

(19)



Евразийское
патентное
ведомство

(21) 202293506 (13) A1

(12) ОПИСАНИЕ ИЗОБРЕТЕНИЯ К ЕВРАЗИЙСКОЙ ЗАЯВКЕ

(43) Дата публикации заявки
2023.04.07

(51) Int. Cl. C07D 413/04 (2006.01)
A01N 43/88 (2006.01)
A01N 43/58 (2006.01)

(22) Дата подачи заявки
2021.06.16

(54) ПРОИЗВОДНЫЕ 3-(ПИРИДАЗИН-4-ИЛ)-5,6-ДИГИДРО-4Н-1,2,4-ОКСАДИАЗИНА В
КАЧЕСТВЕ ФУНГИЦИДОВ ДЛЯ ЗАЩИТЫ РАСТЕНИЙ

(31) 20180713.8

(32) 2020.06.18

(33) EP

(86) PCT/EP2021/066190

(87) WO 2021/255071 2021.12.23

(71) Заявитель:
БАЙЕР АКЦИЕНГЕЗЕЛЬШАФТ
(DE)

(72) Изобретатель:
Гайст Жюли, Монтань Сирил, Николя
Лионель, Тсучия Томоки, Тома
Винсент (FR), Лок Доминик (CH)

(74) Представитель:
Беляева Е.Н. (BY)

(57) Изобретение касается соединений оксадиазинилпиридазина и их применения для борьбы с фитопатогенными микроорганизмами, такими как фитопатогенные грибы. Изобретение также касается способов и промежуточных веществ для приготовления указанных соединений.

A1

202293506

202293506

A1

Производные 3-(пиридазин-4-ил)-5,6-дигидро-4Н-1,2,4-оксадиазина в качестве фунгицидов для защиты растений

Настоящее изобретение касается соединений оксадиазинилпиридазина и их применения для борьбы с фитопатогенными микроорганизмами, такими как фитопатогенные грибы. Изобретение также касается способов и промежуточных веществ для приготовления указанных соединений.

К настоящему времени разработаны различные средства защиты растений для борьбы с вредными микроорганизмами или для предотвращения заражения такими микроорганизмами растений. Тем не менее, по-прежнему существует потребность в разработке новых соединений, которые обладали бы активностью в отношении широкого спектра фитопатогенных микроорганизмов, таких как грибы, низкой токсичностью, высокой селективностью, улучшенными физико-химическими характеристиками или которые можно было использовать низкой дозе внесения для эффективной борьбы с вредителями. Также может быть желательно получить новые соединения для предотвращения возникновения устойчивости у микроорганизмов.

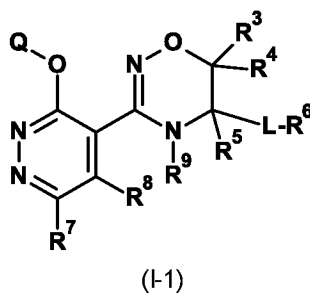
Настоящее изобретение предоставляет новые соединения для борьбы с фитопатогенными микроорганизмами, такими как грибы, которые имеют преимущества по сравнению с известными соединениями и композициями, по меньшей мере, в одном из указанных аспектов.

WO 2007/031213 описывает диоксазин- и оксадиазин-замещенные ариламины для борьбы с сельскохозяйственными вредителями. В WO 2008/009406 раскрыты гетероарил-замещенные пиридазины в качестве фунгицидов. Гетероцикл-замещенные пиридазины в качестве фунгицидов раскрыты в WO 2020/127780.

ПОДРОБНОЕ ОПИСАНИЕ

Соединения формулы (I)

Настоящее изобретение касается соединений формулы (I-1):



в которой

R^3 и R^4 означают водород,

R^5 означает водород,

L означает метилен,

R^6 означает фенил,

причем фенил замещен 2 заместителями, независимо выбранными из хлора, брома и метила,

R^7 означает хлор, метил, этил или этенил,

причем метил, этил и этенил, при необходимости, замещены одним или двумя заместителями, независимо выбранными из группы, состоящей из фтора, хлора, гидроксид, метокси и этокси,

R^8 означает водород,

R^9 означает водород или формил,

Q означает фенил,

причем фенил замещен одним или двумя заместителями, независимо выбранными из фтора, хлора, метила, этила и циклопропила,

причем циклопропил, при необходимости, замещен одним или двумя заместителями, независимо выбранными из группы, состоящей из фтора и хлора,

а также их N-оксидов, солей, гидратов и гидратов солей и N-оксидов.

Настоящее изобретение касается соединений, содержащих, по меньшей мере, одно соединение формулы (I), как определено в настоящем документе, и, по

меньшей мере, одно пригодное в области сельского хозяйства вспомогательное средство.

Настоящее изобретение также касается применения соединения формулы (I), как определено в настоящем документе, или композиции, как определено в настоящем документе, для борьбы с фитопатогенными грибами.

Настоящее изобретение касается способы борьбы с фитопатогенными грибами, который включает этап нанесения, по меньшей мере, одного соединения формулы (I), как определено в настоящем документе, или композиции, как определено в настоящем документе, на растения, части растений, семена, плоды или почву, на которой произрастают растения.

Настоящее изобретение также касается способов и промежуточных веществ для приготовления соединений формулы (I).

Если не обусловлено иное, для заместителей и радикалов применяются следующие определения:

Термин “галоген” в контексте настоящего документа касается атомов фтора, хлора, брома или йода.

Термин “C₁-C₆-алкокси” в контексте настоящего документа касается группы формулы (C₁-C₆-алкил)-O-, в которой термин “C₁-C₆-алкил” имеет значение, как определено в настоящем документе. Примеры C₁-C₆-алкокси включают, но не ограничиваются ими, метокси, этокси, н-пропокси, 1-метилэтокси, н-бутокси, 1-метилпропокси, 2-метилпропокси, 1,1-диметилэтокси, н-пентокси, 1-метилбутокси, 2-метилбутокси, 3-метилбутокси, 2,2-диметилпропокси, 1-этилпропокси, 1,1-диметилпропокси, 1,2-диметилпропокси, н-гексилокси, 1-метилпентокси, 2-метилпентокси, 3-метилпентокси, 4-метилпентокси, 1,1-диметилбутокси, 1,2-диметилбутокси, 1,3-диметилбутокси, 2,2-диметилбутокси, 2,3-диметилбутокси, 3,3-диметилбутокси, 1-этилбутокси, 2-этилбутокси, 1,1,2-триметилпропокси, 1,2,2-триметилпропокси, 1-этил-1-метилпропокси и 1-этил-2-метилпропокси. Данное определение также применимо к алкокси как части составного замечтителя, например, алкоксиалкилу, алкоксиалкокси, если не дано иное определение.

Термин «замещаемая группа» в контексте настоящего документа следует понимать как группу, которая замещена из соединения в результате реакции

замещения или отщепления, например, атом галогена, трифторметансульфонатная («трифлатная») группа, алкокси, метансульфонат, р-толуолсульфонат и др.

Термины «в соответствии с описанием», применительно к переменным R^3 , R^4 , R^5 , R^6 , R^7 , R^8 и Q, посредством отсылки включают широкое определение переменной, а также предпочтительные, более предпочтительные и еще более предпочтительные определения, если таковые имеются.

В объем изобретения не включены соединения, полученные в результате комбинаций, которые противоречат законам природы и которые являются недопустимыми по мнению специалиста в данной области. Например, в объем изобретения не включены кольцевые структуры с тремя или более расположенными рядом атомами кислорода.

Соединения формулы (I) могут использоваться в свободной форме, в форме соли, в форме N-оксидов или сольвата (например, гидрата).

В зависимости от свойств заместителей, соединение формулы (I) может присутствовать в виде различных стереоизомеров. Такими стереоизомерами могут быть, например, энантиомеры, диастереомеры, атропоизомеры или геометрические изомеры. Соответственно изобретение относится как к чистым изомерам, так и к любым смесям данных изомеров. В тех случаях, когда соединение может присутствовать в двух или более таутомерных формах в равновесии, в случае, если по тексту упоминается одна таутомерная форма соединения, то такое упоминание включает все таутомерные формы.

Любое из соединений по настоящему изобретению может присутствовать в виде одной или нескольких форм геометрических изомеров, в зависимости от количества двойных связей в соединении. Геометрические изомеры по характеру заместителей относительно двойной связи или кольца могут присутствовать в *цис*- (= Z-) или *транс*- (= E-) форме. Таким образом, изобретение равным образом относится ко всем геометрическим изомерам и ко всем возможным смесям, во всех пропорциях.

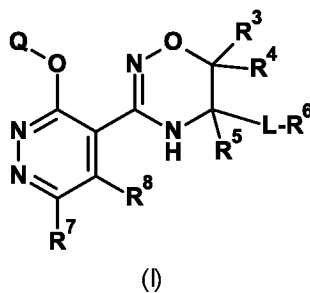
В зависимости от свойств заместителей, соединение формулы (I) может присутствовать в виде свободного соединения и/или в виде его соли, например, в виде агрономически приемлемой соли.

Агрохимически активные соли включают кислотнo-аддитивные соли неорганических и органических кислот, а также соли обычных оснований. Примерами неорганических кислот являются галогенводородные кислоты, такие как фторводород, хлороводород, бромоводород и иодоводород, серная кислота, ортофосфорная кислота и азотная кислота, а также соли кислот, такие как бисульфат натрия и бисульфат калия. Применимые органические кислоты включают, например, муравьиную кислоту, карбоновую кислоту и алкановые кислоты, такие как уксусная кислота, трифторуксусная кислота, трихлоруксусная кислота и пропионовая кислота, а также гликолевая кислота, тиоциановая кислота, молочная кислота, янтарная кислота, лимонная кислота, бензойная кислота, коричная кислота, щавелевая кислота, насыщенные или моно- или диненасыщенные жирные кислоты с 6 - 20 атомами углерода, моноэфиры алкилсерной кислоты, алкилсульфоновые кислоты (сульфоновые кислоты с неразветвленными или разветвленными алкильными радикалами с 1 - 20 атомами углерода), арилсульфоновые кислоты или арилдисульфоновые кислоты (ароматические радикалы, такие как фенил и нафтил, которые несут одну или две группы сульфоновой кислоты), алкилфосфоновые кислоты (фосфоновые кислоты с неразветвленными или разветвленными алкильными радикалами с 1 - 20 атомами углерода), арилфосфоновые кислоты или арилдифосфоновые кислоты (ароматические радикалы, такие как фенил и нафтил, которые несут один или два радикала фосфоновой кислоты), где алкил- и арил- радикалы могут нести дополнительные заместители, например, п-толуолсульфоновая кислота, салициловая кислота, п-аминосалициловая кислота, 2-феноксibenзойная кислота, 2-ацетоксибензойная кислота.

Сольваты соединений по изобретению или их соли являются стехиометрическими композициями соединений с растворителями.

Соединения по настоящему изобретению могут существовать в различных кристаллических и/или аморфных формах. Кристаллические формы включают несольватированные кристаллические формы, сольваты и гидраты.

Настоящее изобретение также касается соединений формулы (I):



в которой

R^3 и R^4 означают водород,

R^5 означает водород,

L означает метилен,

R^6 означает фенил,

причем фенил замещен 2 заместителями, независимо выбранными из хлора, брома и метила,

R^7 означает хлор или метил,

R^8 означает водород,

Q означает фенил,

причем фенил замещен одним или двумя заместителями, независимо выбранными из фтора, хлора, метила, этила и циклопропила,

причем циклопропил, при необходимости, замещен одним или двумя заместителями фтора,

а также их N-оксидов, солей, гидратов и гидратов солей и N-оксидов.

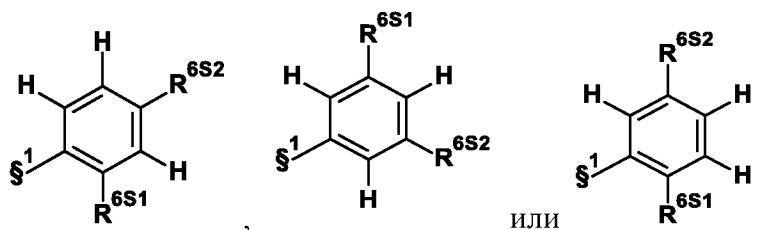
Настоящее изобретение касается соединений формулы (I-1), в которой

R^3 и R^4 означают водород,

R^5 означает водород,

L означает метилен,

R^6 означает группу формулы



в которой

$\S^1$ означает присоединение к L,

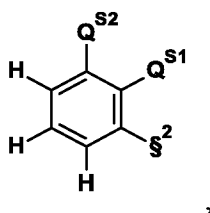
R^{6S1} означает хлор, бром или метил,

R^{6S2} означает хлор или метил, R^7 означает хлор, метил, дихлорметил, 1-фторэтил, 1-гидроксиэтил или 1-этоксипропан-1-ил,

R^8 означает водород,

R^9 означает водород или формил,

Q означает группу формулы



в которой

$\S^2$ означает присоединение к атому кислорода,

Q^{S1} означает водород или фтор,

Q^{S2} означает хлор, метил, этил, циклопропил, 1-фторциклопропил или 1-хлорциклопропил,

а также их N-оксидов, солей, гидратов и гидратов солей и N-оксидов.

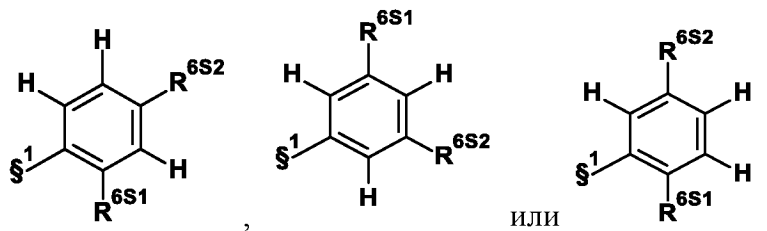
Предпочтительно настоящее изобретение также касается соединений формулы (I), в которой

R^3 и R^4 означают водород,

R^5 означает водород,

L означает метилен,

R^6 означает группу формулы



в которой

$\S^1$ означает присоединение к L,

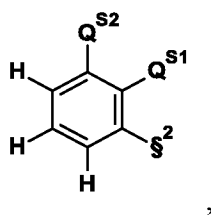
R^{6S1} означает хлор, бром или метил,

R^{6S2} означает хлор или метил,

R^7 означает хлор или метил,

R^8 означает водород,

Q означает группу формулы



в которой

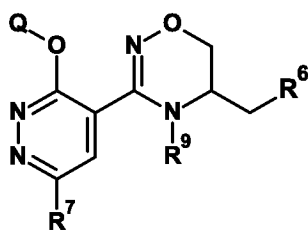
$\S^2$ означает присоединение к атому кислорода,

Q^{S1} означает водород или фтор,

Q^{S2} означает хлор, метил, этил или 1-фторциклопропил,

а также их N-оксидов, солей, гидратов и гидратов солей и N-оксидов.

