатних до емульгування концентратів, розчинів для розбризкування, дустів або гранулятів у стандартних композиціях. Тому предметом винаходу є також гербіцидні та регулюючі ріст рослин засоби, які містять відповідні винаходів сполуки.

Із відповідних винаходів сполук можна виготовляти різні композиції залежно від заданих біологічних і/або хіміко-фізичних параметрів. Можливими варіантами композицій є, наприклад: змочувані порошки (WP), водорозчинні порошки (SP), водорозчинні концентрати, здатні до емульгування концентрати (EC), емульсії (EW), такі як емульсії типу "олія у воді" та "вода в олії", розчини для розбризкування, концентрати суспензій (SC), дисперсії на олійній або водній основі, здатні до змішування з оліями розчини, капсульовані суспензії (CS), дисти (DP), протруйники, грануляти для розкидання на поверхні ґрунту та нанесення на ґрунт, грануляти (GR) в формі мікрогранулятів, гранулятів для розбризкування, виготовлення суспензій та адсорбуючих гранулятів, здатні до диспергування у воді грануляти (WG), водорозчинні грануляти (SG), аерозольні композиції ультранизького об'єму (ULV), мікрокапсули та воски.

Ці окремі види композицій в принципі відомі та описані, наприклад, у публікаціях: Winnacker-Küchler, "Chemische Technologie", том 7, видавництво C. Hauser Verlag, Мюнхен, 4-е видання 1986, Wade van Valkenburg, "Pesticide Formulations", Marcel Dekker, Нью-Йорк, 1973; K. Martens, "Spray Drying" Handbook, 3-є видання 1979, G. Goodwin Ltd., Лондон.

Застосовувані в композиціях необхідні допоміжні засоби, наприклад інертні речовини, поверхнево-активні речовини, розчинники та інші додаткові матеріали також відомі та описані, наприклад, у публікаціях: Watkins, "Handbook of Insecticide Dust Diluents and Carriers", 2-е видання, Darland Books, Колдуел, Нью-Джерсі; H.v. Olphen, "Introduction to Clay Colloid Chemistry"; 2-е видання, J. Wiley & Sons, Нью-Йорк; C. Marsden, "Solvents Guide"; 2-е видання, Interscience, Нью-Йорк, 1963; McCutcheon's "Detergents and Emulsifiers Annual", MC Publ. Corp., Риджвуд, Нью-Джерсі; Sisley and Wood, "Encyclopedia of Surface Active Agents", Chem. Publ. Co. Inc., Нью-Йорк, 1964; Schönfeldt, "Grenzflächenaktive Äthylenoxidaddukte", Wiss. Verlagsgesell., Штуттгарт, 1976; Winnacker-Küchler, "Chemische Technologie", том 7, C. Hauser Verlag, Мюнхен, 4-е видання, 1986.

На основі цих композицій можуть бути виготовлені також комбінації з іншими пестицидно активними речовинами, такими як, наприклад, інсектициди, акарициди, гербіциди, фунгіциди, а також із антидотами, добривами і/або регуляторами росту, наприклад у формі готової до застосування композиції або резервуарної суміші. Придатними до засосування антидотами є, наприклад, мефенпір-діетил, ципросульфамід, ізоксацифен-етил, флорітоцет-мексил і дихлормід.

Змочуваними порошками є препарати, здатні до однорідного диспергування у воді, які крім активної речовини, розріджувача або інертної речовини містять ще іонні і/або неіонні поверхнево-активні речовини (змочувальні засоби, диспергатори), наприклад поліоксєтильовані алкілфеноли, аліфатичні спирти та аміни, сульфати полігліколевих етерів жирних спиртів, алкансульфонати, алкілбензолсульфонати, лігнінсульфонат натрію, 2,2'-динафтилметан-6,6'-дисульфат натрію, дибутилнафталінсульфонат натрію або метил-олеоїл таурат натрію. Для виготовлення змочуваних порошків гербіцидні активні речовини піддають

тонкому перемелюванню, наприклад, у стандартних пристроях, таких як молоткові млини, ударні млини з ситами та крильчаткою і повітряно-струминні млини, і одночасно або потім змішують із допоміжними засобами для композицій.

Придатні до емульгування концентрати виготовляють шляхом розчинення активної речовини в органічному розчиннику, наприклад у бутанолі, циклогексаноні, диметилформаміді, ксилолі, або у висококиплячих ароматичних сполуках чи вуглеводнях, або в сумішах органічних розчинників із додаванням одного чи кількох іонних або неіонних поверхнево-активних речовин (емульгаторів). Придатними до застосування емульгаторами є, наприклад: кальцієві солі алкіларилсульфонової кислоти, такі як додецилбензолсульфонат кальцію, або неіонні емульгатори, такі як естери полігліколю та жирних кислот, алкіларилполігліколевий етер, полігліколеві етери аліфатичних спиртів, продукти конденсації пропіленоксиду і етиленоксиду, алкілполіетери, сорбітанові естери, такі як, наприклад, естери сорбіту і жирних кислот, або поліоксіетилен-сорбітанові естери, такі як, наприклад, поліоксіетилен-сорбітановий естер жирної кислоти.

Дусти одержують шляхом перемелювання активної речовини з тонкодисперсними твердими речовинами, наприклад тальком, природними глинами, такими як каолін, бентоніт та пірофіліт, або діатомовою землею.

Концентрати суспензій можуть бути виготовлені на водній або олійній основі. Їх можна одержувати, наприклад, шляхом мокрого подрібнення у стандартних кульових млинах із додаванням у разі необхідності поверхнево-активних речовин, наприклад таких, які були вказані вище для інших типів композицій.

Емульсії, наприклад типу "олія у воді" (EW), можна одержати, наприклад, за допомогою мішалок, колоїдних млинів і/або статичних змішувачів із застосуванням водних органічних розчинників і в разі необхідності поверхнево-активних речовин, наприклад таких, які вже були наведені вище для інших композицій.

Грануляти можуть бути одержані шляхом розпилення активної речовини крізь сопло на адсорбуючий гранульований інертний матеріал або шляхом нанесення концентратів активної речовини із застосуванням зв'язувальних речовин, наприклад полівінілового спирту, поліакрилату натрію, або також мінеральних масел, на поверхню носіїв, таких як пісок, каолініти або гранульований інертний матеріал. Відповідні активні речовини також можна гранулювати стандартним способом для одержання гранульованих добрив, за бажанням у суміші з добривами.

Грануляти, які здатні до диспергування у воді, зазвичай одержують такими стандартними способами, як розпилювальне сушіння, гранулювання у псевдозрідженому шарі, в тарілчастому грануляторі, змішування у високошвидкісних змішувачах та екструзія без твердої інертної речовини.

Способи одержання гранулятів за допомогою тарілчастих грануляторів, екструдерів, способи гранулювання у псевдозрідженому шарі та розпиленням описані, наприклад у публікаціях "Spray-Drying Handbook", 3-є видання 1979, G. Goodwin Ltd., Лондон; J.E. Browning, "Agglomeration", Chemical and Engineering 1967, сторінки 147 та наст.; "Perry's Chemical Engineer's Handbook", 5-е видання, компанія McGraw-Hill, Нью-Йорк, 1973, с. 8-57.

Більш детальний опис композицій засобів захисту рослин наведений, наприклад, у публікаціях G.C. Klingman, "Weed Control as a Science", John Wiley and Sons, Inc., Нью-Йорк, 1961, стор. 81-96, та J.D. Freyer, S.A. Evans, "Weed Control Handbook", 5-е видання, Blackwell Scientific Publications, Оксфорд, 1968, стор. 101-103.

Як правило, агрохімічні композиції містять від 0,1 до 99 мас. %, зокрема від 0,1 до 95 мас. %, відповідних винаходів сполук.

Концентрація активної речовини в змочуваних порошках становить, наприклад, приблизно від 10 до 90 мас. %, решта до 100 мас. % складається зі стандартних компонентів композиції.

Концентрація активної речовини в здатних до емульгування концентратах може становити наприклад від 1 до 90 мас. %, переважно від 5 до 80 мас. %. Пилоподібні композиції (дусти) містять від 1 до 30 мас. % активної речовини, переважно від 5 до 20 мас. % активної речовини; розчини для розбризкування містять приблизно від 0,05 до 80, переважно від 2 до 50 мас. % активної речовини. Вміст активної речовини у здатних до диспергування у воді гранулятах залежить почасти від форми активної сполуки, тобто рідкої чи твердої, а також від застосовуваних для гранулювання допоміжних речовин, наповнювачів тощо. Вміст активної речовини у здатних до диспергування у воді гранулятах становить, наприклад, від 1 до 95 мас. %, переважно від 10 до 80 мас. %.

Окрім цього, зазначені композиції активних речовин у разі необхідності містять традиційні засоби для поліпшення адгезії, змочувальні засоби, диспергатори, емульгатори, засоби для

посилення penetрації, консерванти, антифризи і розчинники, наповнювачі, барвники і носії, антиспіювачі, антитранспіранти та засоби для регулювання значення рН і в'язкості.

Для застосування комерційно доступні композиції в разі необхідності розбавляють; наприклад, для розбавлення змочуваних порошків, здатних до емульгування концентратів, дисперсій і здатних до диспергування у воді гранулятів використовують воду. Пилоподібні композиції (дусти), грануляти для розкидання на поверхні ґрунту чи нанесення на ґрунт, а також розчини для розбризкування перед застосуванням зазвичай вже не розбавляють іншими інертними речовинами.

Залежно від зовнішніх умов, таких як температура, вологість, вид застосовуваного гербіциду, змінюється зокрема необхідна норма витрати сполук формули (I). Вона може коливатися в межах широкого діапазону, наприклад від 0,001 до 1,0 кг/га або більше активної речовини, проте, переважно вона становить від 0,005 до 750 г/га.

Далі наведені приклади для пояснення винаходу.

А. Хімічні приклади

1. Синтез етил-1-[[2-метил-3-(метилсульфоніл)-4-(трифторметил)бензоїл](5-метил-1,3,4-оксадіазол-2-іл)аміно]етилкарбонату (табличний приклад № 1-145), етил-1-[5-метил-2-[[2-метил-3-(метилсульфоніл)-4-(трифторметил)бензоїл]іміно]-1,3,4-оксадіазол-3(2H)-іл]етилкарбонат (табличний приклад № 4-145) і 1-[(етоксикарбоніл)оксі]-етил-2-метил-N-(5-метил-1,3,4-оксадіазол-2-іл)-3-(метилсульфоніл)-4-(трифторметил)бензолкарбоксимідат (табличний приклад № 7-145):

До розчину 1,00 г (2,752 ммоль) 2-метил-N-(5-метил-1,3,4-оксадіазол-2-іл)-3-(метилсульфоніл)-4-(трифторметил)бензаміду у 20 мл ацетонітрилу при кімнатній температурі додавали 882 мг (5,78 ммоль) 1-хлоретил-етилкарбонату та 799 мг (5,78 ммоль) карбонату калію і протягом 9 годин кип'ятили зі зворотним холодильником. Реакційну суміш концентрували, потім розчиняли в 20 мл етилацетату, змішували з 20 мл води та екстрагували. Водну фазу ще двічі екстрагували із застосуванням у кожному випадку 20 мл етилацетату. Об'єднані органічні фази промивали насиченим розчином NaCl, висушували і концентрували. Залишок очищали методом обернено-фазової високо-ефективної рідинної хроматографії (ОФ-ВЕРХ) (ацетонітрил/вода).

Сполука № 1-145

Вихід: 170 мг (12 %)

¹H-ЯМР (400 МГц; CDCl₃): 7,73 млн.ч. (д, 1H); 7,53 млн.ч. (д, 1H), 7,05-6,92 (ш, 1H), 4,32 – 4,26 (м, 2H); 3,21 (с, 3H); 2,80 (с, 3H), 2,43 (с, 3H), 1,62 (д, 3H), 1,36 (т, 3H).