Настоящее изобретение касается соединений формулы (I-1-A):



(I-1-A)

в которой

- R^6 означает фенил,
 причем фенил замещен 2 заместителями, независимо выбранными из хлора, брома и метила,
- R^7 означает хлор, метил, этил или этенил,
 причем метил, этил и этенил, при необходимости, замещен одним или двумя заместителями, независимо выбранными из группы, состоящей из фтора, хлора, гидроксид, метокси и этокси,
- R^8 означает водород,
- R^9 означает водород или формил,
- Q означает фенил,
 причем фенил замещен одним или двумя заместителями, независимо выбранными из фтора, хлора, метила, этила и циклопропила,
 причем циклопропил, при необходимости, замещен одним или двумя заместителями, независимо выбранными из группы, состоящей из фтора и хлора,
- а также их N-оксидов, солей, гидратов и гидратов солей и N-оксидов.

Наиболее предпочтительно настоящее изобретение касается соединений формулы (I-1), в которой соединение формулы (I-1) представляет собой одно из следующих соединений:

(I-001) (5RS)-5-(2-бром-4-метилбензил)-3-[3-(3-хлорфенокси)-6-метилпиридазин-4-ил]-5,6-дигидро-4H-1,2,4-оксадиазин,

(I-002) (5RS)-3-[3-(3-хлорфенокси)-6-метилпиридазин-4-ил]-5-(2,4-диметилбензил)-5,6-дигидро-4H-1,2,4-оксадиазин,

(I-003) (5RS)-5-(2-хлор-4-метилбензил)-3-[3-(2-фтор-3-метилфенокси)-6-метилпиридазин-4-ил]-5,6-дигидро-4H-1,2,4-оксадиазин,

(I-004) (5RS)-5-(2-хлор-4-метилбензил)-3-[3-(3-хлорфенокси)-6-метилпиридазин-4-ил]-5,6-дигидро-4H-1,2,4-оксадиазин,

(I-005) (5RS)-3-[6-хлор-3-(2-фтор-3-метилфенокси)пиридазин-4-ил]-5-(2,4-дихлорбензил)-5,6-дигидро-4H-1,2,4-оксадиазин,

- (I-006) (5RS)-5-(2-бром-4-метилбензил)-3-[3-(3-хлор-2-фторфенокси)-6-метилпиридазин-4-ил]-5,6-дигидро-4Н-1,2,4-оксадиазин,
- (I-007) (5RS)-5-(2,4-дихлорбензил)-3-[3-(2-фтор-3-метилфенокси)-6-метилпиридазин-4-ил]-5,6-дигидро-4Н-1,2,4-оксадиазин,
- (I-008) (5RS)-5-(3,5-диметилбензил)-3-[3-(2-фтор-3-метилфенокси)-6-метилпиридазин-4-ил]-5,6-дигидро-4Н-1,2,4-оксадиазин,
- (I-009) (5RS)-3-[3-(3-хлорфенокси)-6-метилпиридазин-4-ил]-5-(3,5-диметилбензил)-5,6-дигидро-4Н-1,2,4-оксадиазин
- (I-010) (5RS)-3-[3-(3-хлор-2-фторфенокси)-6-метилпиридазин-4-ил]-5-(3,5-диметилбензил)-5,6-дигидро-4Н-1,2,4-оксадиазин,
- (I-011) (5RS)-3-[3-(3-хлорфенокси)-6-метилпиридазин-4-ил]-5-(2,5-диметилбензил)-5,6-дигидро-4Н-1,2,4-оксадиазин,
- (I-012) (5RS)-3-[3-(3-хлор-2-фторфенокси)-6-метилпиридазин-4-ил]-5-(2,5-диметилбензил)-5,6-дигидро-4Н-1,2,4-оксадиазин,
- (I-013) (5RS)-5-(2,5-диметилбензил)-3-[3-(2-фтор-3-метилфенокси)-6-метилпиридазин-4-ил]-5,6-дигидро-4Н-1,2,4-оксадиазин,
- (I-014) (5RS)-5-(2,4-диметилбензил)-3-[3-(3-этил-2-фторфенокси)-6-метилпиридазин-4-ил]-5,6-дигидро-4Н-1,2,4-оксадиазин,
- (I-015) (5RS)-5-(2,4-диметилбензил)-3-{3-[3-(1-фторциклопропил)фенокси]-6-метилпиридазин-4-ил}-5,6-дигидро-4Н-1,2,4-оксадиазин,
- (I-016) 1-{6-(3-циклопропилфенокси)-5-[5-(2,4-диметилбензил)-5,6-дигидро-4Н-1,2,4-оксадиазин-3-ил]пиридазин-3-ил}этанол,
- (I-017) (5RS)-3-[6-хлор-3-(3-хлорфенокси)пиридазин-4-ил]-5-(2-хлор-4-метилбензил)-5,6-дигидро-4Н-1,2,4-оксадиазин,
- (I-018) (5RS)-3-{3-(3-циклопропил-2-фторфенокси)-6-[(1RS)-1-фторэтил]пиридазин-4-ил}-5-(2,4-дихлорбензил)-5,6-дигидро-4Н-1,2,4-оксадиазин,
- (I-019) (5RS)-3-[3-(3-циклопропилфенокси)-6-(1-этоксивинил)пиридазин-4-ил]-5-(2,4-дихлорбензил)-5,6-дигидро-4Н-1,2,4-оксадиазин,
- (I-020) (5RS)-3-[3-(3-циклопропил-2-фторфенокси)-6-(1-этоксивинил)пиридазин-4-ил]-5-(2,4-дихлорбензил)-5,6-дигидро-4Н-1,2,4-оксадиазин,

(I-021) (5S)-3-[3-(3-циклопропил-2-фторфенокси)-6-(дихлорметил)пиридазин-4-ил]-5-(2,4-диметилбензил)-5,6-дигидро-4Н-1,2,4-оксадиазин,

(I-022) (5RS)-3-{3-[3-(1-хлорциклопропил)фенокси]-6-метилпиридазин-4-ил}-5-(2,4-дихлорбензил)-5,6-дигидро-4Н-1,2,4-оксадиазин,

(I-023) 1-{6-(3-циклопропил-2-фторфенокси)-5-[5-(2,4-дихлорбензил)-5,6-дигидро-4Н-1,2,4-оксадиазин-3-ил]пиридазин-3-ил}этанол,

(I-024) (5RS)-3-{6-хлор-3-[3-(1-хлорциклопропил)фенокси]пиридазин-4-ил}-5-(2,4-дихлорбензил)-5,6-дигидро-4Н-1,2,4-оксадиазин,

(I-025) (5RS)-3-[6-хлор-3-(3-циклопропил-2-фторфенокси)пиридазин-4-ил]-5-(2,4-дихлорбензил)-5,6-дигидро-4Н-1,2,4-оксадиазин-4-карбальдегид.

Наиболее предпочтительно настоящее изобретение касается соединений формулы (I), в которой соединение формулы (I) представляет собой одно из следующих соединений:

(I.001) (5RS)-5-(2-бром-4-метилбензил)-3-[3-(3-хлорфенокси)-6-метилпиридазин-4-ил]-5,6-дигидро-4Н-1,2,4-оксадиазин,

(I.002) (5RS)-3-[3-(3-хлорфенокси)-6-метилпиридазин-4-ил]-5-(2,4-диметилбензил)-5,6-дигидро-4Н-1,2,4-оксадиазин,

(I.003) (5RS)-5-(2-хлор-4-метилбензил)-3-[3-(2-фтор-3-метилфенокси)-6-метилпиридазин-4-ил]-5,6-дигидро-4Н-1,2,4-оксадиазин,

(I.004) (5RS)-5-(2-хлор-4-метилбензил)-3-[3-(3-хлорфенокси)-6-метилпиридазин-4-ил]-5,6-дигидро-4Н-1,2,4-оксадиазин,

(I.005) (5RS)-3-[6-хлор-3-(2-фтор-3-метилфенокси)пиридазин-4-ил]-5-(2,4-дихлорбензил)-5,6-дигидро-4Н-1,2,4-оксадиазин,

(I.006) (5RS)-5-(2-бром-4-метилбензил)-3-[3-(3-хлор-2-фторфенокси)-6-метилпиридазин-4-ил]-5,6-дигидро-4Н-1,2,4-оксадиазин,

(I.007) (5RS)-5-(2,4-дихлорбензил)-3-[3-(2-фтор-3-метилфенокси)-6-метилпиридазин-4-ил]-5,6-дигидро-4Н-1,2,4-оксадиазин,

(I.008) (5RS)-5-(3,5-диметилбензил)-3-[3-(2-фтор-3-метилфенокси)-6-метилпиридазин-4-ил]-5,6-дигидро-4Н-1,2,4-оксадиазин,

- (I.009) (5RS)-3-[3-(3-хлорфенокси)-6-метилпиридазин-4-ил]-5-(3,5-диметилбензил)-5,6-дигидро-4Н-1,2,4-оксадиазин,
- (I.010) (5RS)-3-[3-(3-хлор-2-фторфенокси)-6-метилпиридазин-4-ил]-5-(3,5-диметилбензил)-5,6-дигидро-4Н-1,2,4-оксадиазин,
- (I.011) (5RS)-3-[3-(3-хлорфенокси)-6-метилпиридазин-4-ил]-5-(2,5-диметилбензил)-5,6-дигидро-4Н-1,2,4-оксадиазин,
- (I.012) (5RS)-3-[3-(3-хлор-2-фторфенокси)-6-метилпиридазин-4-ил]-5-(2,5-диметилбензил)-5,6-дигидро-4Н-1,2,4-оксадиазин,
- (I.013) (5RS)-5-(2,5-диметилбензил)-3-[3-(2-фтор-3-метилфенокси)-6-метилпиридазин-4-ил]-5,6-дигидро-4Н-1,2,4-оксадиазин,
- (I.014) (5RS)-5-(2,4-диметилбензил)-3-[3-(3-этил-2-фторфенокси)-6-метилпиридазин-4-ил]-5,6-дигидро-4Н-1,2,4-оксадиазин,
- (I.015) (5RS)-5-(2,4-диметилбензил)-3-{3-[3-(1-фторциклопропил)фенокси]-6-метилпиридазин-4-ил}-5,6-дигидро-4Н-1,2,4-оксадиазин,

а также их соли, гидраты и гидраты солей.

Соединения формулы (I) представляют собой подгруппу соединений формулы (I-1).

В объем изобретения не включены соединения, полученные в результате комбинаций, которые противоречат законам природы и которые являются недопустимыми по мнению специалиста в данной области. Например, в объем изобретения не включены кольцевые структуры с тремя или более расположенными рядом атомами кислорода.

Соединение формулы (I) может использоваться в свободной форме, в форме соли, в форме N-оксида или сольвата (например, гидрата).

В зависимости от свойств заместителей, соединение формулы (I) может присутствовать в виде различных стереоизомеров. Такими стереоизомерами могут быть, например, энантиомеры, диастереомеры, атропоизомеры или геометрические изомеры. Соответственно изобретение относится как к чистым изомерам, так и к любым смесям данных изомеров. В тех случаях, когда соединение может присутствовать в двух или более таутомерных формах в равновесии, в случае, если

по тексту упоминается одна таутомерная форма соединения, то такое упоминание включает все таутомерные формы.

Любое из соединений по настоящему изобретению может присутствовать в виде одной или нескольких форм геометрических изомеров, в зависимости от количества двойных связей в соединении. Геометрические изомеры по характеру заместителей относительно двойной связи или кольца могут присутствовать в *цис*- (= *Z*-) или *транс*- (= *E*-) форме. Таким образом, изобретение равным образом относится ко всем геометрическим изомерам и ко всем возможным смесям, во всех пропорциях.

В зависимости от свойств заместителей, соединение формулы (I) может присутствовать в виде свободного соединения и/или в виде его соли, например, в виде агрономически приемлемой соли.

Агрохимически активные соли включают кислотнo-аддитивные соли неорганических и органических кислот, а также соли обычных оснований. Примерами неорганических кислот являются галогенводородные кислоты, такие как фторводород, хлороводород, бромоводород и иодоводород, серная кислота, ортофосфорная кислота и азотная кислота, а также соли кислот, такие как бисульфат натрия и бисульфат калия. Применимые органические кислоты включают, например, муравьиную кислоту, карбоновую кислоту и алкановые кислоты, такие как уксусная кислота, трифторуксусная кислота, трихлоруксусная кислота и пропионовая кислота, а также гликолевая кислота, тиоциановая кислота, молочная кислота, янтарная кислота, лимонная кислота, бензойная кислота, коричная кислота, щавелевая кислота, насыщенные или моно- или диненасыщенные жирные кислоты с 6 - 20 атомами углерода, моноэфиры алкилсерной кислоты, алкилсульфоновые кислоты (сульфоновые кислоты с неразветвленными или разветвленными алкильными радикалами с 1 - 20 атомами углерода), арилсульфоновые кислоты или арилдисульфоновые кислоты (ароматические радикалы, такие как фенил и нафтил, которые несут одну или две группы сульфоновой кислоты), алкилфосфоновые кислоты (фосфоновые кислоты с неразветвленными или разветвленными алкильными радикалами с 1 - 20 атомами углерода), арилфосфоновые кислоты или арилдифосфоновые кислоты (ароматические радикалы, такие как фенил и нафтил, которые несут один или два радикала фосфоновой кислоты), где алкил- и арил- радикалы могут нести

дополнительные заместители, например, п-толуолсульфоновая кислота, салициловая кислота, п-аминосалициловая кислота, 2-феноксibenзойная кислота, 2-ацетоксибензойная кислота.

Сольваты соединений по изобретению или их соли являются стехиометрическими композициями соединений с растворителями.

Соединения по настоящему изобретению могут существовать в различных кристаллических и/или аморфных формах. Кристаллические формы включают несольватированные кристаллические формы, сольваты и гидраты.

Неограничивающие примеры подходящего Q включают любую из групп Q, перечисленных в столбце «Q» Таблицы 1.

Указанные выше определения R^3 , R^4 , R^5 , R^6 , R^7 , R^8 , R^9 , L и Q (широкое определение, а также предпочтительные, более предпочтительные, еще более предпочтительные определения) могут комбинироваться различными способами. Эти комбинации определений, таким образом, определяют подклассы соединений по изобретению, например, соединения, описанные ниже.

Настоящее изобретение также касается любых соединений формулы (I), раскрытых в Таблице 1.

Соединения формулы (I) могут быть использованы в качестве фунгицидов (для борьбы с фитопатогенными грибами), в частности, в способе борьбы с фитопатогенными грибами, который включает этап нанесения одного или более соединений формулы (I) на растения, части растений, семена, плоды или почву, на которой произрастают растения.

Способ приготовления соединений формулы (I) и промежуточных веществ

Настоящее изобретение касается способа приготовления соединений формулы (I-1), (I) и их промежуточных веществ. Описанные в настоящем документе способы могут применяться для приготовления соединений формулы (I) и (I-1) с соответствующими изменениями. Если не указано иное, радикалы R^3 , R^4 , R^5 , R^6 , R^7 , R^8 , L и Q имеют значения, указанные выше для соединений формулы (I). Эти определения применяются не только для конечных продуктов формулы (I), но также, аналогичным образом, и для всех промежуточных веществ.

Соединения формулы (I-a) представляют собой различные подмножества формулы (I). Соединения формулы (I-a-1) - (I-a-6) представляют собой различные подмножества формулы (I-a). Все заместители для формул (I-a) и (I-a-1) - (I-a-6) представляют собой то же, что определено выше для формулы (I), если не указано иное.

Соединения формулы (I) могут быть приготовлены различными путями по аналогии с известными способами (см., например, и указанные там ссылки). В настоящем документе описаны неограничивающие примеры подходящих способов.

Соединение формулы (I) может быть получено непосредственно путем выполнения способов А – Е или путем преобразования или дериватизации другого соединения формулы (I), полученного в соответствии со способами, описанными в настоящем документе. Например, соединение формулы (I) может быть преобразовано в другое соединение формулы (I) посредством замены одного или более заместителей исходного соединения формулы (I) на другие заместители.

Описанные в настоящем документе способы могут подходящим образом осуществляться с использованием одного или более инертных органических растворителей, которые являются стандартными для рассматриваемой реакции. Подходящие инертные органические растворители могут быть выбраны из следующих: алифатические, алициклические или ароматические углеводороды (например, петролейный эфир, пентан, гексан, гептан, циклогексан, метилциклогексан, лигроин, бензол, толуол, ксилол или декалин), галогенированные алифатические, алициклические или ароматические углеводороды (например, хлорбензол, дихлорбензол, дихлорметан, хлорформ, тетрагидрид углерода, 1,2-дихлорэтан или трихлорэтан), эфиры (например, диэтиловый эфир, диизопропиловый эфир, метил-трет-бутиловый эфир, метил-трет-амиловый эфир, диоксан, тетрагидрофуран, 2-метилтетрагидрофуран, 1,2-диметоксиэтан, 1,2-диэтоксиэтан или анизол), кетоны (например, ацетон, метилэтилкетон, метилизопропилкетон и метилизобутилкетон), сложные эфиры (например, метилацетат, этилацетат или бутилацетат), спирты (например, метанол, этанол, пропанол, изопропанол, бутанол, трет-бутанол), нитрилы (например, ацетонитрил, пропионитрил, н- или изобутиронитрил или бензонитрил), амиды (например, N,N-диметилформамид, N,N-диметилацетамид, N-метилформанилид,

N-метилпирролидон или триамид гексаметилфосфорной кислоты), сульфоксиды (например, диметилсульфоксид) или сульфоны (например, сульфолан), мочевины (например, 1,3-диметил-3,4,5,6-тетрагидро- 2(1H)-пиримидинон) или любую их смесь.

Для некоторых способов, описанных в настоящем документе, при необходимости, может потребоваться использование одного или более неорганических или органических оснований, которые обычно применяются при проведении таких реакций. Примеры подходящих органических и неорганических оснований включают, но не ограничиваются ими, карбонаты щелочных или щелочноземельных металлов (например, карбонат натрия, карбонат калия, бикарбонат калия, бикарбонат натрия или карбонат цезия), гидриды щелочных металлов (например, гидрид натрия), гидроксиды щелочных или щелочноземельных металлов (например, гидроксид натрия, гидроксид кальция, гидроксид калия или другие производные гидроксида аммония), фториды щелочных или щелочноземельных металлов или фториды аммония (например, фторид калия, фторид цезия или фторид тетрабутиламмония), ацетаты щелочных или щелочноземельных металлов (например, ацетат натрия, ацетат лития, ацетат калия или ацетат кальция), алкоголяты щелочных металлов (например, трет-бутоксид калия или трет-бутоксид натрия), фосфаты щелочных металлов (например, трикалий фосфат), третичные амины (например, триметиламин, триэтиламин, трибутиламин, N,N-диметиланилин, N,N-дициклогексилметиламин, N,N-диизопропилэтиламин, N-метилпиперидин, N,N-диметиламинопиридин, диазабициклооктан (DABCO), диазабициклононен (DBN), диазабициклоундецен (DBU), хинуклидин, 3-ацетоксихинуклидин, гуанидины или ароматические основания (например, пиридины, пиколины, лутидины или коллидины).

Некоторые из описанных в настоящем документе способов могут, при необходимости, осуществляться в присутствии катализатора на основе металла переходной группы, например, соли металла (например, меди или палладия) или металлического комплекса, при необходимости, в присутствии лиганда.

Подходящие соли или комплексы меди и их гидраты включают, но не ограничиваются ими, металлическую медь, йодид меди(I), хлорид меди(I), бромид меди(I), хлорид меди(II), бромид меди(II), оксид меди(II), оксид меди(I), ацетат меди(II), ацетат меди(I), тиофен-2-карбоксилат меди(I), цианид меди(I), сульфат

меди(II), бис(2,2,6,6-тетраметил-3,5-гептандионат) меди(II), трифторметансульфонат меди(II), гексафторфосфат тетраakis(ацетонитрил)меди(I), тетрафторборат тетраakis(ацетонитрил)-меди(I).

Кроме того, непосредственно в реакционной смеси может быть создан соответствующий комплекс меди путем добавления по раздельности в реакцию соли меди и лиганда или соли, такой как этилендиамин, N,N-диметилендиамин, N,N'-диметилендиамин, *rac*-транс-1,2-диаминоциклогексан, *rac*-транс-N,N'-диметилциклогексан-1,2-диамин, 1,1'-бинафтил-2,2'-диамин, N,N,N',N'-тетраметилэтилендиамин, пролин, N,N-диметилглицин, хинолин-8-ол, пиридин, 2-аминопиридин, 4-(диметиламино)пиридин, 2,2'-бипиридил, 2,6-ди(2-пиридил)пиридин, 2-пиколиновая кислота, 2-(диметиламинометил)-3-гидроксипиридин, 1,10-фенантролин, 3,4,7,8-тетраметил-1,10-фенантролин, 2,9-диметил-1,10-фенантролин, 4,7-диметокси-1,10-фенантролин, N,N'-бис[(E)-пиридин-2-илметилиден]циклогексан-1,2-диамин, N-[(E)-фенилметилиден], N-[(E)-фенилметилиден]-циклогексанамина, 1,1,1-трис(гидроксиметил)этан, n-бутилимидазол, этиленгликоль, 2,2,6,6-тетраметилгептан-3,5-дион, 2-(2,2-диметилпропаноил)циклогексанон, ацетилацетон, дибензоилметан, 2-(2-метилпропаноил)циклогексанон, бифенил-2-ил(ди-*трет*-бутил)фосфан, этилбис(дифенилфосфин), N,N-диэтилсалициламид, 2-гидроксibenзальдегид оксим, оксо[(2,4,6-триметилфенил)амино]уксусная кислота или 1H-пиррол-2-карбоновая кислота.

Подходящие соли или комплексы палладия включают, но не ограничиваются ими, хлорид палладия, ацетат палладия, тетраakis(трифенилфосфин)палладий(0), бис(дибензилиденацетон)палладий(0), трис(дибензилиденацетон)дипалладий(0), бис(трифенилфосфин) палладий(II) дихлорид, [1,1'-бис(дифенилфосфино)ферроцен]дихлорпалладий(II), бис(циннамил)дихлордипалладий(II), бис(аллил)-дихлордипалладий(II) или [1,1'-бис(ди-трет-бутилфосфино)ферроцен]дихлорпалладий(II).

Кроме того, в реакционной смеси может быть создан соответствующий комплекс палладия путем добавления по раздельности в реакцию соли палладия и лиганда или соли, такой как триэтилфосфин, три-*трет*-бутилфосфин, три-*трет*-бутилфосфоний тетрафторборат, трициклогексилфосфин, 2-(дициклогексил-

фосфино)бифенил, 2-(ди-*трет*-бутилфосфино)бифенил, 2-(дициклогексилфосфино)-2'-(N,N-диметиламино)бифенил, 2-(трет-бутилфосфино)-2'-(N,N-диметиламино)бифенил, 2-ди-*трет*-бутилфосфино-2',4',6'-триизопропилбифенил, 2-дициклогексилфосфино-2',4',6'-триизопропилбифенил, 2-дициклогексилфосфино-2,6'-диметоксибифенил, 2-дициклогексилфосфино-2',6'-диизопропоксибифенил, трифенил-фосфин, трис-(о-толил)фосфин, натрий 3-(дифенилфосфино)бензолсульфонат, трис-(2-метоксифенил)фосфин, 2,2'-бис(дифенилфосфино)-1,1'-бинафтил, 1,4-бис(дифенилфосфино)бутан, 1,2-бис(дифенилфосфино)этан, 1,4-бис(дициклогексилфосфино)бутан, 1,2-бис(дициклогексилфосфино)-этан, 2-(дициклогексилфосфино)-2'-(N,N-диметиламино)-бифенил, 1,1'-бис(дифенилфосфино)-ферроцен, (R)-(-)-1-[(S)-2-дифенилфосфино)ферроценил]этилдициклогексилфосфин, трис-(2,4-*трет*-бутилфенил)фосфит, ди(1-адамантил)-2-морфолинофенилфосфин или 1,3-бис(2,4,6-триметилфенил)имидазолий хлорид.

Соответствующий катализатор и/или лиганд может быть выбран из катализаторов и/или лигандов, указанных в коммерческих каталогах, таких как «Metal Catalysts for Organic Synthesis» от Strem Chemicals или из обзоров (Chemical Society Reviews (2014), 43, 3525, Coordinate Chemistry Reviews (2004), 248, 2337 и приведенные в них ссылки).

Некоторые из описанных в настоящем документе способов могут осуществляться путем металло-фотоокислительного катализа в соответствии с методами, описанными в литературе (Nature chemistry review, (2017) 0052 и приведенные там ссылки; Science (2016) 352, 6291, 1304; Org. Lett. 2016, 18, 4012, J. Org. Chem 2016, 81, 6898; J. Am. Chem. Soc. 2016, 138, 12715, J. Am. Chem. Soc. 2016, 138, 13862; J. Am. Chem. Soc. 2016, 138, 8034; J. Org. Chem. 2016, 81, 12525, J. Org. Chem. 2015, 80, 7642). Затем способ осуществляется в присутствии фотосенсибилизатора, такого как комплексы Ir и Ru или органические красители, и металлического катализатора, такого как комплексы Ni. Реакцию можно проводить в присутствии лиганда и, при необходимости, в присутствии основания при облучении синим или белым светом.

Подходящие фотосенсибилизаторы включают, но не ограничиваются ими, фотокатализатор Ir(III), такой как $[\text{Ir}(\text{dFCF}_3\text{ppy})_2(\text{bpy})]\text{PF}_6$ ($\text{dFCF}_3\text{ppy} = 2\text{-(2,4-}$

дифторфенил)-5-трифторметилпиридин, bpy = 2,2'-бипиридин), $[\text{Ir}(\text{dFCF}_3\text{ppy})_2(\text{dtbbpy})]\text{PF}_6$ (dtbbpy = 4,4'-ди-трет-бутил-2,2'-бипиридин), $\text{Ir}(\text{ppy})_2(\text{dtbbpy})\text{PF}_6$ (ppy = 2-фенилпиридин), $\text{Ir}(\text{ppy})_2(\text{bpy})\text{PF}_6$, $\text{Ir}(\text{dFppy})_3\text{PF}_6$ (dFCF₃ppy = 2-(2,4-дифторфенил)пиридин), fac-Ir(ppy)₃, $[\text{Ir}[\text{diF}(5\text{-Me})\text{ppy}]_2(\text{тетраMePhen})]\text{PF}_6$ (diF(5-Me)ppy = 2-(2,4-дифторфенил)-5-метилпиридин, тетраMePhen = 3,4,7,8-тетраметил-1,10-фенантролин), фотокатализатор Ru(II), такой как $\text{Ru}(\text{bpy})_3\text{Cl}_2$ или $\text{Ru}(\text{bpy})_3(\text{PF}_6)_2$ или органические красители, такие как 9-метизил-10-акридиния перхлорат или тетрафторборат, или 2,4,5,6-тетра-9Н-карбазол-9-ил-1,3-бензолдикарбонитрил, 9-фторенон и 9,10-фенантренин.