Сполука № 4-145

Вихід: 180 мг (12,3 %)

¹H-ЯМР (400 МГц; CDCl₃): 8,04 млн.ч. (д, 1H); 7,81 млн.ч. (д, 1H), 6,74 (кв, 1H), 4,25-4,18 (м, 2H); 3,25 (с, 3H); 2,92 (с, 3H); 2,49 (с, 3H); 1,77 (д, 3H), 1,30 (т, 3H).

Сполука № 7-145

Вихід: 110 мг (7,9 %)

¹H-ЯМР (400 МГц; CDCl₃): 7,80 млн.ч. (д, 1H); 7,54 млн.ч. (д, 1H), 7,16 (кв, 1H), 4,27 (кв, 2H); 3,24 (с, 3H); 2,73 (с, 3H); 2,40 (с, 3H); 1,73 (д, 3H), 1,34 (т, 3H).

2. Синтез 1-[[2-хлор-3-(метилсульфініл)-4-(трифторметил)бензоїл](5-метил-1,3,4-оксадіазол-2-іл)аміно]етил-етилкарбонату (табличний приклад № 1-385), етил-1-[5-метил-2-[[2-хлор-3-(метилсульфініл)-4-(трифторметил)бензоїл]іміно]-1,3,4-оксадіазол-3(2H)-іл]етилкарбонату (табличний приклад № 4-385) і 1-[(етоксикарбоніл)оксі]етил-2-хлор-N-(5-метил-1,3,4-оксадіазол-2-іл)-3-(метилсульфініл)-4-(трифторметил)бензолкарбоксимідату (табличний приклад № 7-385):

Аналогічно вищеописаному способу одержання шляхом перетворення 1,00 г (2,719 ммоль) 2-хлор-N-(5-метил-1,3,4-оксадіазол-2-іл)-3-(метилсульфініл)-4-(трифторметил)бензаміду відокремлювали із застосуванням 871 мг (5,71 ммоль) 1-хлоретил-етилкарбонату:

Сполука № 1-385

Вихід: 210 мг (13 %)

¹H-ЯМР (400 МГц; CDCl₃): 7,70 млн.ч. (д, 1H); 7,63 млн.ч. (д, 1H), 7,12-6,91 (ш, 1H), 4,28 (кв, 2H); 3,07 і 3,05 (2с, 3H); 2,46 (с, 3H), 1,66 і 1,64 (2д, 3H), 1,34 (т, 3H).

Сполука № 4-385

Вихід: 200 мг (13,7 %)

¹H-ЯМР (400 МГц; CDCl₃): 7,96 млн.ч. (д, 1H); 7,74 млн.ч. (д, 1H), 6,74 (кв, 1H), 4,26 – 4,18 (м, 2H); 3,13 (с, 3H); 2,49 (с, 3H); 1,77 (д, 3H), 1,30 (т, 3H).

Сполука № 7-385

Вихід: 130 мг (9,4 %)

¹H-ЯМР (400 МГц; CDCl₃): 7,78-7,75 млн.ч. (2д, 1H); 7,66-7,62 млн.ч. (2д, 1H), 7,18 (2кв, 1H), 4,31-4,24 (2кв, 2H); 3,08 (с, 3H); 2,42 (с, 3H); 1,74 (2д, 3H), 1,34 (2т; 3H).

3. Синтез 1-[[2-хлор-3-(метилсульфініл)-4-(трифторметил)бензоїл](5-метил-1,3,4-оксадіазол-2-іл)аміно]етил-циклогексилкарбонату (табличний приклад № 3-385), 1-[2-[[2-хлор-3-(метилсульфініл)-4-(трифторметил)бензоїл]іміно]-5-метил-1,3,4-оксадіазол-3(2H)-іл]етил-циклогексилкарбонату (табличний приклад № 6-385) і 1-[[1-(цикло-гексилокси)карбоніл]оксі]етил-2-хлор-N-(5-метил-1,3,4-оксадіазол-2-іл)-3-(метилсульфініл)-4-(трифторметил)бензолкарбоксимідату (табличний приклад № 9-385):

Аналогічно вищеописаному способу одержання шляхом перетворення 1,00 г (2,719 ммоль) 2-хлор-N-(5-метил-1,3,4-оксадіазол-2-іл)-3-(метилсульфініл)-4-(трифторметил)бензаміду відокремлювали із застосуванням 1180 мг (5,71 ммоль) 1-хлоретил-циклогексилкарбонату:

Сполука № 3-385

Вихід: 190 мг (10 %)

¹H-ЯМР (400 МГц; CDCl₃): 7,74 млн.ч. (д, 1H); 7,65 млн.ч. (д, 1H), 7,21-6,89 (ш, 1H), 4,71-4,66 (м, 1H); 3,05 і 3,07 (2с, 3H); 2,48 (с, 3H), 2,00-1,88 (м, 2H), 1,80-1,71 (м, 2H), 1,70-1,20 (м, 9H).

Сполука № 6-385

Вихід: 50 мг (3,3 %)

¹H-ЯМР (400 МГц; CDCl₃): 7,96 млн.ч. (д, 1H); 7,74 млн.ч. (д, 1H), 6,74 (кв, 1H), 4,64-4,59 (м, 1H); 3,13 (с, 3H); 1,93-1,20 (м, 13H).

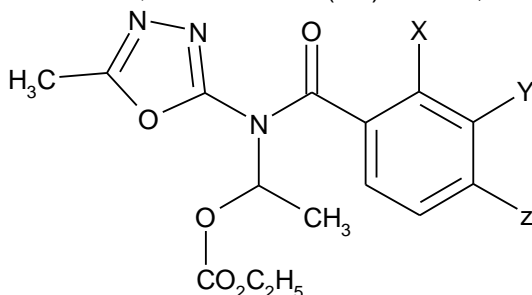
Сполука № 9-385

Вихід: 180 мг (12 %)

¹H-ЯМР (400 МГц; CDCl₃): 7,78-7,75 млн.ч. (2д, 1H); 7,65-7,62 млн.ч. (2д, 1H), 7,18 (2кв, 1H), 4,70-4,66 (м, 1H); 3,08 (с, 3H); 2,42 (с, 3H); 1,94-1,92 (м, 2H), 1,78 – 1,73 (м, 5H), 1,59-1,26 (м, 6H).

Наведені далі в таблицях приклади були або можуть бути одержані аналогічно описаним вище методам. Наведені далі в таблицях сполуки є цілком переважними.

Таблиця 1: Відповідні винаходів сполуки загальної формули (I), в якій А означає А1, R⁶ означає метил, R означає CH(Me)OCO₂Et, W означає CY та V означає водень



| № | X | Y | Z | Фізичні параметри (¹ H-ЯМР, 400 МГц; CDCl ₃): |
|------|----|---|------------------------------------|---|
| 1-1 | F | H | Cl | |
| 1-2 | F | H | SO ₂ Me | |
| 1-3 | F | H | SO ₂ Et | |
| 1-4 | F | H | CF ₃ | |
| 1-5 | F | H | NO ₂ | |
| 1-6 | Cl | H | Br | |
| 1-7 | Cl | H | SMe | |
| 1-8 | Cl | H | SOMe | |
| 1-9 | Cl | H | SO ₂ Me | |
| 1-10 | Cl | H | SO ₂ CH ₂ Cl | |

| № | X | Y | Z | Фізичні параметри (¹ H-ЯМР, 400 МГц; CDCl ₃): |
|------|--------------------|---|-----------------------|---|
| 1-11 | Cl | H | SEt | |
| 1-12 | Cl | H | SO ₂ Et | |
| 1-13 | Cl | H | CF ₃ | |
| 1-14 | Cl | H | NO ₂ | |
| 1-15 | Cl | H | піразол-1-іл | |
| 1-16 | Cl | H | 1H-1,2,4-триазол-1-іл | |
| 1-17 | Br | H | Cl | |
| 1-18 | Br | H | Br | |
| 1-19 | Br | H | SO ₂ Me | |
| 1-20 | Br | H | SO ₂ Et | |
| 1-21 | Br | H | CF ₃ | |
| 1-22 | SO ₂ Me | H | Cl | |
| 1-23 | SO ₂ Me | H | Br | |
| 1-24 | SO ₂ Me | H | SMe | |
| 1-25 | SO ₂ Me | H | SOMe | |
| 1-26 | SO ₂ Me | H | SO ₂ Me | |
| 1-27 | SO ₂ Me | H | SO ₂ Et | |
| 1-28 | SO ₂ Me | H | CF ₃ | |
| 1-29 | SO ₂ Et | H | Cl | |
| 1-30 | SO ₂ Et | H | Br | |
| 1-31 | SO ₂ Et | H | SMe | |
| 1-32 | SO ₂ Et | H | SOMe | |
| 1-33 | SO ₂ Et | H | SO ₂ Me | |
| 1-34 | SO ₂ Et | H | CF ₃ | |
| 1-35 | NO ₂ | H | F | |
| 1-36 | NO ₂ | H | Cl | |
| 1-37 | NO ₂ | H | Br | |

| № | X | Y | Z | Фізичні параметри (¹ H-ЯМР, 400 МГц; CDCl ₃): |
|------|------------------------------------|-----------------|------------------------------------|---|
| 1-38 | NO ₂ | H | I | |
| 1-39 | NO ₂ | H | CN | |
| 1-40 | NO ₂ | H | SO ₂ Me | |
| 1-41 | NO ₂ | H | SO ₂ Et | |
| 1-42 | NO ₂ | H | CF ₃ | |
| 1-43 | Me | H | Cl | |
| 1-44 | Me | H | Br | |
| 1-45 | Me | H | SMe | |
| 1-46 | Me | H | SO ₂ Me | |
| 1-47 | Me | H | SO ₂ CH ₂ Cl | |
| 1-48 | Me | H | SEt | |
| 1-49 | Me | H | SO ₂ Et | |
| 1-50 | Me | H | CF ₃ | |
| 1-51 | CH ₂ SO ₂ Me | H | CF ₃ | |
| 1-52 | Et | H | Cl | |
| 1-53 | Et | H | Br | |
| 1-54 | Et | H | SMe | |
| 1-55 | Et | H | SO ₂ Me | |
| 1-56 | Et | H | SO ₂ CH ₂ Cl | |
| 1-57 | Et | H | SEt | |
| 1-58 | Et | H | SO ₂ Et | |
| 1-59 | Et | H | CF ₃ | |
| 1-60 | CF ₃ | H | Cl | |
| 1-61 | CF ₃ | H | Br | |
| 1-62 | CF ₃ | H | SO ₂ Me | |
| 1-63 | CF ₃ | H | SO ₂ Et | |
| 1-64 | CF ₃ | H | CF ₃ | |
| 1-65 | NO ₂ | NH ₂ | F | |

| № | X | Y | Z | Фізичні параметри (¹ H-ЯМР, 400 МГц; CDCl ₃): |
|------|-----------------|---------------------------------------|-------------------------------|---|
| 1-66 | NO ₂ | NHMe | F | |
| 1-67 | NO ₂ | NMe ₂ | F | |
| 1-68 | NO ₂ | Me | Cl | |
| 1-69 | NO ₂ | NH ₂ | Cl | |
| 1-70 | NO ₂ | NHMe | Cl | |
| 1-71 | NO ₂ | NMe ₂ | Cl | |
| 1-72 | NO ₂ | NH ₂ | Br | |
| 1-73 | NO ₂ | NHMe | Br | |
| 1-74 | NO ₂ | NMe ₂ | Br | |
| 1-75 | NO ₂ | NH ₂ | CF ₃ | |
| 1-76 | NO ₂ | NMe ₂ | CF ₃ | |
| 1-77 | NO ₂ | NH ₂ | SO ₂ Me | |
| 1-78 | NO ₂ | NH ₂ | SO ₂ Et | |
| 1-79 | NO ₂ | NHMe | SO ₂ Me | |
| 1-80 | NO ₂ | NMe ₂ | SO ₂ Me | |
| 1-81 | NO ₂ | NMe ₂ | SO ₂ Et | |
| 1-82 | NO ₂ | NH ₂ | 1H-1,2,4- триазол-1- іл | |
| 1-83 | NO ₂ | NHMe | 1H-1,2,4- триазол-1- іл | |
| 1-84 | NO ₂ | NMe ₂ | 1H-1,2,4- триазол-1- іл | |
| 1-85 | Me | SMe | H | |
| 1-86 | Me | SOMe | H | |
| 1-87 | Me | SO ₂ Me | H | |
| 1-88 | Me | SEt | H | |
| 1-89 | Me | SOEt | H | |
| 1-90 | Me | SO ₂ Et | H | |
| 1-91 | Me | S(CH ₂) ₂ OMe | H | |
| 1-92 | Me | SO(CH ₂) ₂ OMe | H | |