Подходящие никельсодержащие катализаторы включают, но не ограничиваются ими, бис(1,5-циклооктадиен)никель (0), хлорид никеля(II), бромид никеля(II), йодид никеля(II) в их безводной или гидратной формах или в виде диметоксиэтановых комплексов, ацетилацетонат никеля(II), гексагидрат нитрата никеля(II). Такие катализаторы на основе никеля могут использоваться в комбинации с бипиридиновым лигандом, таким как 2,2'-бипиридин, 4,4'-ди-трет-бутил-2,2'-бипиридин, 4,4'-диметокси-2,2'-бипиридин, 4,4'-диметил-2,2'-бипиридин, или фенантролином, таким как 1,10-фенантролин, 4,7-диметил-1,10-фенантролин, 4,7-диметокси-1,10-фенантролин, или диаминами, такими как N,N,N',N'-тетраметилэтилендиамин, или дионом, таким как тетраметилгептандион.

Описанные в настоящем документе способы могут осуществляться при температуре в диапазоне -105°C - 250°C, предпочтительно -78°C - 185°C.

Время реакции варьируется в зависимости от масштаба реакции и температуры реакции, но, как правило, оно составляет от нескольких минут до 48 ч.

Способы, описанные в настоящем документе, как правило, осуществляются при нормальном давлении. Однако также возможно, чтобы способы по изобретению осуществлялись при повышенном или пониженном давлении.

Описанные в настоящем документе способы, при необходимости, могут осуществляться при микроволновом облучении при стандартном или повышенном давлении.

Для осуществления способов по изобретению исходные материалы, как правило, используют приблизительно в эквимольных количествах. Однако также

возможно, чтобы один из исходных материалов использовался в относительно большом избытке.

Способ приготовления соединений формулы (I)

Способ А

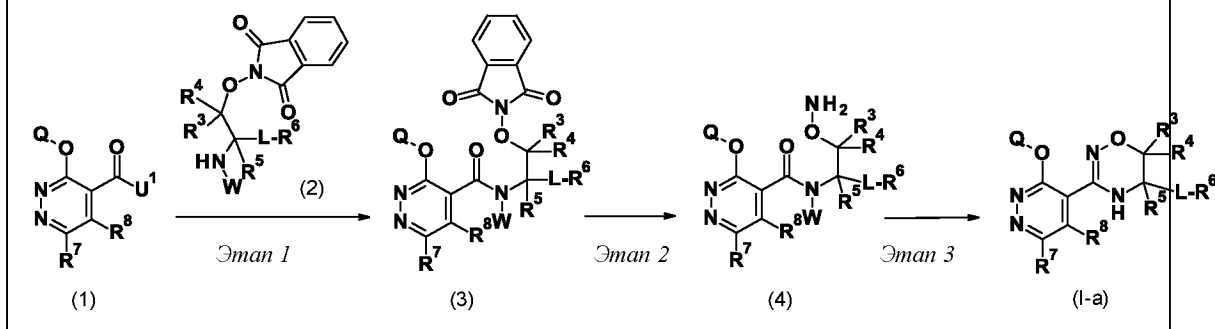
Соединение формулы (I-a), в которой R^3 , R^4 , R^5 , R^6 , R^7 , R^8 , L и Q имеют значения, как определено выше, может быть приготовлено,

когда W означает водород, путем обработки соединения формулы (4), в которой R^3 , R^4 , R^5 , R^6 , R^7 , R^8 , L и Q имеют значения, как определено выше, дегидратирующим агентом, при необходимости, в присутствии основания, с получением непосредственно соединения формулы (I-a)

или

когда W означает аминокзащитную группу, такую как трет-бутоксикарбонил, бензил, аллил или (4-метоксифенил)метил, путем обработки соединения формулы (4) дегидратирующим агентом, при необходимости, в присутствии основания, и затем осуществление этапа удаления защитных групп, с получением соединения формулы (I-a), как показано на Схеме 1.

Схема 1: Способ А – Синтез соединений формулы (I-a)



Соединение формулы (I-a) может быть получено путем обработки соединения формулы (4) дегидратирующим агентом, таким как POCl₃, P₂O₅ или трифторангидрид, при необходимости, в присутствии основания. Такие способы образования оксадиазиновых колец являются известными и описаны в литературе (J. Med. Chem. 2017, 60, 2383-2400). Реакция может проводиться в любых обычных инертных органических растворителях. Предпочтительно используют, при необходимости, галогенизированные алифатические, алициклические или ароматический углеводороды, такие как петролейный эфир, гексан, гептан,

циклогексан, метилциклогексан, бензол, толуол, ксилол или декалин; хлорбензол, дихлорбензол, дихлорметан, хлороформ, тетрахлорид углерода, дихлорэтан или трихлорэтан; простые эфиры, такие как диизопропиловый эфир, метил-трет-бутиловый эфир, метил-трет-амиловый эфир, диоксан, тетрагидрофуран, 1,2-диметоксиэтан, 1,2-диэтоксиэтан или анизол; нитрилы, такие как ацетонитрил, пропионитрил, *n*- или изобутиронитрил или бензонитрил; спирты, такие как этанол или изопропанол.

Когда W представляет собой защитную группу для аминогруппы, за этапом 3 следует дополнительный этап удаления защитной группы, на котором используют реакционные условия, описанные в литературе (Greene's Protective Groups in organic Synthesis; Peter G. M. Wuts; Wiley; Издание пятое; 2014; 895-1194). Например, трет-бутоксикарбонильную группу можно удалить в кислой среде, такой как соляная кислота или трифторуксусная кислота.

Соединение формулы (4) может быть получено путем:

- реакции соединения формулы (1) с амином формулы (2) или одной из его солей для получения соединения формулы (3);
- удаления соединения (3) фталимидной группы с получением соединения формулы (4).

Условия реакции для удаления фталимидной группы хорошо известны и описаны в литературе (Greene's Protective Groups in organic Synthesis; Peter G. M. Wuts; Wiley; Издание пятое; 2014; 1012-1014).

Соединения формулы (1) могут быть приготовлены одним или более способами, описанными в настоящем документе (см. Способ F).

Амины формулы (2) могут быть приготовлены с использованием Способа G, описание которого приводится ниже.

Соединения формулы (1), где U¹ представляет собой гидроксильную группу, можно вводить в реакцию с амином формулы (2) в присутствии конденсирующего реагента с помощью методов, описанных в литературе (например, Tetrahedron 2005, 61, 10827-10852). Примеры подходящих реагентов для конденсации включают, помимо прочего, галогенирующие реагенты (такие, например, как фосген, трибромид фосфора, трихлорид фосфора, пентахлорид фосфора, оксид трихлорид фосфора, оксалил хлорид или тионил хлорид), дегидратирующие реагенты (такие,

например, как этилхлорформиат, метилхлорформиат, изопропилхлорформиат, изобутилхлорформиат или метансульфонил хлорид), карбодиимиды (например, N,N'-дициклогексилкарбодиимид (DCC)) или другие обычные конденсирующие (или пептидные) реагенты (такие, например, как пентоксид фосфора, полифосфорная кислота, бис(2-оксо-3-оксазолидинил)фосфиновый хлорид, 1-[бис(диметиламино)метилен]-1H-1,2,3-триазоло[4,5-b]пиридиний 3-оксид гексафторфосфат (HATU), N,N'-карбонил-диимидазол, 2-этокси-N-этоксикарбонил-1,2-дигидрохиолин (EEDQ), трифенилфосфин/тетрахлор-метан, 4-(4,6-диметокси[1.3.5]-триазин-2-ил)-4-метилморфолиний хлорид гидрат, бром-трипирролидинофосфонийгексафторфосфат или пропанфосфоновый ангидрид (T3P).

Соединения формулы (1), где U^1 представляет собой атом галогена, можно вводить в реакцию с амином формулы (2) в присутствии поглотителя кислоты с помощью хорошо известных методов. Подходящие поглотители кислоты включают любые неорганические и органические основания, как описано в настоящем документе, которые являются привычными для таких реакций. Предпочтительными являются карбонаты щелочных и щелочноземельных металлов, ацетаты щелочноземельных металлов, третичные амины или ароматические основания.

Соединения формулы (1), где U^1 представляет собой группу C_1 - C_6 -алкокси, может вступать в реакцию с избытком амина формулы (2), при необходимости, в присутствии кислоты Льюиса, такой как триметилалюминий.

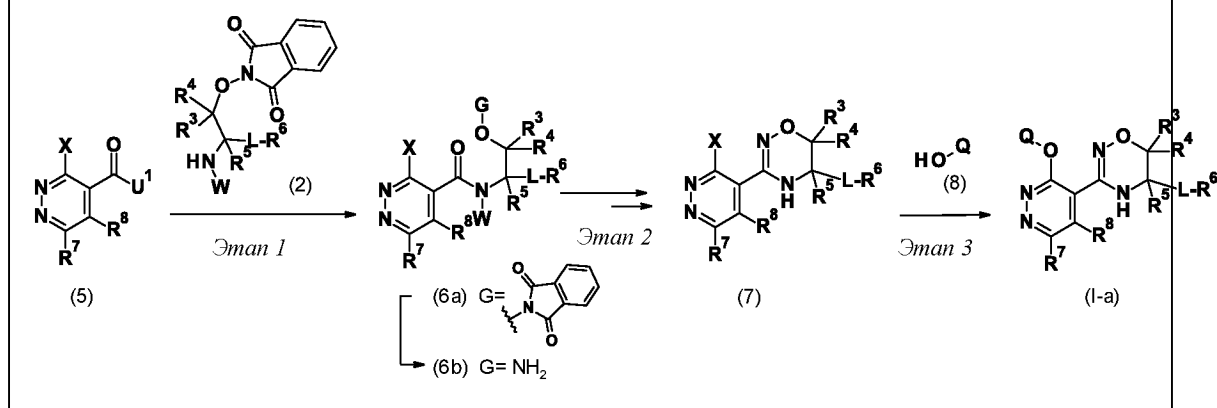
Способ В

Соединение формулы (I-a), в которой R^3 , R^4 , R^5 , R^6 , R^7 , R^8 , L и Q имеют значения, как определено выше, могут быть приготовлены путем реакции соединения формулы (7), в которой R^3 , R^4 , R^5 , R^6 , R^7 , R^8 , L и Q имеют значения, как определено выше, и

X означает галоген, предпочтительно хлор,

с соединением формулы (8), в которой Q имеет значение, как определено выше, в присутствии основания (например, органического или неорганического основания) и, при необходимости, в присутствии подходящей соли или комплекса меди, как показано на Схеме 2.

Схема 2: Способ В – Синтез соединений формулы (I-a)



Соединения формулы (7) могут быть приготовлены сначала путем реакции соединения формулы (5), в которой R^7 , R^8 и X имеют значения, как определено выше, и

U^1 означает гидроксигруппу, галоген или C_1 - C_6 -алкокси,

с амином формулы (2), в которой R^3 , R^4 , R^5 , R^6 и L имеют значения, как определено выше, и

W означает водород, трет-бутоксикарбонил, бензил, аллил или (4-метоксифенил)метил,

или одной из его солей,

с получением соединения формулы (6a), в которой R^3 , R^4 , R^5 , R^6 , R^7 , R^8 , L , Q и W имеют значения, как определено выше,

затем удаления фталимидной группы соединения (6a) с получением соединения формулы (6b), в которой R^3 , R^4 , R^5 , R^6 , R^7 , R^8 , L , Q и W имеют значения, как определено выше, и

когда W означает водород, путем обработки соединения формулы (6b) дегидратирующим агентом, при необходимости, в присутствии основания, с получением непосредственно соединения формулы (7);

когда W означает аминозащитную группу, путем обработки соединения формулы (6b) дегидратирующим агентом, при необходимости, в присутствии основания и затем осуществление этапа удаления защитных групп, с получением соединения формулы (7),

в тех же условиях, что описаны здесь для Способа А.

Реакция соединения формулы (7) с соединением формулы (8) может происходить в присутствии катализатора переходного металла, такого как соль или комплекс меди, и, при необходимости, в присутствии лиганда, как описано здесь.

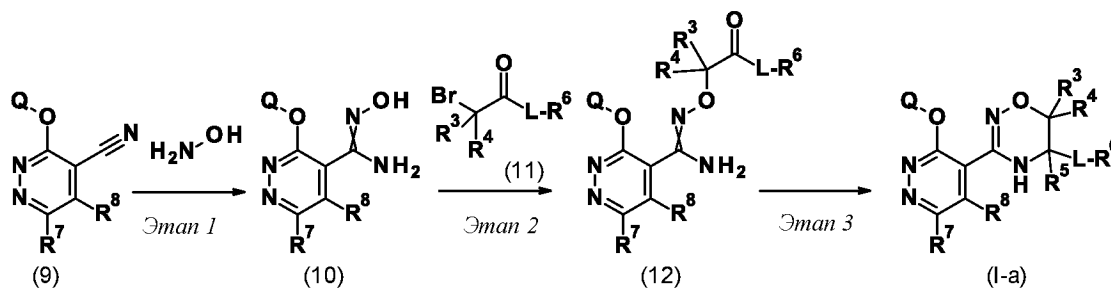
Соединения формулы (5) имеются в продаже.

Соединения формулы (8) имеются в продаже или могут быть получены путем преобразования или дериватизации другого соединения формулы (8) в соответствии с хорошо известными способами.

Способ С

Соединение формулы (I-a), в которой R^3 , R^4 , R^5 , R^6 , R^7 , R^8 , L и Q имеют значения, как определено выше, могут быть приготовлены путем добавления восстанавливающего средства к соединению формулы (12), в которой R^3 , R^4 , R^6 , R^7 , R^8 , L и Q имеют значения, как определено выше, в условиях кислотной среды с получением соединения формулы (I-a), как показано на Схеме 3.

Схема 3: Способ С – Синтез соединений формулы (I-a)



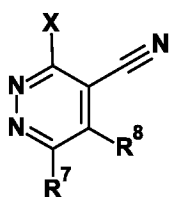
Соединение формулы (12) может быть циклизовано в условиях кислотной среды в присутствии восстанавливающего средства, такого как цианоборгидрид натрия с получением соединения формулы (I-a). Условия реакции для образования оксадиазинового кольца с помощью этой методики известны и описаны в литературе (Heterocycles 2016, 92, 2166-2200).