| № | X | Y | Z | Фізичні параметри (¹ H-ЯМР, 400 МГц; CDCl ₃): |
|-------|----|---|----|---|
| 1-93 | Me | SO ₂ (CH ₂) ₂ OMe | H | |
| 1-94 | Me | F | F | |
| 1-95 | Me | F | Cl | |
| 1-96 | Me | SEt | F | |
| 1-97 | Me | SOEt | F | |
| 1-98 | Me | SO ₂ Et | F | |
| 1-99 | Me | Me | Cl | |
| 1-100 | Me | F | Cl | |
| 1-101 | Me | Cl | Cl | |
| 1-102 | Me | NH ₂ | Cl | |
| 1-103 | Me | NHMe | Cl | |
| 1-104 | Me | NMe ₂ | Cl | |
| 1-105 | Me | O(CH ₂) ₂ OMe | Cl | |
| 1-106 | Me | O(CH ₂) ₃ OMe | Cl | |
| 1-107 | Me | O(CH ₂) ₄ OMe | Cl | |
| 1-108 | Me | OCH ₂ CONMe ₂ | Cl | |
| 1-109 | Me | O(CH ₂) ₂ -CO-NMe ₂ | Cl | |
| 1-110 | Me | O(CH ₂) ₂ -NH(CO)NMe ₂ | Cl | |
| 1-111 | Me | O(CH ₂) ₂ -NH(CO)NHCO ₂ Et | Cl | |
| 1-112 | Me | O(CH ₂) ₂ -NHCO ₂ Me | Cl | |
| 1-113 | Me | OCH ₂ -NHCO ₂ cPr | Cl | |
| 1-114 | Me | O(CH ₂)-5-2,4-диметил-2,4-дигідро-3Н-1,2,4-триазол-3-он | Cl | |
| 1-115 | Me | O(CH ₂)-3,5-диметил-1,2-оксазол-4-іл | Cl | |
| 1-116 | Me | SMe | Cl | |
| 1-117 | Me | SOMe | Cl | |
| 1-118 | Me | SO ₂ Me | Cl | |
| 1-119 | Me | SEt | Cl | |
| 1-120 | Me | SOEt | Cl | |

| № | X | Y | Z | Фізичні параметри (¹ H-ЯМР, 400 МГц; CDCl ₃): |
|-------|----|---|-----------------|--|
| 1-121 | Me | SO ₂ Et | Cl | |
| 1-122 | Me | S(CH ₂) ₂ OMe | Cl | |
| 1-123 | Me | SO(CH ₂) ₂ OMe | Cl | |
| 1-124 | Me | SO ₂ (CH ₂) ₂ OMe | Cl | |
| 1-125 | Me | NH ₂ | Br | |
| 1-126 | Me | NHMe | Br | |
| 1-127 | Me | NMe ₂ | Br | |
| 1-128 | Me | OCH ₂ (CO)NMe ₂ | Br | |
| 1-129 | Me | O(CH ₂)-5-піролідин-2-он | Br | |
| 1-130 | Me | SMe | Br | |
| 1-131 | Me | SOMe | Br | |
| 1-132 | Me | SO ₂ Me | Br | |
| 1-133 | Me | SEt | Br | |
| 1-134 | Me | SOEt | Br | |
| 1-135 | Me | SO ₂ Et | Br | |
| 1-136 | Me | SMe | I | |
| 1-137 | Me | SOMe | I | |
| 1-138 | Me | SO ₂ Me | I | |
| 1-139 | Me | SEt | I | |
| 1-140 | Me | SOEt | I | |
| 1-141 | Me | SO ₂ Et | I | |
| 1-142 | Me | Cl | CF ₃ | |
| 1-143 | Me | SMe | CF ₃ | |
| 1-144 | Me | SOMe | CF ₃ | |
| 1-145 | Me | SO ₂ Me | CF ₃ | 7,73 млн.ч. (д, 1H); 7,53 млн.ч. (д, 1H), 7,05-6,92 (ш, 1H), 4,32-4,26 (м, 2H); 3,21 (с, 3H); 2,80 (с, 3H), 2,43 (с, 3H), 1,62 (д, 3H), 1,36 (т, 3H) |

| № | X | Y | Z | Фізичні параметри (¹ H-ЯМР, 400 МГц; CDCl ₃): |
|-------|----|---|--------------------|---|
| 1-146 | Me | SEt | CF ₃ | |
| 1-147 | Me | SOEt | CF ₃ | |
| 1-148 | Me | SO ₂ Et | CF ₃ | |
| 1-149 | Me | S(CH ₂) ₂ OMe | CF ₃ | |
| 1-150 | Me | SO(CH ₂) ₂ OMe | CF ₃ | |
| 1-151 | Me | SO ₂ (CH ₂) ₂ OMe | CF ₃ | |
| 1-152 | Me | Me | SO ₂ Me | |
| 1-153 | Me | 4,5-дигідро-1,2-оксазол-3-іл | SO ₂ Me | |
| 1-154 | Me | 4,5-дигідро-1,2-оксазол-3-іл | SO ₂ Et | |
| 1-155 | Me | 5-ціанометил- 4,5-дигідро-1,2-оксазол-3-іл | SO ₂ Me | |
| 1-156 | Me | 5-ціанометил- 4,5-дигідро-1,2-оксазол-3-іл | SO ₂ Et | |
| 1-157 | Me | NH ₂ | SO ₂ Me | |
| 1-158 | Me | NHMe | SO ₂ Me | |
| 1-159 | Me | NMe ₂ | SO ₂ Me | |
| 1-160 | Me | NH(CH ₂) ₂ OMe | SO ₂ Me | |
| 1-161 | Me | піразол-1-іл | SO ₂ Me | |
| 1-162 | Me | OH | SO ₂ Me | |
| 1-163 | Me | OMe | SO ₂ Me | |
| 1-164 | Me | OMe | SO ₂ Et | |
| 1-165 | Me | OEt | SO ₂ Me | |
| 1-166 | Me | OEt | SO ₂ Et | |
| 1-167 | Me | OiPr | SO ₂ Me | |
| 1-168 | Me | OiPr | SO ₂ Et | |
| 1-169 | Me | O(CH ₂) ₂ OMe | SO ₂ Me | |
| 1-170 | Me | O(CH ₂) ₂ OMe | SO ₂ Et | |
| 1-171 | Me | O(CH ₂) ₃ OMe | SO ₂ Me | |
| 1-172 | Me | O(CH ₂) ₃ OMe | SO ₂ Et | |
| 1-173 | Me | O(CH ₂) ₄ OMe | SO ₂ Me | |

| № | X | Y | Z | Фізичні параметри (¹ H-ЯМР, 400 МГц; CDCl ₃): |
|-------|--|--|--------------------|---|
| 1-174 | Me | O(CH ₂) ₄ OMe | SO ₂ Et | |
| 1-175 | Me | O(CH ₂) ₂ NHSO ₂ Me | SO ₂ Me | |
| 1-176 | Me | O(CH ₂) ₂ NHSO ₂ Me | SO ₂ Et | |
| 1-177 | Me | OCH ₂ (CO)NMe ₂ | SO ₂ Me | |
| 1-178 | Me | OCH ₂ (CO)NMe ₂ | SO ₂ Et | |
| 1-179 | Me | [1,4]діоксан-2-іл-метокси | SO ₂ Me | |
| 1-180 | Me | [1,4]діоксан-2-іл-метокси | SO ₂ Et | |
| 1-181 | Me | O(CH ₂) ₂ -O(3,5-di- метоксипіримідин-2-іл | SO ₂ Me | |
| 1-182 | Me | Cl | SO ₂ Me | |
| 1-183 | Me | SMe | SO ₂ Me | |
| 1-184 | Me | SOMe | SO ₂ Me | |
| 1-185 | Me | SO ₂ Me | SO ₂ Me | |
| 1-186 | Me | SO ₂ Me | SO ₂ Et | |
| 1-187 | Me | SEt | SO ₂ Me | |
| 1-188 | Me | SOEt | SO ₂ Me | |
| 1-189 | Me | SO ₂ Et | SO ₂ Me | |
| 1-190 | Me | S(CH ₂) ₂ OMe | SO ₂ Me | |
| 1-191 | Me | SO(CH ₂) ₂ OMe | SO ₂ Me | |
| 1-192 | Me | SO ₂ (CH ₂) ₂ OMe | SO ₂ Me | |
| 1-193 | CH ₂ SMe | OMe | SO ₂ Me | |
| 1-194 | CH ₂ OMe | OMe | SO ₂ Me | |
| 1-195 | CH ₂ O(CH ₂) ₂ OMe | NH(CH ₂) ₂ OEt | SO ₂ Me | |
| 1-196 | CH ₂ O(CH ₂) ₂ OMe | NH(CH ₂) ₃ OEt | SO ₂ Me | |
| 1-197 | CH ₂ O(CH ₂) ₃ OMe | OMe | SO ₂ Me | |
| 1-198 | CH ₂ O(CH ₂) ₂ OMe | NH(CH ₂) ₂ OMe | SO ₂ Me | |
| 1-199 | CH ₂ O(CH ₂) ₂ OMe | NH(CH ₂) ₃ OMe | SO ₂ Me | |
| 1-200 | Et | SMe | Cl | |
| 1-201 | Et | SO ₂ Me | Cl | |

| № | X | Y | Z | Фізичні параметри (¹ H-ЯМР, 400 МГц; CDCl ₃): |
|-------|-----------------|---------------------------------------|--------------------|---|
| 1-202 | Et | SMe | CF ₃ | |
| 1-203 | Et | SO ₂ Me | CF ₃ | |
| 1-204 | Et | F | SO ₂ Me | |
| 1-205 | Et | NH(CH ₂) ₂ OMe | SO ₂ Me | |
| 1-206 | iPr | SO ₂ Me | CF ₃ | |
| 1-207 | cPr | SO ₂ Me | CF ₃ | |
| 1-208 | CF ₃ | O(CH ₂) ₂ OMe | F | |
| 1-209 | CF ₃ | O(CH ₂) ₃ OMe | F | |
| 1-210 | CF ₃ | OCH ₂ CONMe ₂ | F | |
| 1-211 | CF ₃ | [1,4]діоксан-2-іл-метокси | F | |
| 1-212 | CF ₃ | O(CH ₂) ₂ OMe | Cl | |
| 1-213 | CF ₃ | O(CH ₂) ₃ OMe | Cl | |
| 1-214 | CF ₃ | OCH ₂ CONMe ₂ | Cl | |
| 1-215 | CF ₃ | [1,4]діоксан-2-іл-метокси | Cl | |
| 1-216 | CF ₃ | O(CH ₂) ₂ OMe | Br | |
| 1-217 | CF ₃ | O(CH ₂) ₃ OMe | Br | |
| 1-218 | CF ₃ | OCH ₂ CONMe ₂ | Br | |
| 1-219 | CF ₃ | [1,4]діоксан-2-іл-метокси | Br | |
| 1-220 | CF ₃ | O(CH ₂) ₂ OMe | I | |
| 1-221 | CF ₃ | O(CH ₂) ₃ OMe | I | |
| 1-222 | CF ₃ | OCH ₂ CONMe ₂ | I | |
| 1-223 | CF ₃ | [1,4]діоксан-2-іл-метокси | I | |
| 1-224 | CF ₃ | F | SO ₂ Me | |
| 1-225 | CF ₃ | F | SO ₂ Et | |
| 1-226 | CF ₃ | O(CH ₂) ₂ OMe | SO ₂ Me | |
| 1-227 | CF ₃ | O(CH ₂) ₂ OMe | SO ₂ Et | |
| 1-228 | CF ₃ | O(CH ₂) ₃ OMe | SO ₂ Me | |
| 1-229 | CF ₃ | O(CH ₂) ₃ OMe | SO ₂ Et | |

| № | X | Y | Z | Фізичні параметри (¹ H-ЯМР, 400 МГц; CDCl ₃): |
|-------|-----------------|---|--------------------|---|
| 1-230 | CF ₃ | OCH ₂ CONMe ₂ | SO ₂ Me | |
| 1-231 | CF ₃ | OCH ₂ CONMe ₂ | SO ₂ Et | |
| 1-232 | CF ₃ | [1,4]діоксан-2-іл-метокси | SO ₂ Me | |
| 1-233 | CF ₃ | [1,4]діоксан-2-іл-метокси | SO ₂ Et | |
| 1-234 | F | SMe | CF ₃ | |
| 1-235 | F | SOMe | CF ₃ | |
| 1-236 | Cl | Me | Cl | |
| 1-237 | Cl | OCH ₂ CHCH ₂ | Cl | |
| 1-238 | Cl | OCH ₂ CHF ₂ | Cl | |
| 1-239 | Cl | O(CH ₂) ₂ OMe | Cl | |
| 1-240 | Cl | OCH ₂ CONMe ₂ | Cl | |
| 1-241 | Cl | O(CH ₂)-5-піролідин-2-он | Cl | |
| 1-242 | Cl | SMe | Cl | |
| 1-243 | Cl | SOMe | Cl | |
| 1-244 | Cl | SO ₂ Me | Cl | |
| 1-245 | Cl | F | SMe | |
| 1-246 | Cl | Cl | SO ₂ Me | |
| 1-247 | Cl | CO ₂ Me | SO ₂ Me | |
| 1-248 | Cl | CONMe ₂ | SO ₂ Me | |
| 1-249 | Cl | CONMe(OMe) | SO ₂ Me | |
| 1-250 | Cl | CH ₂ OMe | SO ₂ Me | |
| 1-251 | Cl | CH ₂ OMe | SO ₂ Et | |
| 1-252 | Cl | CH ₂ OEt | SO ₂ Me | |
| 1-253 | Cl | CH ₂ OEt | SO ₂ Et | |
| 1-254 | Cl | CH ₂ OCH ₂ CHF ₂ | SO ₂ Me | |
| 1-255 | Cl | CH ₂ OCH ₂ CF ₃ | SO ₂ Me | |
| 1-256 | Cl | CH ₂ OCH ₂ CF ₃ | SO ₂ Et | |
| 1-257 | Cl | CH ₂ OCH ₂ CF ₂ CHF ₂ | SO ₂ Me | |

| № | X | Y | Z | Фізичні параметри (¹ H-ЯМР, 400 МГц; CDCl ₃): |
|-------|----|---|--------------------|---|
| 1-258 | Cl | CH ₂ O-ц-пентил | SO ₂ Me | |
| 1-259 | Cl | CH ₂ PO(OMe) ₂ | SO ₂ Me | |
| 1-260 | Cl | 4,5-дигідро-1,2-оксазол-3-іл | SMe | |
| 1-261 | Cl | 4,5-дигідро-1,2-оксазол-3-іл | SO ₂ Me | |
| 1-262 | Cl | 4,5-дигідро-1,2-оксазол-3-іл | SO ₂ Et | |
| 1-263 | Cl | 5-ціанометил- 4,5-дигідро-1,2-оксазол-3-іл | SO ₂ Me | |
| 1-264 | Cl | 5-ціанометил- 4,5-дигідро-1,2-оксазол-3-іл | SO ₂ Et | |
| 1-265 | Cl | 5-(метоксиметил)-4,5-дигідро-1,2-оксазол-3-іл | SO ₂ Et | |
| 1-266 | Cl | 5-(метоксиметил)-5-метил-4,5-дигідро-1,2-оксазол-3-іл | SO ₂ Et | |
| 1-267 | Cl | CH ₂ O-тетрагідрофуран-3-іл | SO ₂ Me | |
| 1-268 | Cl | CH ₂ O- тетрагідрофуран-3-іл | SO ₂ Et | |
| 1-269 | Cl | CH ₂ OCH ₂ -тетрагідрофуран-2-іл | SO ₂ Me | |
| 1-270 | Cl | CH ₂ OCH ₂ - тетрагідрофуран-2-іл | SO ₂ Et | |
| 1-271 | Cl | CH ₂ OCH ₂ - тетрагідрофуран-3-іл | SO ₂ Me | |
| 1-272 | Cl | CH ₂ OCH ₂ - тетрагідрофуран-3-іл | SO ₂ Et | |
| 1-273 | Cl | OMe | SO ₂ Me | |
| 1-274 | Cl | OMe | SO ₂ Et | |
| 1-275 | Cl | OEt | SO ₂ Me | |
| 1-276 | Cl | OEt | SO ₂ Et | |
| 1-277 | Cl | OiPr | SO ₂ Me | |
| 1-278 | Cl | OiPr | SO ₂ Et | |
| 1-279 | Cl | O(CH ₂) ₂ OMe | SO ₂ Me | |
| 1-280 | Cl | O(CH ₂) ₄ OMe | SO ₂ Me | |
| 1-281 | Cl | O(CH ₂) ₄ OMe | SO ₂ Et | |
| 1-282 | Cl | O(CH ₂) ₃ OMe | SO ₂ Me | |
| 1-283 | Cl | O(CH ₂) ₃ OMe | SO ₂ Et | |
| 1-284 | Cl | O(CH ₂) ₂ OMe | SO ₂ Me | |
| 1-285 | Cl | O(CH ₂) ₂ OMe | SO ₂ Et | |

| № | X | Y | Z | Фізичні параметри (¹ H-ЯМР, 400 МГц; CDCl ₃): |
|-------|-----|---------------------------------------|--------------------|---|
| 1-286 | Cl | [1,4]діоксан-2-іл-метокси | SO ₂ Me | |
| 1-287 | Cl | [1,4]діоксан-2-іл-метокси | SO ₂ Et | |
| 1-288 | Cl | OCH ₂ (CO)NMe ₂ | SO ₂ Me | |
| 1-289 | Cl | OCH ₂ (CO)NMe ₂ | SO ₂ Et | |
| 1-290 | Cl | SMe | SO ₂ Me | |
| 1-291 | Cl | SOMe | SO ₂ Me | |
| 1-292 | Br | OMe | Br | |
| 1-293 | Br | O(CH ₂) ₂ OMe | Br | |
| 1-294 | Br | O(CH ₂) ₂ OMe | SO ₂ Me | |
| 1-295 | Br | O(CH ₂) ₂ OMe | SO ₂ Et | |
| 1-296 | Br | O(CH ₂) ₃ OMe | SO ₂ Me | |
| 1-297 | Br | O(CH ₂) ₃ OMe | SO ₂ Et | |
| 1-298 | Br | O(CH ₂) ₄ OMe | SO ₂ Me | |
| 1-299 | Br | O(CH ₂) ₄ OMe | SO ₂ Et | |
| 1-300 | Br | [1,4]діоксан-2-іл-метокси | SO ₂ Me | |
| 1-301 | Br | [1,4]діоксан-2-іл-метокси | SO ₂ Et | |
| 1-302 | I | O(CH ₂) ₂ OMe | SO ₂ Me | |
| 1-303 | I | O(CH ₂) ₂ OMe | SO ₂ Et | |
| 1-304 | I | O(CH ₂) ₃ OMe | SO ₂ Me | |
| 1-305 | I | O(CH ₂) ₃ OMe | SO ₂ Et | |
| 1-306 | I | O(CH ₂) ₄ OMe | SO ₂ Me | |
| 1-307 | I | O(CH ₂) ₄ OMe | SO ₂ Et | |
| 1-308 | I | [1,4]діоксан-2-іл-метокси | SO ₂ Me | |
| 1-309 | I | [1,4]діоксан-2-іл-метокси | SO ₂ Et | |
| 1-310 | OMe | SMe | CF ₃ | |
| 1-311 | OMe | SOMe | CF ₃ | |
| 1-312 | OMe | SO ₂ Me | CF ₃ | |
| 1-313 | OMe | SOEt | CF ₃ | |

| № | X | Y | Z | Фізичні параметри (¹ H-ЯМР, 400 МГц; CDCl ₃): |
|-------|------------------------|---|-----------------|---|
| 1-314 | OMe | SO ₂ Et | CF ₃ | |
| 1-315 | OMe | S(CH ₂) ₂ OMe | CF ₃ | |
| 1-316 | OMe | SO(CH ₂) ₂ OMe | CF ₃ | |
| 1-317 | OMe | SO ₂ (CH ₂) ₂ OMe | CF ₃ | |
| 1-318 | OMe | SMe | Cl | |
| 1-319 | OMe | SOMe | Cl | |
| 1-320 | OMe | SO ₂ Me | Cl | |
| 1-321 | OMe | SEt | Cl | |
| 1-322 | OMe | SOEt | Cl | |
| 1-323 | OMe | SO ₂ Et | Cl | |
| 1-324 | OMe | S(CH ₂) ₂ OMe | Cl | |
| 1-325 | OMe | SO(CH ₂) ₂ OMe | Cl | |
| 1-326 | OMe | SO ₂ (CH ₂) ₂ OMe | Cl | |
| 1-327 | OCH ₂ -c-Pr | SMe | CF ₃ | |
| 1-328 | OCH ₂ -c-Pr | SOMe | CF ₃ | |
| 1-329 | OCH ₂ -c-Pr | SO ₂ Me | CF ₃ | |
| 1-330 | OCH ₂ -c-Pr | SEt | CF ₃ | |
| 1-331 | OCH ₂ -c-Pr | SOEt | CF ₃ | |
| 1-332 | OCH ₂ -c-Pr | SO ₂ Et | CF ₃ | |
| 1-333 | OCH ₂ -c-Pr | S(CH ₂) ₂ OMe | CF ₃ | |
| 1-334 | OCH ₂ -c-Pr | SO(CH ₂) ₂ OMe | CF ₃ | |
| 1-335 | OCH ₂ -c-Pr | SO ₂ (CH ₂) ₂ OMe | CF ₃ | |
| 1-336 | OCH ₂ -c-Pr | SMe | Cl | |
| 1-337 | OCH ₂ -c-Pr | SOMe | Cl | |
| 1-338 | OCH ₂ -c-Pr | SO ₂ Me | Cl | |
| 1-339 | OCH ₂ -c-Pr | SEt | Cl | |
| 1-340 | OCH ₂ -c-Pr | SOEt | Cl | |
| 1-341 | OCH ₂ -c-Pr | SO ₂ Et | Cl | |