Соединение формулы (12) может быть получено путем реакции соединения формулы (10), в которой R^7 , R^8 и Q имеют значения, как определено выше, с соединением формулы (11), в которой R^3 , R^4 , R^6 и L имеют значения, как определено выше, в присутствии основания. Подходящие основания могут представлять собой гидриды щелочных металлов, такие как гидрид натрия, карбонаты щелочных металлов, такие как карбонат калия, гидроксиды щелочных

металлов, такие как гидроксид калия, или фосфазеновые основания, такие как ВЕМР, как описано в литературе (Heterocycles 2016, 92, 2166-2200).

Соединение формулы (10) может быть получено путем реакции соединения формулы (9), в которой R^7 , R^8 и Q имеют значения, как определено выше, с гидроксиламином или одной из его солей. Условия реакции для осуществления таких преобразований известны и описаны в литературе (WO2010/138600).

Соединения формулы (9) могут быть приготовлены из соединений формулы (18)



(18),

в которой R^7 , R^8 и X имеют значения, как определено выше, способами, описанными для этапа 3 Способа В.

Соединения формулы (11) являются либо коммерчески доступными, либо могут быть приготовлены способами, описанными в литературе (Eur. J. Med. Chem. 2014, 84, 302, Eur. J. Med. Chem. 2015, 100, 18-23, WO2017/031325).

Способ D

Соединение формулы (I-a), в которой R^3 , R^4 , R^5 , R^6 , R^7 , R^8 , L и Q имеют значения, как определено выше, могут быть приготовлены способом, включающим следующие этапы:

- путем реакции соединения формулы (1), в которой R^7 , R^8 и Q имеют значения, как определено выше, с амином формулы (13), в которой R^3 , R^4 , R^5 , R^6 и L имеют значения, как определено выше, и

E^1 означает гидроксил или галоген,

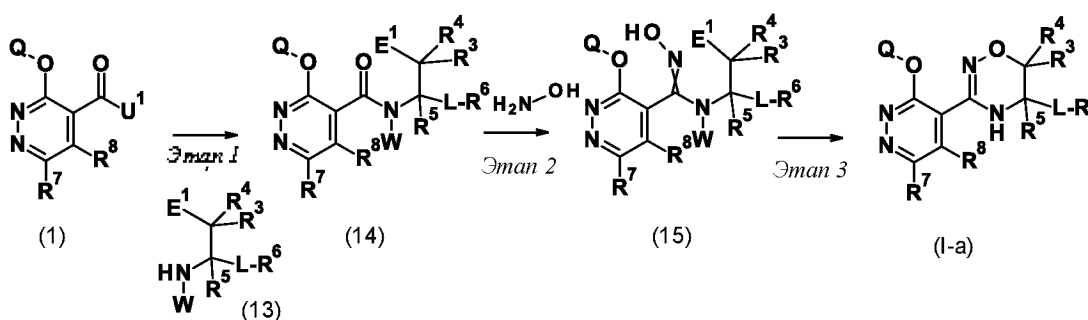
или одной из его солей, с получением соединения формулы (14), в которой R^3 , R^4 , R^5 , R^6 , R^7 , R^8 , E^1 , L и Q имеют значения, как определено выше, и

W означает водород, трет-бутоксикарбонил, бензил, аллил или (4-метоксифенил)метил,

при подобных условиях, как описано в Способе А,

- обработку соединения формулы (14) дегидратирующим агентом с последующей обработкой гидроксиламином, с образованием соединения формулы (15), в которой R^3 , R^4 , R^5 , R^6 , R^7 , R^8 , E^1 , L, Q и W имеют значения, как определено выше,
- когда E^1 означает гидроксил, преобразование соединения формулы (15) в соединение формулы (I-a) с использованием условий реакции Мицунобу,
- когда E^1 означает галоген, преобразование соединения формулы (15) в соединение формулы (I-a) в присутствии основания, как показано на Схеме 4.

Схема 4: Способ D – Синтез соединений формулы (I-a)



Этап 2 и этап 3 Способа D могут быть осуществлены с использованием подобных условий реакции, как описано в Способе E.

Аминоспирты формулы (13-a, E^1 = гидроксил) имеются в продаже или могут быть получены способами, описанными в литературе (Molecules, 9 (6), 405-426; 2004; WO2017/203474). Соединения формулы (13-b, E^1 = галоген) или одна из его солей могут быть получены из соответствующего аминоспирта с помощью хорошо известных методов.

Способ E

Соединение формулы (I-a), в которой R^3 , R^4 , R^5 , R^6 , R^7 , R^8 , L и Q имеют значения, как определено выше, может быть приготовлено способом, включающим следующие этапы:

- реакцию соединения формулы (5), в которой R^7 и R^8 имеют значения, как определено выше, и

X означает галоген, предпочтительно хлор,

U^1 означает гидроксигруппу, галоген или C_1 - C_6 -алкокси,

- с амином формулы (13) причем R^3 , R^4 , R^5 , R^6 и L имеют значения, как определено выше, и

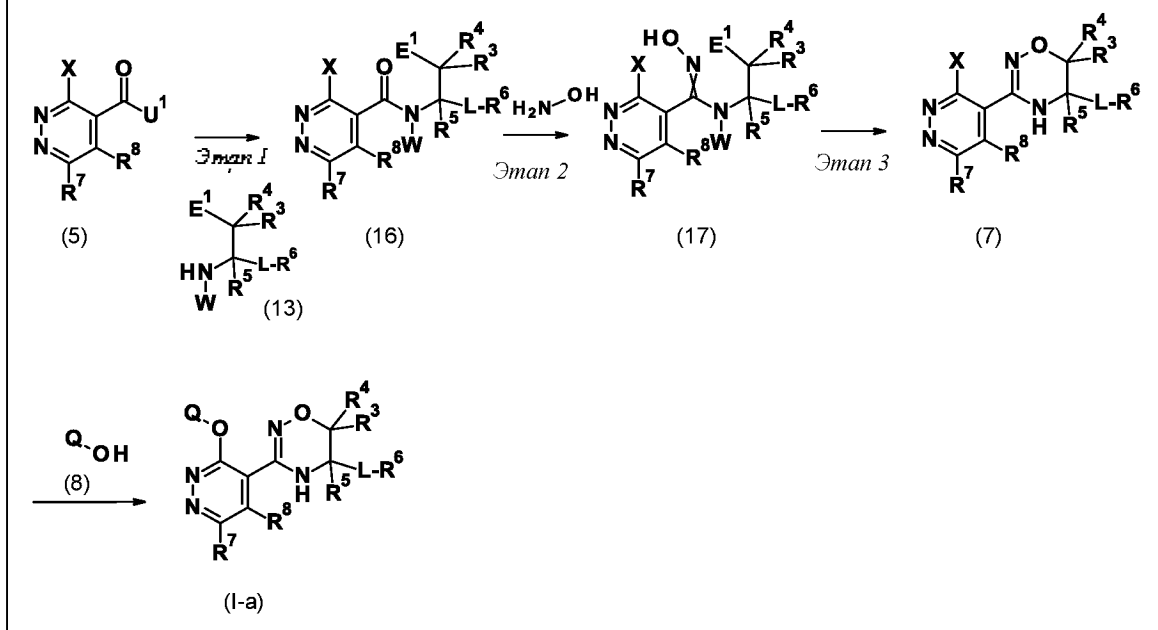
E^1 означает гидроксил или галоген,

или одна из его солей с получением соединения формулы (16), в которой R^3 , R^4 , R^5 , R^6 , R^7 , R^8 , E^1 , L и X имеют значения, как определено выше, и

W означает водород, трет-бутоксикарбонил, бензил, аллил или (4-метоксифенил)метил, при подобных условиях, как описано в Способе А,

- обработку соединения формулы (16) дегидратирующим агентом с последующей обработкой гидроксиламином, с образованием соединения формулы (17), в которой R^3 , R^4 , R^5 , R^6 , R^7 , R^8 , E^1 , L и X имеют значения, как определено выше,
- когда E^1 означает гидроксил, преобразование соединения формулы (17) в соединение формулы (7) с использованием условий реакции Мицунобу,
- когда E^1 означает галоген, преобразование соединения формулы (17) в соединение формулы (7) в присутствии основания,
- путем реакции соединения формулы (7), в которой R^3 , R^4 , R^5 , R^6 , R^7 , R^8 , L и X имеют значения, как определено выше,
- с соединением формулы (8), в которой Q имеет значение, как определено выше, в присутствии основания (например, органического или неорганического основания) и, при необходимости, в присутствии подходящей соли или комплекса меди с получением соединения формулы (I-a), как показано на Схеме 5.

Схема 5: Способ Е – Синтез соединений формулы (I-a)



Способы приготовления соединения формулы (1)

Соединение формулы (1), как описано в настоящем документе, могут быть непосредственно получены путем осуществления Способа F, описанного ниже, или могут быть получены путем преобразования или дериватизации другого соединения формулы (1), приготовленного в соответствии со способами, описанными в настоящем документе.

Способ F

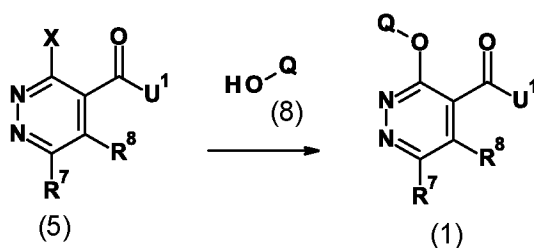
Соединение формулы (1), в которой R⁷ и R⁸ имеют значения, как определено выше, могут быть приготовлены путем реакции соединения формулы (5), в которой R⁷ и R⁸ имеют значения, как определено выше, и

X означает галоген,

U¹ означает C₁-C₆-алкокси,

С реагентом формулы (8), в которой Q имеет значение, как определено выше, в присутствии основания, как показано на Схеме 6.

Схема 6: Способ F – Приготовление соединений (1)



Способ F может происходить в присутствии подходящих каталитических солей или комплексов переходных металлов, при необходимости, в присутствии лиганда.

Соединения формулы (5) имеются в продаже.

Соединения формулы (8) имеются в продаже или могут быть получены путем преобразования или дериватизации другого соединения формулы (8) в соответствии с хорошо известными способами.

Соединения формулы (1), в которой U^1 означает C_1 - C_6 -алкокси, могут быть преобразованы в соединения формулы (1), в которой U^1 означает гидроксильную группу, с помощью хорошо известных методов взаимного преобразования функциональных групп, например, путем гидролиза сложноэфирной группы с LiOH в ТГФ/воде.

Соединения формулы (1), в которой U^1 означает гидроксил, могут быть преобразованы в соединения формулы (1), в которой U^1 означает галоген, в присутствии галогенирующих агентов помощью хорошо известных методов. Подходящие галогенирующие реагенты включают, но не ограничиваются ими, трибромид фосфора, трихлорид фосфора, пентахлорид фосфора, оксид трихлорид, оксалил хлорид или тионил хлорид фосфора.

Способ G

Соединение формулы (1-b), в которой R^8 и Q имеют значения, как определено выше, и

R^{7a} означает хлор,

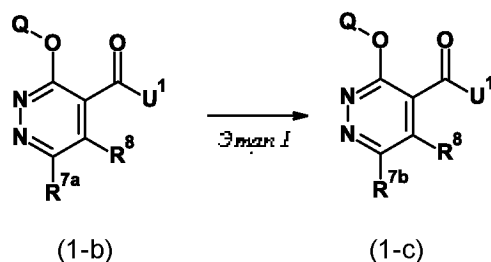
U^1 означает C_1 - C_6 -алкокси,

Могут быть преобразованы с помощью хорошо известных методов в соответствующие соединения формулы (1-с), в которой R^8 , U^1 и Q имеют значения, как определено выше, и

R^{7b} означает метил,

за один или более этапов, как показано на Схеме 7.

Схема 7: Способ G – Приготовление соединений (1-с) и (1-d)



Неограничивающие примеры преобразования могут быть выполнены в соответствии с описанием, предоставленным в Способе H.

Способ приготовления соединений формулы (2) и (13)

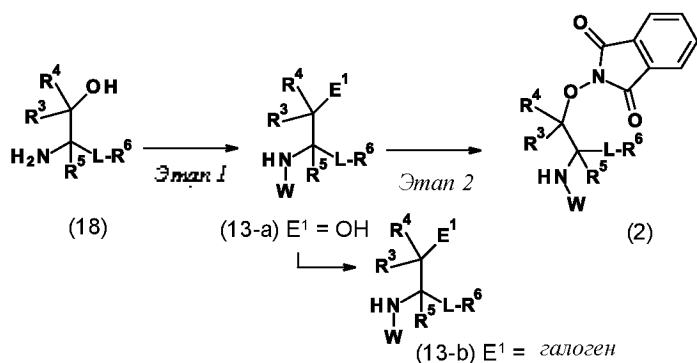
Способ H

Соединение формулы (18), в которой R^3 , R^4 , R^5 , R^6 и L имеют значения, как определено выше, могут быть преобразованы с помощью методов, описанных в литературе, в соответствующие соединения (2), (13-a) и (13-b), в которых R^3 , R^4 , R^5 , R^6 и L имеют значения, как определено выше, и

W означает водород, трет-бутоксикарбонил, бензил, аллил или (4-метоксифенил)метил,

за один или более этапов, как показано на Схеме 9.

Схема 8: Способ H – Приготовление соединений (2), (13-a) и (13-b)



Аминоспирты формулы (18) имеются в продаже или могут быть получены способами, описанными в литературе (Molecules, 9 (6), 405-426; 2004, WO2017/203474).

Амино-функция соединения (18) защищается в соответствии с известными методами, с получением соединения формулы (13-a).

В дальнейшем, соединение формулы (13-a) может быть преобразовано на Этапе 2 Способа Н в соединение формулы (2) с использованием классических условий реакции Мицунобу, известных специалисту в данной области техники (Strategic Applications of Named Reactions in Organic Synthesis; Laszlo Kürti, Barbara Czako; Elsevier; 2005; 294-295 и приведенные здесь ссылки).

Способ I

Соединение формулы (I-a), в которой L, Q, R³, R⁴, R⁵, R⁶ и R⁸ имеют значения, как определено выше, и

R⁹ означает H,

R^{7a} означает хлор,

Могут быть преобразованы с помощью методов, описанных в литературе, в соответствующие соединения формулы (I-b), в которой L, Q, T, R³, R⁴, R⁵, R⁶ и R⁸ имеют значения, как определено выше, и

R^{7b} означает метил или этенил,

причем этенил замещен одним заместителем метокси или этокси,

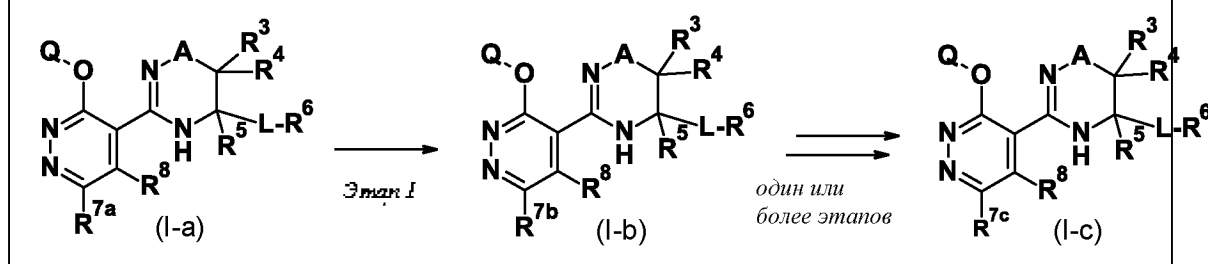
C₁-C₆-алкенилокси,

и соединение формулы (I-b) может быть преобразовано в соединение формулы (I-c), в которой L, Q, T, R³, R⁴, R⁵, R⁶ и R⁸ имеют значения, как определено выше, и

R^{7c} означает C₁-C₅-алкилкарбонил, C₂-C₆-гидроксиалкил, C₂-C₆-галоалкил,

за один или более этапов, как показано на Схеме 9.

Схема 9: Способ I – Синтез соединений формулы (I-b) и (I-c)



Неограничивающие примеры преобразований, выполненных в соответствии со Схемой 9, приведены ниже.

Соединение формулы (I-a), в которой R^{7a} означает хлор, может быть преобразовано в соединение формулы (I-b), в которой R^{7b} означает метил, с помощью способов, катализируемых переходными металлами или металлоокислительно-восстановительной реакцией, как описано в настоящем документе, или способом, известным специалисту в данной области.

Соединение формулы (I-b), в которой R^{7b} означает C_2 - C_6 -алкенил, замещенный C_1 - C_3 -алкокси, может быть преобразовано в соединение формулы (I-c), в которой R^{7c} означает C_1 - C_5 -алкилкарбонил, с помощью методов, описанных в литературе (например, J. Org. Chem. 1993, 55, 3114).

Соединение формулы (I-c), в которой R^{7c} означает C_1 - C_5 -алкилкарбонил, может быть далее преобразовано в соединение формулы (I-c), в которой R^{7c} означает C_1 - C_6 -гидроксиалкил, путем классического взаимопревращения функциональных групп, такого как восстановление кетонов до спиртов, в присутствии $NaBH_4$ в метаноле.

Соединение формулы (I-c), в которой R^{7c} означает C_2 - C_6 -гидроксиалкил, может быть далее преобразовано в соединение (I-c), в котором R^{7c} означает C_2 - C_6 -фторалкил, в присутствии фторирующего агента. Неограничивающие примеры фторирующих агентов включают фториды серы, такие как тетрафторид серы, диэтиламиносертрифторид, трифторид морфолиносеры, трифторид бис(2-метоксиэтил)аминосеры, 2,2-дифтор-1,3-диметилимидазолидин или трифторид 4-*трет*-бутил-2,6-диметилфенилсеры.

Соединение формулы (I-a) может быть приготовлено одним или более способами, описанными в настоящем документе.

Способ J

Соединение формулы (I-d), в которой L, Q, R³, R⁴, R⁵, R⁶ и R⁸ имеют значения, как определено выше, и

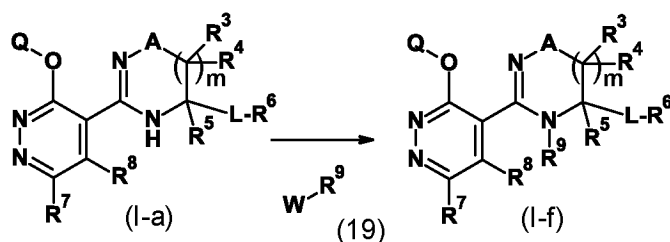
R⁹ означает формил,

могут быть приготовлены способом, включающим этап реакции соединения формулы (I-a) с соединением формулы (13), в которой R⁹ имеет значение, как определено выше, и

W означает галоген, C₁-C₆-алкоксикарбонилокси, C₁-C₆-галоалкоксикарбонилокси, C₁-C₆-алкилкарбонилокси, C₁-C₆-галоалкилкарбонилокси, C₁-C₆-галоалкилсульфонилокси или C₁-C₆-алкилсульфонилокси,

как показано на Схеме 10.

Схема 10: Способ J – Синтез соединений формулы (I-f)



Способ M может быть осуществлен посредством способов, описанных в литературе (например, Tetrahedron Lett. 1995, 36, 8949; Greene's Protective Groups in organic Synthesis; Peter G. M. Wuts; Wiley; Пятое Издание; 2014; 1174-1175).

Соединения формулы (19) имеются в продаже.

Соединения формулы (I-a) могут быть приготовлены одним или более способами, описанными в настоящем документе.

Композиции и препаративные формы

Настоящее изобретение далее касается композиций, в частности, композиций для борьбы с нежелательными микроорганизмами. Композиция может наноситься на микроорганизмы и/или место их обитания.

Композиция содержит, по меньшей мере, одно соединение формулы (I) и, по меньшей мере, одно пригодное в области сельского хозяйства вспомогательное средство, например, носитель(и) и/или поверхностно-активное вещество(а).

Носитель представляет собой твердое или жидкое, природное или синтетическое, органическое или неорганическое вещество, которое обычно является инертным. Как правило, носитель повышает эффективность нанесения соединений, например, на растения, части растений или на семена. Примеры соответствующих *твердых носителей* включают, но не ограничиваются ими, соли аммония, в частности, сульфаты аммония, фосфаты аммония и нитраты аммония, порошок естественной горной породы, например, каолины, глины, тальк, мел, кварц, аттапульгит, монтмориллонит и диатомовую землю, силикагель и порошок синтетической горной породы, например, тонкоизмельченный диоксид кремния, глинозем и силикаты. Примеры обычно используемых твердых носителей для получения гранул включают, помимо прочего: измельченные и фракционированные естественные породы, такие как кальцит, мрамор, пемза, сепиолит и доломит, а также синтетические грануляты из неорганических и органических мук и грануляты из органического материала, такого как бумага, опилки, скорлупа кокосового ореха, початки кукурузы и стебли табака. Примеры соответствующих жидких носителей включают, помимо прочего, воду, органические растворители и их комбинации. Примеры соответствующих растворителей включают полярные и неполярные органические химические жидкости, например, из классов ароматических и неароматических углеводородов (таких как циклогексан, парафины, алкилбензолы, ксилол, толуол, тетрагидронафталены, алкилнафталины, хлорированные ароматические соединения или хлорированные алифатические углеводороды, такие как хлорбензолы, хлорэтилены или метиленхлорид), спирты и полиолы (которые, при необходимости, могут также быть замещены, образовывать простой и/или сложный эфир, такой как этанол, пропанол, бутанол, бензиловый спирт, циклогексано́л или глико́ль), кетоны (такие как ацетон, метилэтилкетон, метилизобутилкетон или циклогексанон), сложные эфиры (включая жиры и масла) и (поли)эфиры, незамещенные и замещенные амины, амиды (такие как диметилформамид или амиды жирных кислот), или их эфиры, лактамы (такие как N-алкилпирролидоны, в частности, N-метилпирролидон) и лактоны, сульфоны и

сульфоксиды (такие как диметилсульфоксид), масла растительного или животного происхождения. Носителем также может являться сжиженный газовый разбавитель т.е. жидкость, которая при обычной температуре и обычном давлении находится в газообразном состоянии, например, аэрозольные пропелленты, такие как галогенуглеводороды, бутан, пропан, азот и диоксид углерода.

Предпочтительные твердые носители выбирают из глин, талька и кремнезема.

Предпочтительные жидкие носители выбирают из воды, амидов жирных кислот и их сложных эфиров, ароматических и неароматических углеводородов, лактамов и сложных эфиров угольной кислоты.

Количество носителя, как правило, находится в диапазоне 1 - 99,99%, предпочтительно 5 - 99,9%, более предпочтительно 10 - 99,5%, наиболее предпочтительно 20 - 99 мас.% композиции.

Жидкие носители обычно присутствуют в диапазоне 20 - 90%, например, 30 - 80 мас.% композиции.

Твердые носители обычно присутствуют в диапазоне 0 - 50%, около 5 - 45%, например, 10 - 30 мас.% композиции.

Если композиция содержит два или более носителей, то указанные диапазоны относятся к общему количеству носителей.

Поверхностно-активное вещество может представлять собой ионное (катионное или анионное), амфотерное или неионное поверхностно-активное вещество, такое как ионный или неионный эмульгатор(-ы), пенообразователь(-и), диспергатор(-ы), смачивающий агент(-ы), усилитель(-и) всасывания и любые их смеси. Примеры подходящих поверхностно-активных веществ включают, но не ограничиваются ими, соли полиакриловой кислоты, соли лигносульфокислоты (такие как лигносульфонат натрия), соли фенолсульфокислоты или нафталинсульфокислоты, поликонденсаты этиленоксида и/или пропиленоксида с жирными спиртами, жирными кислотами или жирными аминами (например, полиоксиэтиленовые эфиры жирных кислот, такие как этоксилат касторового масла, полиоксиэтиленовые эфиры жирных спиртов, например, алкиларилполигликолевые эфиры), замещенные фенолы (предпочтительно алкилфенолы или арилфенолы) и их этоксилаты (такие как

тристирилфенолэтоксилат), соли сложных эфиров сульфоянтарной кислоты, производные таурина (предпочтительно алкилтаураты), фосфорные эфиры полиэтиоксилированных спиртов или фенолов, жирные эфиры полиолов (например, эфиры жирных кислот глицерина, сорбита или сахарозы), сульфаты (такие как алкилсульфаты и алкилэфирсульфаты), сульфонаты (например, алкилсульфонаты, арилсульфонаты и алкилбензолсульфонаты), эфиры фосфорной кислоты, гидролизаты белков, лигносульфитные отработанные растворы и метилцеллюлоза. Любая ссылка на соли в этом абзаце относится предпочтительно к соответствующим солям щелочных, щелочноземельных металлов и аммония.

Предпочтительные поверхностно-активные вещества выбирают из полиоксиэтиленовых эфиров жирных спиртов, полиоксиэтиленовых эфиров жирных кислот, алкилбензолсульфонатов, таких как соединение додецилбензолсульфоната, этоксилата касторового масла, натрийлигносульфоната и арилфенол этоксилатов, таких как тристирилфенол этоксилат.

Количество поверхностно-активных веществ обычно составляет 5 - 40%, например, 10 - 20 мас.% композиции.

Другие примеры соответствующих вспомогательных веществ включают водоотталкивающие агенты, сиккативы, связующие вещества (адгезив, средство для повышения клейкости, фиксирующий агент, такой как карбоксиметилцеллюлоза, природные и синтетические полимеры в виде порошков, гранул или латексов, такие как гуммиарабик, поливиниловый спирт и поливинилацетат, натуральные фосфолипиды, такие как кефалины и лецитины, и синтетические фосфолипиды, поливинилпирролидон и тилоза), загустители и вторичные загустители (такие как эфиры целлюлозы, производные акриловой кислоты, ксантановая камедь, модифицированные глины, например, продукты, доступные под названием Bentone, и мелкодисперсный диоксид кремния), стабилизаторы (например, холодовые стабилизаторы, консерванты (например, дихлорфен и гемиформаль бензилового спирта), антиоксиданты, светостабилизаторы, в частности УФ-стабилизаторы или другие вещества, повышающие химическую и/или физическую стабильность), красители или пигменты (такие как неорганические пигменты, например, оксид железа, оксид титана и берлинская лазурь; органические красители, например, ализарин, азо и металлические фталоцианиновые красители), антивспениватели (например,

силиконовые пеногасители и стеарат магния), антифризы, клеящие вещества, гиббереллины и технологические вспомогательные вещества, минеральные и растительные масла, отдушки, воски, питательные вещества (в том числе микроэлементы, такие как соли железа, марганца, бора, меди, кобальта, молибдена и цинка), защитные коллоиды, тиксотропные вещества, пенетранты, секвестры и комплексообразователи.

Выбор вспомогательных веществ зависит от предполагаемого способа применения соединения формулы (I) и/или от физических свойств соединения(й). Кроме того, вспомогательные вещества могут быть выбраны таким образом, чтобы придать определенные свойства (технические, физические и/или биологические свойства) композициям или формам для использования, полученным из таких соединений. Путем выбора соответствующих вспомогательных веществ можно изготавливать композиции в зависимости от конкретных потребностей.

Композиция по изобретению может предоставляться конечному пользователю в виде препарата, готового к применению, т.е. композиции могут наноситься непосредственно на растения или семена с помощью подходящего устройства, такого как опрыскиватель или распылитель. В качестве альтернативы, композиции могут предоставляться конечному пользователю в виде концентратов, которые перед использованием необходимо разбавлять, предпочтительно водой.

Композиция по изобретению может быть приготовлена обычными способами, например, путем смешивания соединения формулы (I) с одним или более соответствующими вспомогательными веществами, такими как вещества, описанные в настоящем документе выше.

Композиция содержит фунгицидно эффективное количество соединения(й) формулы (I). Под термином «эффективное количество» понимается количество, достаточное для борьбы с вредными грибами на культурных растениях или для защиты материалов, а также не вызывающее существенного повреждения обработанных растений. Такое количество может варьироваться в широком диапазоне и зависит от различных факторов, таких как виды подлежащих контролю грибов, обрабатываемое культивируемое растение или материал, климатические условия и конкретное используемое соединение формулы (I). Как правило, композиция согласно изобретению содержит 0,01 - 99 мас.%, около 0,05 - 98 мас.%,

более предпочтительно 0,1 - 95 мас.%, еще более предпочтительно 0,5 - 90 мас.%, наиболее предпочтительно 1 - 80 мас.% соединения формулы (I). Композиция может содержать два или более соединений по изобретению. В этом случае указанные диапазоны относятся к общему количеству соединений по настоящему изобретению.