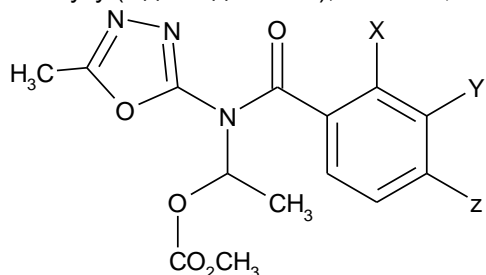
| № | X | Y | Z | Фізичні параметри (¹ H-ЯМР, 400 МГц; CDCl ₃): |
|-------|------------------------|---|--------------------|---|
| 1-342 | OCH ₂ -c-Pr | S(CH ₂) ₂ OMe | Cl | |
| 1-343 | OCH ₂ -c-Pr | SO(CH ₂) ₂ OMe | Cl | |
| 1-344 | OCH ₂ -c-Pr | SO ₂ (CH ₂) ₂ OMe | Cl | |
| 1-345 | OCH ₂ -c-Pr | SMe | SO ₂ Me | |
| 1-346 | OCH ₂ -c-Pr | SOMe | SO ₂ Me | |
| 1-347 | OCH ₂ -c-Pr | SO ₂ Me | SO ₂ Me | |
| 1-348 | OCH ₂ -c-Pr | SEt | SO ₂ Me | |
| 1-349 | OCH ₂ -c-Pr | SOEt | SO ₂ Me | |
| 1-350 | OCH ₂ -c-Pr | SO ₂ Et | SO ₂ Me | |
| 1-351 | OCH ₂ -c-Pr | S(CH ₂) ₂ OMe | SO ₂ Me | |
| 1-352 | OCH ₂ -c-Pr | SO(CH ₂) ₂ OMe | SO ₂ Me | |
| 1-353 | OCH ₂ -c-Pr | SO ₂ (CH ₂) ₂ OMe | SO ₂ Me | |
| 1-354 | SO ₂ Me | F | CF ₃ | |
| 1-355 | SO ₂ Me | NH ₂ | CF ₃ | |
| 1-356 | SO ₂ Me | NHEt | Cl | |
| 1-357 | SMe | SEt | F | |
| 1-358 | SMe | SMe | F | |
| 1-359 | SMe | SMe | CF ₃ | |
| 1-360 | SMe | SOMe | CF ₃ | |
| 1-361 | SMe | SO ₂ Me | CF ₃ | |
| 1-362 | SMe | SMe | Cl | |
| 1-363 | SMe | SMe | Br | |
| 1-364 | Cl | Ac | CF ₃ | |
| 1-365 | Cl | Ac | SO ₂ Me | |
| 1-366 | Cl | C(O)cPr | CF ₃ | |
| 1-367 | Cl | C(O)cPr | SO ₂ Me | |
| 1-368 | Cl | CH ₂ SMe | CF ₃ | |
| 1-369 | Cl | CH ₂ S(O)Me | CF ₃ | |

| № | X | Y | Z | Фізичні параметри (¹ H-ЯМР, 400 МГц; CDCl ₃): |
|-------|----|--------------------------------------|--------------------|--|
| 1-370 | Cl | CH ₂ SO ₂ Me | CF ₃ | |
| 1-371 | Cl | CH ₂ SMe | SO ₂ Me | |
| 1-372 | Cl | CH ₂ S(O)Me | SO ₂ Me | |
| 1-373 | Cl | CH ₂ SO ₂ Me | SO ₂ Me | |
| 1-374 | Cl | CH=NOMe | CF ₃ | |
| 1-375 | Cl | CH=NOMe | SO ₂ Me | |
| 1-376 | Cl | 4,5-дигідро-1,2-оксазол-5-іл | CF ₃ | |
| 1-377 | Cl | 4,5-дигідро-1,2-оксазол-5-іл | SO ₂ Me | |
| 1-378 | Cl | 3-метил-4,5-дигідро-1,2-оксазол-5-іл | CF ₃ | |
| 1-379 | Cl | 3-метил-4,5-дигідро-1,2-оксазол-5-іл | SO ₂ Me | |
| 1-380 | Cl | вініл | CF ₃ | |
| 1-381 | Cl | вініл | SO ₂ Me | |
| 1-382 | Cl | CO ₂ Me | CF ₃ | |
| 1-383 | Cl | CO ₂ Me | SO ₂ Me | |
| 1-384 | Cl | SMe | CF ₃ | |
| 1-385 | Cl | S(O)Me | CF ₃ | 7,70 млн.ч. (д, 1H); 7,63 млн.ч. (д, 1H), 7,12-6,91 (ш, 1H), 4,28 (кв, 2H); 3,07 і 3,05 (2с, 3H); 2,46 (с, 3H), 1,66 і 1,64 (2д, 3H), 1,34 (т, 3H) |
| 1-386 | Cl | SO ₂ Me | CF ₃ | |
| 1-387 | Cl | SO ₂ Me | SO ₂ Me | |
| 1-388 | Cl | SMe | Me | |
| 1-389 | Cl | SOMe | Me | |
| 1-390 | Cl | SO ₂ Me | Me | |
| 1-391 | Cl | 1H-1,2,4-триазол-1-іл | CF ₃ | |
| 1-392 | Cl | 1H-1,2,3-триазол-1-іл | CF ₃ | |
| 1-393 | Cl | 2H-1,2,3-триазол-2-іл | CF ₃ | |
| 1-394 | Cl | 1H-піразол-1-іл | CF ₃ | |
| 1-395 | Cl | 1H-4-хлорпіразол-1-іл | CF ₃ | |

| № | X | Y | Z | Фізичні параметри (¹ H-ЯМР, 400 МГц; CDCl ₃): |
|-------|---------------------|------------------------------------|-----------------|---|
| 1-396 | Cl | 1H-3-бром-піразол-1-іл | CF ₃ | |
| 1-397 | Cl | 1H-4-трифторметил-піразол-1-іл | CF ₃ | |
| 1-398 | Cl | піролідін-2-он-1-іл | CF ₃ | |
| 1-399 | Cl | морфолін-3-он-4-іл | CF ₃ | |
| 1-400 | Cl | 1,2-тіазолідін-1,1-діоксид-2-іл | CF ₃ | |
| 1-401 | Br | 1H-1,2,4-триазол-1-іл | CF ₃ | |
| 1-402 | Br | 1H-1,2,3-триазол-1-іл | CF ₃ | |
| 1-403 | Br | 2H-1,2,3-триазол-2-іл | CF ₃ | |
| 1-404 | Br | 1H-піразол-1-іл | CF ₃ | |
| 1-405 | Br | 1H-4-хлорпіразол-1-іл | CF ₃ | |
| 1-406 | Br | 1H-3-бром-піразол-1-іл | CF ₃ | |
| 1-407 | Br | 1H-4-трифторметил-піразол-1-іл | CF ₃ | |
| 1-408 | Br | піролідін-2-он-1-іл | CF ₃ | |
| 1-409 | Br | морфолін-3-он-4-іл | CF ₃ | |
| 1-410 | Br | 1,2-тіазолідін-1,1-діоксид-2-іл | CF ₃ | |
| 1-411 | CH ₂ OMe | 1H-1,2,4-триазол-1-іл | CF ₃ | |
| 1-412 | CH ₂ OMe | 1H-1,2,3-триазол-1-іл | CF ₃ | |
| 1-413 | CH ₂ OMe | 2H-1,2,3-триазол-2-іл | CF ₃ | |
| 1-414 | CF ₃ | OCH ₂ CH ₂ F | CF ₃ | |
| 1-415 | CF ₃ | OMe | CF ₃ | |
| 1-416 | CF ₃ | SMe | CF ₃ | |
| 1-417 | CF ₃ | SOMe | CF ₃ | |
| 1-418 | CF ₃ | SO ₂ Me | CF ₃ | |
| 1-419 | CF ₃ | 1H-піразол-1-іл | CF ₃ | |
| 1-420 | Me | SMe | Et | |
| 1-421 | Me | SOMe | Et | |
| 1-422 | Me | SO ₂ Me | Et | |
| 1-423 | Me | 1H-піразол-1-іл | Et | |

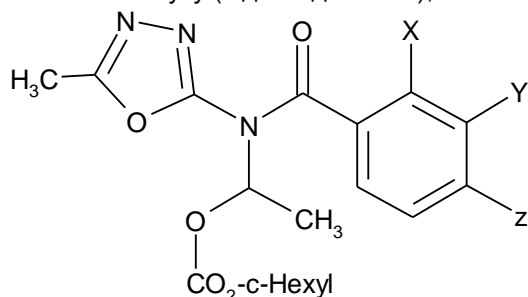
| № | X | Y | Z | Фізичні параметри (¹ H-ЯМР, 400 МГц; CDCl ₃): |
|-------|----|--------------------------------------|--------------------|---|
| 1-424 | Me | OCH ₂ CH ₂ F | Et | |
| 1-425 | Me | OMe | Et | |
| 1-426 | Me | Ac | CF ₃ | |
| 1-427 | Me | Ac | SO ₂ Me | |
| 1-428 | Me | C(O)cPr | CF ₃ | |
| 1-429 | Me | C(O)cPr | SO ₂ Me | |
| 1-430 | Me | CH ₂ SMe | CF ₃ | |
| 1-431 | Me | CH ₂ S(O)Me | CF ₃ | |
| 1-432 | Me | CH ₂ SO ₂ Me | CF ₃ | |
| 1-433 | Me | CH ₂ SMe | SO ₂ Me | |
| 1-434 | Me | CH ₂ S(O)Me | SO ₂ Me | |
| 1-435 | Me | CH ₂ SO ₂ Me | SO ₂ Me | |
| 1-436 | Me | CH=NOMe | CF ₃ | |
| 1-437 | Me | CH=NOMe | SO ₂ Me | |
| 1-438 | Me | 4,5-дигідро-1,2-оксазол-5-іл | CF ₃ | |
| 1-439 | Me | 4,5-дигідро-1,2-оксазол-5-іл | SO ₂ Me | |
| 1-440 | Me | 3-метил-4,5-дигідро-1,2-оксазол-5-іл | CF ₃ | |
| 1-441 | Me | 3-метил-4,5-дигідро-1,2-оксазол-5-іл | SO ₂ Me | |
| 1-442 | Me | вініл | CF ₃ | |
| 1-443 | Me | вініл | SO ₂ Me | |
| 1-444 | Me | CO ₂ Me | CF ₃ | |
| 1-445 | Me | CO ₂ Me | SO ₂ Me | |
| 1-446 | Cl | SMe | CF ₃ | |
| 1-447 | Cl | SOMe | CF ₃ | |
| 1-448 | Cl | SO ₂ Me | CF ₃ | |
| 1-449 | Et | SEt | CF ₃ | |
| 1-450 | Et | SOEt | CF ₃ | |
| 1-451 | Et | SO ₂ Et | CF ₃ | |

Таблиця 2: Відповідні винаходівні сполуки загальної формули (I), в якій A означає A1, R⁶ означає метил, R означає CH(Me)OCO₂Me, W означає CY і V означає водень. Таблиця 2 містить 451 сполуку (від 2-1 до 2-451), в яких X, Y і Z мають значення згідно з Таблицею 1.



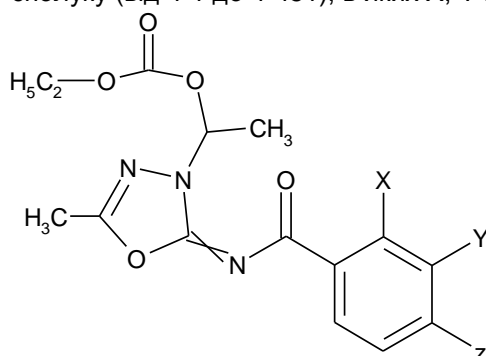
5

Таблиця 3: Відповідні винаходівні сполуки загальної формули (I), в якій A означає A1, R⁶ означає метил, R означає CH(Me)OCO₂-ц-гексил, W означає CY і V означає водень. Таблиця 3 містить 451 сполуку (від 3-1 до 3-451), в яких X, Y і Z мають значення згідно з Таблицею 1.



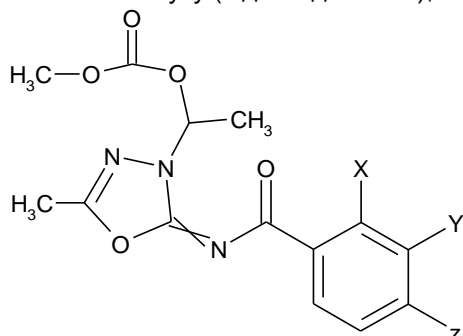
10

Таблиця 4: Відповідні винаходівні сполуки загальної формули (I), в якій A означає A2, R⁶ означає метил, R означає CH(Me)OCO₂Et, W означає CY і V означає водень. Таблиця 4 містить 451 сполуку (від 4-1 до 4-451), в яких X, Y і Z мають значення згідно з Таблицею 1.



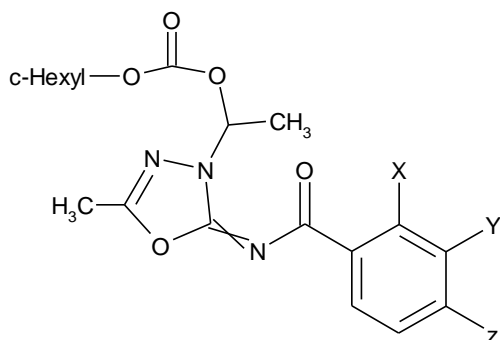
15

Таблиця 5: Відповідні винаходівні сполуки загальної формули (I), в якій A означає A2, R⁶ означає метил, R означає CH(Me)OCO₂Me, W означає CY та V означає водень. Таблиця 5 містить 451 сполуку (від 5-1 до 5-451), в яких X, Y і Z мають значення, наведені в Таблиці 1.

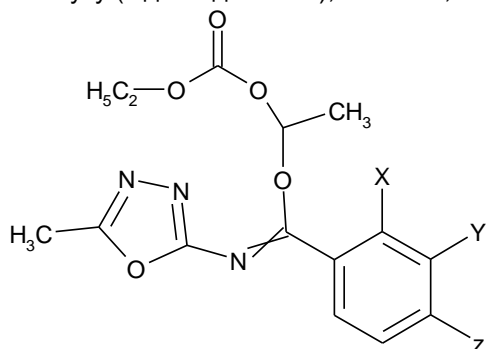


20

Таблиця 6: Відповідні винаходівні сполуки загальної формули (I), в якій A означає A2, R⁶ означає метил, R означає CH(Me)OCO₂-ц-гексил, W означає CY і V означає водень. Таблиця 6 містить 451 сполуку (від 6-1 до 6-451), в яких X, Y і Z мають значення, наведені в Таблиці 1.

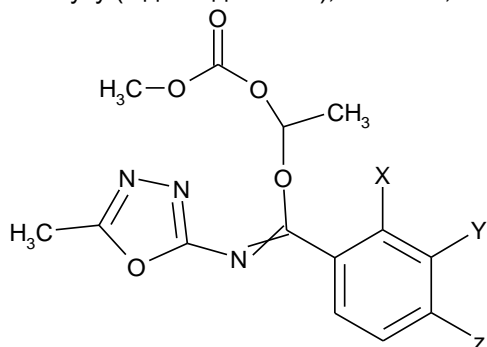


Таблиця 7: Відповідні винаходіві сполуки загальної формули (I), в якій А означає АЗ, R⁶ означає метил, R означає CH(Me)OCO₂Et, W означає CY і V означає водень. Таблиця 7 містить 451 сполуку (від 7-1 до 7-451), в яких X, Y і Z мають значення, наведені в Таблиці 1.



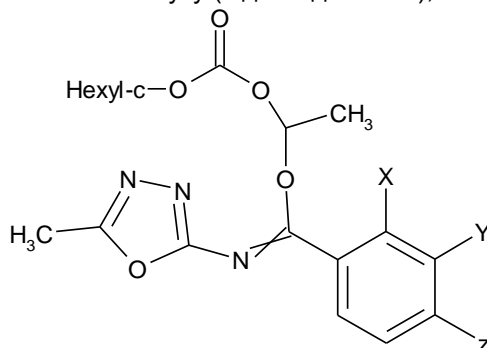
5

Таблиця 8: Відповідні винаходіві сполуки загальної формули (I), в якій А означає АЗ, R⁶ означає метил, R означає CH(Me)OCO₂Me, W означає CY і V означає водень. Таблиця 8 містить 451 сполуку (від 8-1 до 8-451), в яких X, Y і Z мають значення, наведені в Таблиці 1.



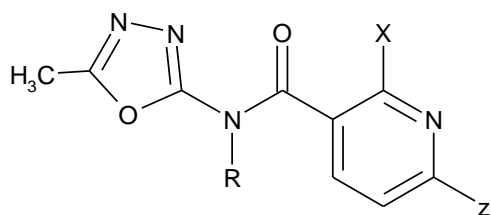
10

Таблиця 9: Відповідні винаходіві сполуки загальної формули (I), в якій А означає АЗ, R⁶ означає метил, R означає CH(Me)OCO₂-ц-гексил, W означає CY і V означає водень. Таблиця 9 містить 451 сполуку (від 9-1 до 9-451), в яких X, Y і Z мають значення, наведені в Таблиці 1.



15

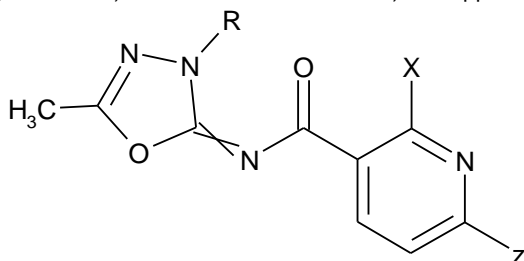
Таблиця 10: Відповідні винаходіві сполуки загальної формули (I), в якій А означає А1, W означає N, R⁶ означає метил і V означає водень, а R, X та Z мають значення, наведені в Таблиці 10.



| № | X | Z | R | Фізичні параметри (¹ H-ЯМР, ДМСО-d ₆ , 400 МГц) |
|-------|---------------------|-----------------|--|---|
| 10-1 | Cl | CF ₃ | CH(Me)OCO ₂ Et | |
| 10-2 | Cl | CF ₃ | CH(Me)OCO ₂ Me | |
| 10-3 | Cl | CF ₃ | CH(Me)OCO ₂ -ц-гексил | |
| 10-4 | Cl | CF ₃ | CH ₂ OCO ₂ Et | |
| 10-5 | Cl | CF ₃ | CH ₂ OCO ₂ Me | |
| 10-6 | Cl | CF ₃ | CH ₂ OCO ₂ -ц-гексил | |
| 10-7 | Br | CF ₃ | CH(Me)OCO ₂ Et | |
| 10-8 | Br | CF ₃ | CH(Me)OCO ₂ Me | |
| 10-9 | Br | CF ₃ | CH(Me)OCO ₂ -ц-гексил | |
| 10-10 | Br | CF ₃ | CH ₂ OCO ₂ Et | |
| 10-11 | Br | CF ₃ | CH ₂ OCO ₂ Me | |
| 10-12 | Br | CF ₃ | CH ₂ OCO ₂ -ц-гексил | |
| 10-13 | Me | CF ₃ | CH(Me)OCO ₂ Et | |
| 10-14 | Me | CF ₃ | CH(Me)OCO ₂ Me | |
| 10-15 | Me | CF ₃ | CH(Me)OCO ₂ -ц-гексил | |
| 10-16 | Me | CF ₃ | CH ₂ OCO ₂ Et | |
| 10-17 | Me | CF ₃ | CH ₂ OCO ₂ Me | |
| 10-18 | Me | CF ₃ | CH ₂ OCO ₂ -ц-гексил | |
| 10-19 | CH ₂ OMe | CF ₃ | CH(Me)OCO ₂ Et | |
| 10-20 | CH ₂ OMe | CF ₃ | CH(Me)OCO ₂ Me | |
| 10-21 | CH ₂ OMe | CF ₃ | CH(Me)OCO ₂ -ц-гексил | |
| 10-22 | CH ₂ OMe | CF ₃ | CH ₂ OCO ₂ Et | |
| 10-23 | CH ₂ OMe | CF ₃ | CH ₂ OCO ₂ Me | |
| 10-24 | CH ₂ OMe | CF ₃ | CH ₂ OCO ₂ -ц-гексил | |

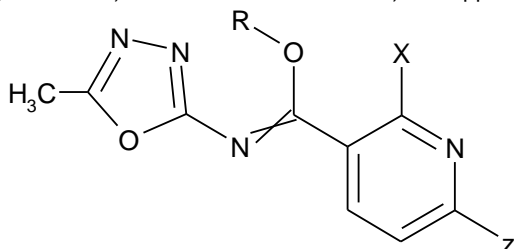
| № | X | Z | R | Фізичні параметри (¹ H-ЯМР, ДМСО-d ₆ , 400 МГц) |
|-------|--|-----------------|--|---|
| 10-25 | CH ₂ OCH ₂ CH ₂ OMe | CF ₃ | CH(Me)OCO ₂ Et | |
| 10-26 | CH ₂ OCH ₂ CH ₂ OMe | CF ₃ | CH(Me)OCO ₂ Me | |
| 10-27 | CH ₂ OCH ₂ CH ₂ OMe | CF ₃ | CH(Me)OCO ₂ -ц-гексил | |
| 10-28 | CH ₂ OCH ₂ CH ₂ OMe | CF ₃ | CH ₂ OCO ₂ Et | |
| 10-29 | CH ₂ OCH ₂ CH ₂ OMe | CF ₃ | CH ₂ OCO ₂ Me | |
| 10-30 | CH ₂ OCH ₂ CH ₂ OMe | CF ₃ | CH ₂ OCO ₂ -ц-гексил | |

Таблиця 11: Відповідні винаходові сполуки загальної формули (I), в якій А означає А2, W означає N, R⁶ означає метил і V означає водень. Таблиця 11 містить 30 сполук (від 11-1 до 11-30), в яких R, X і Z мають значення, наведені в Таблиці 10.



5

Таблиця 12: Відповідні винаходові сполуки загальної формули (I), в якій А означає А3, W означає N, R⁶ означає метил і V означає водень. Таблиця 12 містить 30 сполук (від 12-1 до 12-30), в яких R, X і Z мають значення, наведені в Таблиці 10.



10

Застосовані скорочення мають наведені далі значення:

| | | | | | | | | | | | |
|------|---|-------------|----|---|-------|------|---|----------|------|---|-----------|
| Et | = | етил | Me | = | метил | n-Pr | = | н-пропіл | i-Pr | = | ізопропіл |
| c-Pr | = | циклопропіл | Ph | = | феніл | Bn | = | бензил | Bu | = | бутил |
| c | = | цикло | | | | | | | | | |

В. Приклади композицій

а) Пилоподібний препарат (дуст) одержують шляхом змішування 10 мас. часток сполуки формули (I) і 90 мас. часток тальку як інертної речовини та перемелювання суміші в ударному млині.

б) Змочуваний порошок, який легко диспергується у воді, одержують шляхом змішування 25 масових часток сполуки формули (I), 64 мас. часток кварцу з домішкою каоліну як інертної речовини, 10 масових часток лігнінсульфонату калію і однієї мас. частки олеоїлметилтауринату натрію як змочувального засобу та диспергатора і перемелювання суміші в штифтовому млині.

с) Концентрат дисперсії, який може легко диспергувати у воді, одержують шляхом змішування 20 мас. часток сполуки формули (I), 6 мас. часток алкілфенолполігліколевого етеру (®Triton X 207), 3 мас. часток ізотридеканол-полігліколевого етеру (8 EO) та 71 мас. часток парафінової мінеральної олії (температурний інтервал кипіння, наприклад, від близько 255 до понад 277 °C) і перемелювання суміші в кульовому млині до дисперсності менше 5 мікронів.

d) Здатний до емульгування концентрат одержують із 15 мас. часток сполуки формули (I), 75 мас. часток циклогексанону як розчинника та 10 мас. часток оксіетильованого нонілфенолу як емульгатора.