Композиция по изобретению может быть в любой обычной форме, такой как растворы (например, водный раствор), эмульсия, суспензия на водной или масляной основе, порошок (например, смачиваемый порошок, растворимый порошок), пылевидный препарат, паста, гранулы (например, растворимые гранулы, гранулы для разбросного внесения), концентраты суспензии, натуральные или синтетические продукты, пропитанные соединением формулы (I), удобрения, а также микрокапсуляции в полимерных веществах. Соединение формулы (I) может присутствовать в форме суспензии, эмульсии или раствора. Примерами конкретных подходящих типов композиций являются растворы, водорастворимые концентраты (например, SL, LS), диспергируемые концентраты (DC), суспензии и суспензионные концентраты (например, SC, OD, OF, FS), эмульгируемые концентраты (например, EC), эмульсии (например, EW, EO, ES, ME, SE), капсулы (например, CS, ZC), пасты, пастилки, смачивающиеся порошки или дусты (например, WP, SP, WS, DP, DS), прессовое сусло (например, BR, TB, DT), гранулы (например, WG, SG, GR, FG, GG, MG), инсектицидные изделия (например, LN), а также гелевые составы для обработки материалов для размножения растений, таких как семена (например, GW, GF). Эти и другие типы композиций определены Продовольственной и сельскохозяйственной организацией Объединенных Наций (FAO). Обзор приводится в «Каталоге видов лекарственных форм пестицидов и международной системы кодирования», Техническая монография № 2, 6-е изд. май 2008 г., Croplife International.

Предпочтительно, композиция по изобретению находится в форме одного из следующих типов: EC, SC, FS, SE, OD и WG, более предпочтительно EC, SC, OD и WG.

Дополнительная подробная информация о примерах типов композиций и их приготовлении приводится ниже. Если присутствуют два или более соединений по настоящему изобретению, указанное количество соединений по настоящему изобретению относится к общему количеству соединений по настоящему изобретению.

изобретению. С соответствующими изменениями это применимо к любому дополнительному компоненту композиции, если присутствуют два или более представителей такого компонента, например, увлажняющий реагент или связующее вещество.

i) Водорастворимые концентраты (SL, LS)

10-60 мас.%, по меньшей мере, одного соединения формулы (I) и 5-15 мас.% поверхностно-активного вещества (например, полиоксиэтиленового эфира жирного спирта) растворяют в таком количестве воды и/или водорастворимого растворителя (например, спирты, такие как пропилен гликоль, или карбонаты, такие как пропиленкарбонат), чтобы общее количество составляло 100 мас.%. Перед применением концентрат разбавляют водой.

ii) Диспергируемые концентраты (DC)

5-25 мас.%, по меньшей мере, одного соединения формулы (I) и 1-10 мас.% поверхностно-активного вещества и/или связующего вещества (например, поливинилпирролидона) растворяют в таком количестве органического растворителя (например, циклогексанона), чтобы общее количество составляло 100 мас.%. Разбавление водой приводит к дисперсии.

iii) Эмульгируемые концентраты (EC)

15-70 мас.%, по меньшей мере, одного соединения формулы (I) и 5-10 мас.% поверхностно-активного вещества (например, смеси додецилбензолсульфоната кальция и этоксилата касторового масла) растворяют в таком количестве нерастворимого в воде органического растворителя (например, ароматического углеводорода или амида жирной кислоты) и, при необходимости, дополнительного водорастворимого растворителя, чтобы общее количество составляло 100 мас.%. Разбавление водой приводит к эмульсии.

iv) Эмульсии (EW, EO, ES)

5-40 мас.%, по меньшей мере, одного соединения формулы (I) и 1-10 мас.% поверхностно-активного вещества (например, смеси додецилбензолсульфоната кальция и этоксилата касторового масла) растворяют в 20-40 мас.% нерастворимого в воде органического растворителя (например, ароматического углеводорода). Эту смесь с помощью эмульгатора добавляют к такому количеству

воды, чтобы общее количество составляло 100 мас.%. Полученная композиция представляет собой гомогенную эмульсию. Перед применением эмульсию можно дополнительно разбавить водой.

v) Суспензии и суспензионные концентраты

v-1) На водной основе (SC, FS)

В подходящем оборудовании для измельчения, например, в шаровой мельнице с мешалкой, 20-60 мас.%, по меньшей мере, одного соединения формулы (I) измельчают с добавлением 2-10 мас.% поверхностно-активного вещества (например, лигносульфоната натрия и эфира полиоксиэтиленового жирного спирта), 0,1-2 мас.% загустителя (например, ксантановой камеди) и воды до получения тонкодисперсной суспензии действующего вещества. Воду добавляют в таком количестве, чтобы общее количество составляло 100 мас.%. При разбавлении водой получается стабильная суспензия активного вещества. Для композиций типа FS добавляют до 40 мас.% связующего вещества (например, поливинилового спирта).

v-2) На масляной основе (OD, OF)

В подходящем оборудовании для измельчения, например, в шаровой мельнице с мешалкой, 20-60 мас.%, по меньшей мере, одного соединения формулы (I) измельчают с добавлением 2-10 мас.% поверхностно-активного вещества (например, лигносульфоната натрия и эфира полиоксиэтиленового жирного спирта), 0,1-2 мас.% загустителя (например, модифицированной глины, в частности, бентона или кремнезема) и воды до получения тонкодисперсной масляной суспензии действующего вещества. Органический носитель добавляют в таком количестве, чтобы общее количество составляло 100 мас.%. При разбавлении водой получается стабильная дисперсия активного вещества.

vi) Диспергируемые и растворимые в воде гранулы (WG, SG)

50-80 мас.%, по меньшей мере, одного соединения формулы (I) тонко измельчают с добавлением поверхностно-активного вещества (например, лигносульфоната натрия и эфира жирного спирта полиоксиэтилена) и превращают в диспергируемые или растворимые в воде гранулы с помощью технических средств (например, экструзия, распылительная башня, псевдоожиженный слой). ПАВ используется в таком количестве, чтобы общее количество составляло 100

мас.%. При разбавлении водой получается стабильная дисперсия или раствор активных веществ.

vii) Диспергируемые и растворимые в воде порошки (WP, SP, WS)

50-80 мас.%, по меньшей мере, одного соединения формулы (I) измельчают в роторно-статорной мельнице с добавлением 1-8 мас.% поверхностно-активного вещества (например, натрий лигносульфоната, эфира полиоксиэтилена жирного спирта) и такого количества твердого носителя, например, силикагеля, чтобы общее количество составляло 100 мас.%. При разбавлении водой получается стабильная дисперсия или раствор активных веществ.

viii) Гель (GW, GF)

В шаровой мельнице с мешалкой измельчают 5-25 мас.%, по меньшей мере, одного соединения формулы (I) с добавлением 3-10 мас.% поверхностно-активного вещества (например, лигносульфоната натрия), 1-5 мас.% связующего вещества (например, карбоксиметилцеллюлозы) и такое количество воды, чтобы общее количество составляло 100 мас.%. В результате получается тонкая суспензия активного вещества. При разбавлении водой получается стабильная суспензия активного вещества.

ix) Микроэмульсия (ME)

5-20 мас.%, по меньшей мере, одного соединения формулы (I) добавляют к 5-30 мас.% смеси органических растворителей (например, диметиламида жирной кислоты и циклогексанона), 10-25 мас.% смеси поверхностно-активных веществ (например, эфира полиоксиэтилена жирного спирта и арилфенола этоксилата) и такое количество воды, чтобы общее количество составляло 100 мас.%. Эту смесь перемешивают в течение 1 часа, в результате чего самопроизвольно получается термодинамически стабильная микроэмульсия.

x) Микрокапсулы (CS)

Масляную фазу, содержащая 5-50 мас.%, по меньшей мере, одного соединения формулы (I), 0-40 мас.% нерастворимого в воде органического растворителя (например, ароматического углеводорода), 2-15 мас.% акриловых мономеров (например, метилметакрилата, метакрилатовой кислоты и ди- или триакрилата), диспергируют в водном растворе защитного коллоида (например,

поливинилового спирта). В результате радикальной полимеризации, инициированной радикальным инициатором, образуются микрокапсулы поли(мет)акрилата. В качестве альтернативы, масляную фазу, содержащую 5-50 мас.%, по меньшей мере, одного соединения формулы (I), 0-40 мас.% нерастворимого в воде органического растворителя (например, ароматического углеводорода) и изоцианатный мономер (например, дифенилметен-4,4'-диизоцианаты) диспергируют в водном растворе защитного коллоида (например, поливинилового спирта). Добавление полиамина (например, гексаметилендиамина) приводит к образованию микрокапсул полимочевины. Мономеры составляют 1-10 мас.% от всего состава микрокапсул.

xi) Пылеобразные порошки (DP, DS)

1-10 мас.%, по меньшей мере, одного соединения формулы (I) тонко измельчают и тщательно смешивают с таким количеством твердого носителя, например, мелкодисперсного каолина, чтобы общее количество составляло 100 мас.%.

xii) Гранулы (GR, FG)

0,5-30 мас.%, по меньшей мере, одного соединения формулы (I) тонко измельчают и объединяют с таким количеством твердого носителя (например, силиката), чтобы общее количество составляло 100 мас.%. Гранулирование обеспечивается за счет экструзии, сушки распылением или использованием псевдооживленного слоя.

xiii) Жидкости сверхмалого объема (UL)

1-50 мас.%, по меньшей мере, одного соединения формулы (I) растворяют в таком количестве органического растворителя (например, ароматического углеводорода), чтобы общее количество составляло 100 мас.%.

Композиции типов от i) до xiii), при необходимости, могут содержать дополнительные вспомогательные вещества, такие как 0,1-1 мас.% консервантов, 0,1-1 мас.% пеногасителей, 0,1-1 мас.% красителей и/или пигментов и 5-10 мас.% антифризов.

Смеси/Комбинации

Соединение формулы (I) и композиция по изобретению могут смешиваться с другими активными ингредиентами, такими как фунгициды, бактерициды, акарициды, нематоциды, инсектициды, агенты биологической борьбы или гербициды. Также возможны смеси с удобрениями, регуляторами роста, антидотами, ингибиторами нитрификации, семиохимикатами и/или другими полезными для сельского хозяйства веществами. Это может позволить расширить спектр активности или предотвратить развитие устойчивости. Примеры известных фунгицидов, инсектицидов, акарицидов, нематоцидов и бактерицидов раскрыты в Руководстве по пестицидам, 17-е издание.

К примерам фунгицидов, которые можно смешивать с соединением формулы (I) и композицией по изобретению, можно отнести следующие:

1) ингибиторы биосинтеза эргостерола, например, (1.001) ципроконазол, (1.002) дифеноконазол, (1.003) эпоксиконазол, (1.004) фенгексамид, (1.005) фенпропидин, (1.006) фенпропиморф, (1.007) фенпиразамин, (1.008) флуквинконазол, (1.009) флутриафол, (1.010) имазалил, (1.011) имазалил сульфат, (1.012) ипконазол, (1.013) метконазол, (1.014) миклобутанил, (1.015) паклобутразол, (1.016) прохлораз, (1.017) пропиконазол, (1.018) протиоконазол, (1.019) пиризоксазол, (1.020) спироксамин, (1.021) тебуконазол, (1.022) тетраконазол, (1.023) триадименол, (1.024) тридеморф, (1.025) тритиконазол, (1.026) (1R,2S,5S)-5-(4-хлорбензил)-2-(хлорметил)-2-метил-1-(1H-1,2,4-триазол-1-илметил)циклопентанол, (1.027) (1S,2R,5R)-5-(4-хлорбензил)-2-(хлорметил)-2-метил-1-(1H-1,2,4-триазол-1-илметил)циклопентанол, (1.028) (2R)-2-(1-хлорциклопропил)-4-[(1R)-2,2-дихлорциклопропил]-1-(1H-1,2,4-триазол-1-ил)бутан-2-ол, (1.029) (2R)-2-(1-хлорциклопропил)-4-[(1S)-2,2-дихлорциклопропил]-1-(1H-1,2,4-триазол-1-ил)бутан-2-ол, (1.030) (2R)-2-[4-(4-хлорфенокси)-2-(трифторметил)фенил]-1-(1H-1,2,4-триазол-1-ил)пропан-2-ол, (1.031) (2S)-2-(1-хлорциклопропил)-4-[(1R)-2,2-дихлорциклопропил]-1-(1H-1,2,4-триазол-1-ил)бутан-2-ол, (1.032) (2S)-2-(1-хлорциклопропил)-4-[(1S)-2,2-дихлорциклопропил]-1-(1H-1,2,4-триазол-1-ил)бутан-2-ол, (1.033) (2S)-2-[4-(4-хлорфенокси)-2-(трифторметил)фенил]-1-(1H-1,2,4-триазол-1-ил)пропан-2-ол, (1.034) (R)-[3-(4-хлор-2-фторфенил)-5-(2,4-дифторфенил)-1,2-оксазол-4-ил](пиридин-3-ил)метанол, (1.035) (S)-[3-(4-хлор-2-фторфенил)-5-(2,4-дифторфенил)-1,2-оксазол-4-ил](пиридин-3-ил)метанол, (1.036)