5 е) Здатний до диспергування у воді гранулят одержують шляхом змішування

75 мас. часток сполуки формули (I),

10 мас. часток лігнінсульфонату кальцію,

5 мас. часток лаурилсульфату натрію,

3 мас. часток полівінілового спирту та

7 мас. часток каоліну,

10 перемелювання в штифтовому млині та гранулювання одержаного порошку у псевдозрідженому шарі шляхом обприскування водою як гранулюючою рідиною.

f) Здатний до диспергування у воді гранулят одержують також шляхом гомогенізації та попереднього подрібнення на колоїдному млині

25 мас. часток сполуки загальної формули (I),

15 5 мас. часток 2,2'-динафтилметан-6,6'-дисульфону натрію,

2 мас. часток олеїлметилтауринату натрію,

1 мас. частки полівінілового спирту,

17 мас. часток карбонату кальцію та

50 мас. часток води,

20 наступного перемелювання суміші в кульовому млині та насамкінець розпилювання і висушування одержаної в такий спосіб суспензії в башті для сушіння розпилюванням із застосуванням насадки для розпилювання однієї речовини.

С. Біологічні приклади

1. Гербіцидна дія проти бур'янових рослин в процесі передсходової обробки

25 Насіння одно- та дводольних бур'янових і культурних рослин викладали в горщики з деревноволокнистого матеріалу в шар піщаного суглинку та вкривали шаром ґрунту. З композицій відповідних винаходів сполук у формі змочуваних порошоків (WP) або концентратів емульсій (EC) виготовляли водну суспензію чи емульсію із застосуванням необхідної нормованої кількості води в перерахунку від 600 до 800 л/га із додаванням 0,2 % змочувального засобу, які наносили на поверхню покривного шару ґрунту. Після обробки горщики встановлювали в теплицю та витримували в умовах, сприятливих для росту досліджуваних рослин. Візуальну оцінку пошкоджень дослідних рослин здійснювали через 3 тижні порівняно з необробленими контрольними рослинами (ефективність гербіцидної дії у відсотках (%): ефективність 100 % відповідала загибелі рослин, ефективність 0 % означала, що стан оброблених рослин не відрізнявся від стану контрольних рослин). При цьому, наприклад, сполуки № 1-145, 1-385, 3-385, 4-145, 4-385, 6-385, 7-145, 7-385 та 9-385 при нормі витрати 320 г/г в кожному випадку проявили щонайменше 80 %-ну ефективність проти *Stellaria media* і *Veronica persica*.

2. Гербіцидна дія проти бур'янових рослин в процесі післясходової обробки

40 Насіння одно- та дводольних бур'янових і культурних рослин викладали у горщики з деревноволокнистого матеріалу в шар піщаного суглинку, вкривали шаром ґрунту та витримували в теплиці в сприятливих для росту умовах. Через 2-3 тижні після посіву досліджувані рослини обробляли на стадії одного листа. З композицій відповідних винаходів сполук у формі змочуваних порошоків (WP) або концентратів емульсій (EC) виготовляли водну суспензію чи емульсію із застосуванням необхідної нормованої кількості води в перерахунку від 600 до 800 л/га із додаванням 0,2 % змочувального засобу, якою обприскували зелені частини рослин. Приблизно через 3 тижні витримування досліджуваних рослин у теплиці в оптимальних для росту умовах візуально оцінювали ефективність дії препаратів порівняно з необробленими контрольними рослинами (ефективність гербіцидної дії у відсотках (%): ефективність 100 % відповідала загибелі рослин, ефективність 0 % означала, що стан оброблених рослин не відрізнявся від стану контрольних рослин).

При цьому, наприклад, сполуки № 1-145, 1-385, 3-385, 4-145, 4-385, 6-385, 7-145, 7-385 та 9-385 при нормі витрати 80 г/га в кожному випадку проявили, щонайменше, 80 %-ну ефективність проти *Stellaria media* та *Amaranthus retroflexus*.

55 3. Порівняльне дослідження проти бур'янових рослин в процесі передсходової обробки

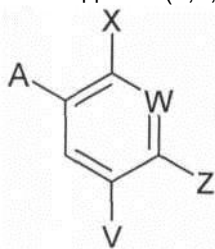
Для порівняння перевіряли гербіцидну дію деяких відповідних винаходів та найбільш аналогічних їм за структурою та відомих з рівня техніки сполук.

| Сполука | Дозування [г/га] | Гербіцидна дія проти ALOMY |
|---|------------------|----------------------------|
| № 7-385, відповідна винаходів № 2-360, із WO 2012/126932 | 80 80 | 90 % 70 % |
| № 3-385, відповідна винаходів № 2-360, із WO 2012/126932 | 80 80 | 100 % 70 % |
| № 9-385, відповідна винаходів № 2-360, із WO 2012/126932 | 80 80 | 90 % 70 % |
| № 1-145, відповідна винаходів № D-001, із WO 2013/087577 | 80 80 | 100 % 0 % |

Результати досліджень на прикладі бур'янової рослини *Alopecurus myosuroides* (ALOMY) свідчать про переважну гербіцидну дію відповідних винаходів сполук.

ФОРМУЛА ВИНАХОДУ

1. Похідна N-(1,3,4-оксадіазол-2-іл)арилкарбоксаміду формули (I):



, (I)

в якій символи та індекси мають наведені далі значення:

W означає N або CY,

X і Z означають незалежно один від одного в кожному випадку водень, нітро, галоген, ціано, форміл, родано, (C₁-C₆)-алкіл, (C₁-C₆)-галогеналкіл, (C₂-C₆)-алкеніл, (C₂-C₆)-галогеналкеніл, (C₂-C₆)-алкініл, (C₃-C₆)-галогеналкініл, (C₃-C₆)-циклоалкіл, (C₃-C₆)-галогенциклоалкіл, (C₃-C₆)-циклоалкіл-(C₁-C₆)-алкіл, (C₃-C₆)-галогенциклоалкіл-(C₁-C₆)-алкіл, COR¹, OR¹, OCOR¹, OSO₂R², S(O)_nR², SO₂OR¹, SO₂N(R¹)₂, NR¹SO₂R², NR¹COR¹, (C₁-C₆)-алкіл-S(O)_nR², (C₁-C₆)-алкіл-OR¹, (C₁-C₆)-алкіл-OCOR¹, (C₁-C₆)-алкіл-OSO₂R², (C₁-C₆)-алкіл-CO₂R¹, (C₁-C₆)-алкіл-SO₂OR¹, (C₁-C₆)-алкіл-CON(R¹)₂, (C₁-C₆)-алкіл-SO₂N(R¹)₂, (C₁-C₆)-алкіл-NR¹COR¹, (C₁-C₆)-алкіл-NR¹SO₂R², NR¹R², P(O)(OR⁵)₂, або

гетероарил, гетероцикліл або феніл, в кожному випадку заміщений s залишками, вибраними з групи, що включає метил, етил, метокси, нітро, трифторметил і галоген,

Y означає водень, нітро, галоген, ціано, родано, (C₁-C₆)-алкіл, галоген-(C₁-C₆)-алкіл, (C₂-C₆)-алкеніл, галоген-(C₂-C₆)-алкеніл, (C₂-C₆)-алкініл, галоген-(C₂-C₆)-алкініл, (C₃-C₆)-циклоалкіл, (C₃-C₆)-циклоалкеніл, галоген-(C₃-C₆)-циклоалкіл, (C₃-C₆)-циклоалкіл-(C₁-C₆)-алкіл, галоген-(C₃-C₆)-циклоалкіл-(C₁-C₆)-алкіл, COR¹, CO₂R¹, OCO₂R¹, NR¹CO₂R¹, C(O)N(R¹)₂, NR¹C(O)N(R¹)₂, C(O)N(R¹)₂, C(O)N(R¹)OR¹, NR¹SO₂R², NR¹COR¹, OR¹, OSO₂R², S(O)_nR², SO₂OR¹, SO₂N(R¹)₂, (C₁-C₆)-алкіл-S(O)_nR², (C₁-C₆)-алкіл-OR¹, (C₁-C₆)-алкіл-OCOR¹, (C₁-C₆)-алкіл-OSO₂R², (C₁-C₆)-алкіл-CO₂R¹, (C₁-C₆)-алкіл-CN, (C₁-C₆)-алкіл-SO₂OR¹, (C₁-C₆)-алкіл-CON(R¹)₂, (C₁-C₆)-алкіл-SO₂N(R¹)₂, (C₁-C₆)-алкіл-NR¹COR¹, (C₁-C₆)-алкіл-NR¹SO₂R², N(R¹)₂, P(O)(OR⁵)₂, CH₂P(O)(OR⁵)₂, CH=NOR¹, (C₁-C₆)-алкіл-CH=NOR¹, (C₁-C₆)-алкіл-O-N=C(R¹)₂, (C₁-C₆)-алкілфеніл, (C₁-C₆)-алкілгетероарил, (C₁-C₆)-алкілгетероцикліл, феніл, гетероарил або гетероцикліл, причому b вказаних останніми залишків в кожному випадку заміщені s залишками, вибраними з групи, що включає галоген, нітро, ціано, (C₁-C₆)-алкіл, галоген-(C₁-C₆)-алкіл, (C₃-C₆)-циклоалкіл, S(O)_n-(C₁-C₆)-алкіл, (C₁-C₆)-алкокси, галоген-(C₁-C₆)-алкокси, (C₁-C₆)-алкокси-(C₁-C₄)-алкіл і ціанометил, і причому гетероцикліл містить n оксогруп, або

Y і Z разом із обома атомами, до яких вони приєднані, утворюють 5-, 6- або 7-членне, ненасичене, частково насичене або насичене кільце, яке поряд із атомами вуглецю в кожному випадку містить s атомів азоту, n атомів кисню, n атомів сірки і n елементів S(O), S(O)₂, C=N-R⁸, C(OR⁹)₂, C[-O-(CH₂)₂-O-] або C(O) як члени кільця, атоми вуглецю якого в кожному випадку заміщені s залишками, вибраними з групи, що включає галоген, ціано, (C₁-C₆)-алкіл, (C₂-C₁₀)-алкеніл, (C₂-C₁₀)-алкініл, (C₁-C₆)-галоалкіл, (C₁-C₆)-алкокси, фенокси, галоген-(C₁-C₆)-алкокси, (C₃-C₈)-циклоалкіл, (C₂-C₈)-алкоксиалкіл і феніл,

атоми азоту якого в кожному випадку заміщені п залишками, вибраними з групи, що включає (C₁-C₆)-алкіл і феніл,

і в якій вищевказані фенільні залишки в кожному випадку заміщені s залишками, вибраними з групи, що включає ціано, нітро, галоген, (C₁-C₆)-алкіл, (C₁-C₆)-галоалкіл і (C₁-C₆)-алкокси,

5 V означає водень, нітро, галоген, ціано, (C₁-C₄)-алкіл, (C₁-C₄)-галогеналкіл, OR¹ або S(O)_nR², R¹ означає водень, (C₁-C₆)-алкіл, (C₁-C₆)-галогеналкіл, (C₂-C₆)-алкеніл, (C₂-C₆)-галогеналкеніл, (C₂-C₆)-алкініл, (C₂-C₆)-галогеналкініл, (C₃-C₆)-циклоалкіл, (C₃-C₆)-циклоалкеніл, (C₃-C₆)-галогенциклоалкіл, (C₁-C₆)-алкіл-О-(C₁-C₆)-алкіл, (C₃-C₆)-циклоалкіл-(C₁-C₆)-алкіл, феніл, феніл-
10 (C₁-C₆)-алкіл, гетероарил, (C₁-C₆)-алкілгетероарил, гетероцикліл, (C₁-C₆)-алкілгетероцикліл, (C₁-C₆)-алкіл-О-гетероарил, (C₁-C₆)-алкіл-О-гетероцикліл, (C₁-C₆)-алкіл-NR³-гетероарил, (C₁-C₆)-алкіл-NR³-гетероцикліл, причому 21 вказаний останнім залишок заміщений s залишками, вибраними з групи, що включає ціано, галоген, нітро, родано, OR³, S(O)_nR⁴, N(R³)₂, NR³OR³, COR³, OCOR³, SCOR⁴, NR³COR³, NR³SO₂R⁴, CO₂R³, COSR⁴, CON(R³)₂ і (C₁-C₄)-алкокси-(C₂-C₆)-алкоксикарбоніл, і причому гетероцикліл містить n оксогруп,

15 R² означає (C₁-C₆)-алкіл, (C₁-C₆)-галогеналкіл, (C₂-C₆)-алкеніл, (C₂-C₆)-галогеналкеніл, (C₂-C₆)-алкініл, (C₂-C₆)-галогеналкініл, (C₃-C₆)-циклоалкіл, (C₃-C₆)-циклоалкеніл, (C₃-C₆)-галогенциклоалкіл, (C₁-C₆)-алкіл-О-(C₁-C₆)-алкіл, (C₃-C₆)-циклоалкіл-(C₁-C₆)-алкіл, феніл, феніл-
20 (C₁-C₆)-алкіл, гетероарил, (C₁-C₆)-алкілгетероарил, гетероцикліл, (C₁-C₆)-алкілгетероцикліл, (C₁-C₆)-алкіл-О-гетероарил, (C₁-C₆)-алкіл-О-гетероцикліл, (C₁-C₆)-алкіл-NR³-гетероарил, (C₁-C₆)-алкіл-NR³-гетероцикліл, причому 21 вказаний останнім залишок заміщений s залишками, вибраними з групи, що включає ціано, галоген, нітро, родано, OR³, S(O)_nR⁴, N(R³)₂, NR³OR³, COR³, OCOR³, SCOR⁴, NR³COR³, NR³SO₂R⁴, CO₂R³, COSR⁴, CON(R³)₂ і (C₁-C₄)-алкокси-(C₂-C₆)-алкоксикарбоніл, і причому гетероцикліл містить n оксогруп,

25 R³ означає водень, (C₁-C₆)-алкіл, (C₂-C₆)-алкеніл, (C₂-C₆)-алкініл, (C₃-C₆)-циклоалкіл або (C₃-C₆)-циклоалкіл-(C₁-C₆)-алкіл,

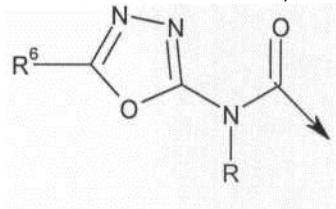
R⁴ означає (C₁-C₆)-алкіл, (C₂-C₆)-алкеніл або (C₂-C₆)-алкініл, (C₃-C₆)-циклоалкіл або (C₃-C₆)-циклоалкіл-(C₁-C₆)-алкіл,

R⁵ означає (C₁-C₄)-алкіл,

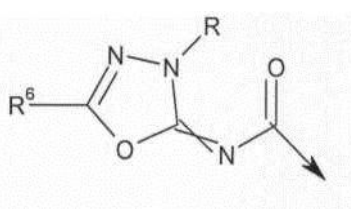
n означає 0, 1 або 2,

30 s означає 0, 1, 2 або 3,

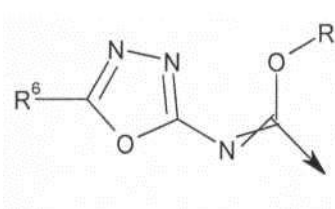
A означає залишок A1, A2 або A3:



, A1



, A2



, A3

R означає (C₁-C₆)-алкіл-OC(O)N(R³)₂ або (C₁-C₆)-алкіл-OC(O)OR¹⁰,

35 R⁶ означає водень, (C₁-C₆)-алкіл, R¹O-(C₁-C₆)-алкіл, CH₂R⁷, (C₃-C₇)-циклоалкіл, галоген-(C₁-C₆)-алкіл, (C₂-C₆)-алкеніл, галоген-(C₂-C₆)-алкеніл, (C₂-C₆)-алкініл, галоген-(C₂-C₆)-алкініл, OR¹, NHR¹, метоксикарбоніл, етоксикарбоніл, метоксикарбонілметил, етоксикарбонілметил, метилкарбоніл, трифторметилкарбоніл, диметиламіно, ацетиламіно, метилсульфеніл, метилсульфініл, метилсульфоніл або

40 гетероарил, гетероцикліл, бензил або феніл, у кожному випадку, заміщений s залишками, вибраними з групи, що включає галоген, нітро, ціано, (C₁-C₆)-алкіл, галоген-(C₁-C₆)-алкіл, (C₃-C₆)-циклоалкіл, S(O)_n-(C₁-C₆)-алкіл, (C₁-C₆)-алкокси, галоген-(C₁-C₆)-алкокси, (C₁-C₆)-алкокси-(C₁-C₄)-алкіл,

45 R⁷ означає ацетокси, ацетамідо, N-метилацетамідо, бензоїлокси, бензамідо, N-метилбензамідо, метоксикарбоніл, етоксикарбоніл, бензоїл, метилкарбоніл, піперидинілкарбоніл, морфолінілкарбоніл, трифторметилкарбоніл, амінокарбоніл, метиламінокарбоніл, диметиламінокарбоніл, (C₁-C₆)-алкокси, (C₃-C₆)-циклоалкіл або

50 гетероарил, гетероцикліл або феніл, у кожному випадку заміщений s залишками, вибраними з групи, що включає метил, етил, метокси, трифторметил і галоген,

R⁸ означає (C₁-C₆)-алкіл, галоген-(C₁-C₆)-алкіл, (C₁-C₆)-алкокси або галоген-(C₁-C₆)-алкокси,

R⁹ означає (C₁-C₆)-алкіл або галоген-(C₁-C₆)-алкіл,

R¹⁰ означає (C₁-C₆)-алкіл, галоген-(C₁-C₆)-алкіл або (C₁-C₆)-циклоалкіл.

2. Похідна N-(1,3,4-оксадіазол-2-іл)арилкарбоксаміду формули (I) за пунктом 1, в якій:

R^6 означає водень, (C_1-C_6) -алкіл, $R^1O-(C_1-C_6)$ -алкіл, галоген- (C_1-C_6) -алкіл, (C_2-C_6) -алкеніл.

3. Похідна N-(1,3,4-оксадіазол-2-іл)арилкарбоксаміду формули (I) за пунктом 1 або 2, в якій:

W означає CY,

5 X і Z означають незалежно один від одного в кожному випадку водень, галоген, (C_1-C_6) -алкіл, (C_1-C_6) -галогеналкіл, (C_2-C_6) -алкеніл, (C_3-C_6) -циклоалкіл, (C_3-C_6) -галогенциклоалкіл, OR^1 , $S(O)_nR^2$, $SO_2N(R^1)_2$, $NR^1SO_2R^2$, NR^1COR^1 , (C_1-C_6) -алкіл- $S(O)_nR^2$, (C_1-C_6) -алкіл- OR^1 , або гетероарил, гетероцикліл або фенол, у кожному випадку заміщений з залишками, вибраними з групи, що включає метил, етил, метокси, нітро, трифторметил і галоген,

10 Y означає водень, (C_2-C_6) -алкеніл, COR^1 , CO_2R^1 , OCO_2R^1 , $NR^1CO_2R^1$, $C(O)N(R^1)_2$, $NR^1C(O)N(R^1)_2$, $OC(O)N(R^1)_2$, $C(O)N(R^1)OR^1$, $NR^1SO_2R^2$, NR^1COR^1 , OR^1 , $S(O)_nR^2$, $SO_2N(R^1)_2$, (C_1-C_6) -алкіл- $S(O)_nR^2$, (C_1-C_6) -алкіл- OR^1 , (C_1-C_6) -алкіл- $OCOR^1$, (C_1-C_6) -алкіл- CO_2R^1 , (C_1-C_6) -алкіл- $CON(R^1)_2$, (C_1-C_6) -алкіл- $SO_2N(R^1)_2$, (C_1-C_6) -алкіл- NR^1COR^1 , (C_1-C_6) -алкіл- $NR^1SO_2R^2$, $N(R^1)_2$, $CH=NOR^1$, (C_1-C_6) -алкіл- $CH=NOR^1$, (C_1-C_6) -алкілгетероарил, (C_1-C_6) -алкілгетероцикліл, гетероарил або гетероцикліл, причому 4 вказаних останніми залишки в кожному випадку заміщені з залишками, вибраними з групи, що включає галоген, нітро, ціано, (C_1-C_6) -алкіл, галоген- (C_1-C_6) -алкіл, (C_3-C_6) -циклоалкіл, $S(O)_n-(C_1-C_6)$ -алкіл, (C_1-C_6) -алкокси, галоген- (C_1-C_6) -алкокси, (C_1-C_6) -алкокси- (C_1-C_4) -алкіл і ціанометил, і причому гетероцикліл містить n оксогруп,

V означає водень, Cl, OMe, метил або етил,

R^6 означає метил, етил, метоксиметил або метоксіетил.

20 4. Похідна N-(1,3,4-оксадіазол-2-іл)арилкарбоксаміду формули (I) за будь-яким із пунктів 1-3, в якій:

X означає F, Cl, Br, метил, етил, циклопропіл, трифторметил, метокси, метоксиметил, метоксіетоксиметил, SMe або SO_2Me ,

25 Z означає водень, F, Cl, Br, I, метил, етил, трифторметил, дифторметил, пентафторетил, метилсульфоніл або етилсульфоніл,

Y означає водень, SMe, $S(O)Me$, SO_2Me , SEt, $S(O)Et$, SO_2Et , CH_2OMe , CH_2OEt , $CH_2OCH_2CF_3$, CH_2SMe , $CH_2S(O)Me$, CH_2SO_2Me , вініл, $C(O)Me$, $C(O)Et$, $C(O)cPr$, CO_2Me , $CHN=OMe$, 4,5-дигідро-1,2-оксазол-3-іл, 5-метил-4,5-дигідро-1,2-оксазол-3-іл, 5-метил-4,5-дигідро-1,2-оксазол-3-іл, 5-ціанометил-4,5-дигідро-1,2-оксазол-3-іл, 4,5-дигідро-1,2-оксазол-5-іл, 3-метил-4,5-дигідро-1,2-оксазол-5-іл, 1H-піразол-1-іл, 1H-1,2,3-триазол-1-іл, 2H-1,2,3-триазол-2-іл, 1H-1,2,4-триазол-1-іл, піролідін-2-он-1-іл, морфолін-3-он-4-іл, OMe, OEt, OnPr, OCH_2cPr , OCH_2CH_2F , OCH_2CH_2OMe або $OCH_2CH_2CH_2OMe$,

30 V означає водень,
R означає CH_2OCO_2Et , $CH(CH_3)OCO_2Me$, $CH(CH_3)OCO_2Et$, $CH(CH_3)OCO_2$ -с-гексил, $CH(CH_3)OCO_2$ -i-Pr або $CH(CH_3)OCO_2$ -t-Bu,
35 R^6 означає метил.

5. Гербіцидний засіб, що містить гербіцидно активну кількість принаймні однієї похідної N-(1,3,4-оксадіазол-2-іл)арилкарбоксаміду формули (I) за будь-яким із пунктів 1-4.

6. Гербіцидний засіб за пунктом 5 у суміші з допоміжними засобами для композицій.

40 7. Гербіцидний засіб за пунктом 5 або 6, що додатково містить принаймні одну пестицидно активну речовину, вибрану з групи, що включає інсектициди, акарициди, гербіциди, фунгіциди, антидоти і регулятори росту рослин.

8. Гербіцидний засіб за пунктом 7, що містить антидот.

45 9. Гербіцидний засіб за пунктом 5, що містить ципросульфамід, клоквінтоцет-мексил, мефенпір-діетил або ізоксадифен-етил.

10. Гербіцидний засіб за будь-яким із пунктів 7-9, що додатково містить гербіцид.