[3-(4-хлор-2-фторфенил)-5-(2,4-дифторфенил)-1,2-оксазол-4-ил](пиридин-3-ил)метанол, (1.037) 1-({(2R,4S)-2-[2-хлор-4-(4-хлорфенокси)фенил]-4-метил-1,3-диоксолан-2-ил} метил)-1H-1,2,4-триазол, (1.038) 1-({(2S,4S)-2-[2-хлор-4-(4-хлорфенокси)фенил]-4-метил-1,3-диоксолан-2-ил} метил)-1H-1,2,4-триазол, (1.039) 1-{[3-(2-хлорфенил)-2-(2,4-дифторфенил)оксиран-2-ил]метил}-1H-1,2,4-триазол-5-ил тиоцианат, (1.040) 1-{[rel(2R,3R)-3-(2-хлорфенил)-2-(2,4-дифторфенил)оксиран-2-ил]метил}-1H-1,2,4-триазол-5-ил тиоцианат, (1.041) 1-{[rel(2R,3S)-3-(2-хлорфенил)-2-(2,4-дифторфенил)оксиран-2-ил]метил}-1H-1,2,4-триазол-5-ил тиоцианат, (1.042) 2-[(2R,4R,5R)-1-(2,4-дихлорфенил)-5-гидрокси-2,6,6-триметилгептан-4-ил]-2,4-дигидро-3H-1,2,4-триазол-3-тион, (1.043) 2-[(2R,4R,5S)-1-(2,4-дихлорфенил)-5-гидрокси-2,6,6-триметилгептан-4-ил]-2,4-дигидро-3H-1,2,4-триазол-3-тион, (1.044) 2-[(2R,4S,5R)-1-(2,4-дихлорфенил)-5-гидрокси-2,6,6-триметилгептан-4-ил]-2,4-дигидро-3H-1,2,4-триазол-3-тион, (1.045) 2-[(2R,4S,5S)-1-(2,4-дихлорфенил)-5-гидрокси-2,6,6-триметилгептан-4-ил]-2,4-дигидро-3H-1,2,4-триазол-3-тион, (1.046) 2-[(2S,4R,5R)-1-(2,4-дихлорфенил)-5-гидрокси-2,6,6-триметилгептан-4-ил]-2,4-дигидро-3H-1,2,4-триазол-3-тион, (1.047) 2-[(2S,4R,5S)-1-(2,4-дихлорфенил)-5-гидрокси-2,6,6-триметилгептан-4-ил]-2,4-дигидро-3H-1,2,4-триазол-3-тион, (1.048) 2-[(2S,4S,5R)-1-(2,4-дихлорфенил)-5-гидрокси-2,6,6-триметилгептан-4-ил]-2,4-дигидро-3H-1,2,4-триазол-3-тион, (1.049) 2-[(2S,4S,5S)-1-(2,4-дихлорфенил)-5-гидрокси-2,6,6-триметилгептан-4-ил]-2,4-дигидро-3H-1,2,4-триазол-3-тион, (1.050) 2-[1-(2,4-дихлорфенил)-5-гидрокси-2,6,6-триметилгептан-4-ил]-2,4-дигидро-3H-1,2,4-триазол-3-тион, (1.051) 2-[2-хлор-4-(2,4-дихлорфенокси)фенил]-1-(1H-1,2,4-триазол-1-ил)пропан-2-ол, (1.052) 2-[2-хлор-4-(4-хлорфенокси)фенил]-1-(1H-1,2,4-триазол-1-ил)бутан-2-ол, (1.053) 2-[4-(4-хлорфенокси)-2-(трифторметил)фенил]-1-(1H-1,2,4-триазол-1-ил)бутан-2-ол, (1.054) 2-[4-(4-хлорфенокси)-2-(трифторметил)фенил]-1-(1H-1,2,4-триазол-1-ил)пентан-2-ол, (1.055) мефентрифлуконазол, (1.056) 2-{[3-(2-хлорфенил)-2-(2,4-дифторфенил)оксиран-2-ил]метил}-2,4-дигидро-3H-1,2,4-триазол-3-тион, (1.057) 2-{[rel(2R,3R)-3-(2-хлорфенил)-2-(2,4-дифторфенил)оксиран-2-ил]метил}-2,4-дигидро-3H-1,2,4-триазол-3-тион, (1.058) 2-{[rel(2R,3S)-3-(2-хлорфенил)-2-(2,4-дифторфенил)оксиран-2-ил]метил}-2,4-дигидро-3H-1,2,4-триазол-3-тион, (1.059) 5-(4-хлорбензил)-2-(хлорметил)-2-метил-1-(1H-1,2,4-триазол-1-ил)метилциклопентанол, (1.060) 5-(аллилсульфанил)-1-{[3-(2-хлорфенил)-2-(2,4-дифторфенил)оксиран-2-ил]метил}-1H-1,2,4-триазол, (1.061) 5-(аллилсульфанил)-

1-{[rel(2R,3R)-3-(2-хлорфенил)-2-(2,4-дифторфенил)оксиран-2-ил]метил}-1H-1,2,4-триазол, (1.062) 5-(аллилсульфанил)-1-{[rel(2R,3S)-3-(2-хлорфенил)-2-(2,4-дифторфенил)оксиран-2-ил]метил}-1H-1,2,4-триазол, (1.063) N'-(2,5-диметил-4-{[3-(1,1,2,2-тетрафторэтоксифенил)сульфанил}фенил)-N-этил-N-метилимидоформамид, (1.064) N'-(2,5-диметил-4-{[3-(2,2,2-трифторэтоксифенил)сульфанил}фенил)-N-этил-N-метилимидоформамид, (1.065) N'-(2,5-диметил-4-{[3-(2,2,3,3-тетрафторпропоксифенил)сульфанил}фенил)-N-этил-N-метилимидоформамид, (1.066) N'-(2,5-диметил-4-{[3-(пентафторэтоксифенил)сульфанил}фенил)-N-этил-N-метилимидоформамид, (1.067) N'-(2,5-диметил-4-{3-[(1,1,2,2-тетрафторэтил)сульфанил]феноксифенил)-N-этил-N-метилимидоформамид, (1.068) N'-(2,5-диметил-4-{3-[(2,2,2-трифторэтил)сульфанил]феноксифенил)-N-этил-N-метилимидоформамид, (1.069) N'-(2,5-диметил-4-{3-[(2,2,3,3-тетрафторпропил)сульфанил]феноксифенил)-N-этил-N-метилимидоформамид, (1.070) N'-(2,5-диметил-4-{3-[(пентафторэтил)сульфанил]феноксифенил)-N-этил-N-метилимидоформамид, (1.071) N'-(2,5-диметил-4-феноксифенил)-N-этил-N-метилимидоформамид, (1.072) N'-(4-{[3-(дифторметокси)фенил]сульфанил}-2,5-диметилфенил)-N-этил-N-метилимидоформамид, (1.073) N'-(4-{3-[(дифторметил)сульфанил]феноксифенил}-2,5-диметилфенил)-N-этил-N-метилимидоформамид, (1.074) N'-[5-бром-6-(2,3-дигидро-1H-инден-2-илокси)-2-метилпиридин-3-ил]-N-этил-N-метилимидоформамид, (1.075) N'-{4-[(4,5-дихлор-1,3-тиазол-2-ил)окси]-2,5-диметилфенил}-N-этил-N-метилимидоформамид, (1.076) N'-{5-бром-6-[(1R)-1-(3,5-дифторфенил)этокси]-2-метилпиридин-3-ил}-N-этил-N-метилимидоформамид, (1.077) N'-{5-бром-6-[(1S)-1-(3,5-дифторфенил)этокси]-2-метилпиридин-3-ил}-N-этил-N-метилимидоформамид, (1.078) N'-{5-бром-6-[(цис-4-изопропилциклогексил)окси]-2-метилпиридин-3-ил}-N-этил-N-метилимидоформамид, (1.079) N'-{5-бром-6-[(транс-4-изопропилциклогексил)окси]-2-метилпиридин-3-ил}-N-этил-N-метилимидоформамид, (1.080) N'-{5-бром-6-[1-(3,5-дифторфенил)этокси]-2-метилпиридин-3-ил}-N-этил-N-метилимидоформамид, (1.081) ипфентрифлуконазол, (1.082) 2-[4-(4-хлорфеноксифенил)-2-(трифторметил)фенил]-1-(1H-1,2,4-триазол-1-ил)пропан-2-ол, (1.083) 2-[6-(4-бромфеноксифенил)-2-(трифторметил)-3-пиридил]-1-(1,2,4-триазол-1-ил)пропан-2-ол, (1.084) 2-[6-(4-хлорфеноксифенил)-2-(трифторметил)-3-пиридил]-1-(1,2,4-триазол-1-ил)пропан-2-ол,

(1.085) 3-[2-(1-хлорциклопропил)-3-(3-хлор-2-фтор-фенил)-2-гидрокси-пропил]имидазол-4-карбонитрил, (1.086) 4-[[6-[гас-(2R)-2-(2,4-дифторфенил)-1,1-дифтор-2-гидрокси-3-(5-тиоксо-4Н-1,2,4-триазол-1-ил)пропил]-3-пиридил]окси]бензонитрил, (1.087) N-изопропил-N'-[5-метокси-2-метил-4-(2,2,2-трифтор-1-гидрокси-1-фенилэтил)фенил]-N-метилимидоформаид, (1.088) N'-{5-бром-2-метил-6-[(1-пропоксипропан-2-ил)окси]пиридин-3-ил}-N-этил-N-метилимидоформаид, (1.089) гексаконазол, (1.090) пенконазол, (1.091) фенбуконазол, (1.092) метил 2-[2-хлор-4-(4-хлорфенокси)фенил]-2-гидрокси-3-(1,2,4-триазол-1-ил)пропаноат.

2) Ингибиторы дыхательной цепи в комплексе I или II, например, (2.001) бензовиндифлупир, (2.002) биксафен, (2.003) боскалид, (2.004) карбоксин, (2.005) флуопирам, (2.006) флутоланил, (2.007) флюксапироксад, (2.008) фураметпир, (2.009) Изофетамид, (2.010) изопиразам (анти-эпимерный энантиомер 1R,4S,9S), (2.011) изопиразам (анти-эпимерный энантиомер 1S,4R,9R), (2.012) изопиразам (анти-эпимерный рацемат 1RS,4SR,9SR), (2.013) изопиразам (смесь син-эпимерного рацемата 1RS,4SR,9RS и анти-эпимерного рацемата 1RS,4SR,9SR), (2.014) изопиразам (син-эпимерный энантиомер 1R,4S,9R), (2.015) изопиразам (син-эпимерный энантиомер 1S,4R,9S), (2.016) изопиразам (син-эпимерный рацемат 1RS,4SR,9RS), (2.017) пенфлуфен, (2.018) пентиопирад, (2.019) пидифлуметофен, (2.020) Пиразифлумид, (2.021) седаксан, (2.022) 1,3-диметил-N-(1,1,3-триметил-2,3-дигидро-1H-инден-4-ил)-1H-пиразол-4-карбоксамид, (2.023) 1,3-диметил-N-[(3R)-1,1,3-триметил-2,3-дигидро-1H-инден-4-ил]-1H-пиразол-4-карбоксамид, (2.024) 1,3-диметил-N-[(3S)-1,1,3-триметил-2,3-дигидро-1H-инден-4-ил]-1H-пиразол-4-карбоксамид, (2.025) 1-метил-3-(трифторметил)-N-[2'-(трифторметил)бифенил-2-ил]-1H-пиразол-4-карбоксамид, (2.026) 2-фтор-6-(трифторметил)-N-(1,1,3-триметил-2,3-дигидро-1H-инден-4-ил)бензамид, (2.027) 3-(дифторметил)-1-метил-N-(1,1,3-триметил-2,3-дигидро-1H-инден-4-ил)-1H-пиразол-4-карбоксамид, (2.028) инпирфлуксам, (2.029) 3-(дифторметил)-1-метил-N-[(3S)-1,1,3-триметил-2,3-дигидро-1H-инден-4-ил]-1H-пиразол-4-карбоксамид, (2.030) флуиндапир, (2.031) 3-(дифторметил)-N-[(3R)-7-фтор-1,1,3-триметил-2,3-дигидро-1H-инден-4-ил]-1-метил-1H-пиразол-4-карбоксамид, (2.032) 3-(дифторметил)-N-[(3S)-7-фтор-1,1,3-триметил-2,3-дигидро-1H-инден-4-ил]-1-метил-1H-пиразол-4-карбоксамид, (2.033) 5,8-дифтор-N-[2-(2-фтор-4-{[4-

(трифторметил)пиридин-2-ил]окси}фенил)этил]хиназолин-4-амин, (2.034) N-(2-циклопентил-5-фторбензил)-N-циклопропил-3-(дифторметил)-5-фтор-1-метил-1H-пиразол-4-карбоксамид, (2.035) N-(2-трет-бутил-5-метилбензил)-N-циклопропил-3-(дифторметил)-5-фтор-1-метил-1H-пиразол-4-карбоксамид, (2.036) N-(2-трет-бутилбензил)-N-циклопропил-3-(дифторметил)-5-фтор-1-метил-1H-пиразол-4-карбоксамид, (2.037) N-(5-хлор-2-этилбензил)-N-циклопропил-3-(дифторметил)-5-фтор-1-метил-1H-пиразол-4-карбоксамид, (2.038) изофлуципрам, (2.039) N-[(1R,4S)-9-(дихлорметилен)-1,2,3,4-тетрагидро-1,4-метанонафтален-5-ил]-3-(дифторметил)-1-метил-1H-пиразол-4-карбоксамид, (2.040) N-[(1S,4R)-9-(дихлорметилен)-1,2,3,4-тетрагидро-1,4-метанонафтален-5-ил]-3-(дифторметил)-1-метил-1H-пиразол-4-карбоксамид, (2.041) N-[1-(2,4-дихлорфенил)-1-метоксипропан-2-ил]-3-(дифторметил)-1-метил-1H-пиразол-4-карбоксамид, (2.042) N-[2-хлор-6-(трифторметил)бензил]-N-циклопропил-3-(дифторметил)-5-фтор-1-метил-1H-пиразол-4-карбоксамид, (2.043) N-[3-хлор-2-фтор-6-(трифторметил)бензил]-N-циклопропил-3-(дифторметил)-5-фтор-1-метил-1H-пиразол-4-карбоксамид, (2.044) N-[5-хлор-2-(трифторметил)бензил]-N-циклопропил-3-(дифторметил)-5-фтор-1-метил-1H-пиразол-4-карбоксамид, (2.045) N-циклопропил-3-(дифторметил)-5-фтор-1-метил-N-[5-метил-2-(трифторметил)бензил]-1H-пиразол-4-карбоксамид, (2.046) N-циклопропил-3-(дифторметил)-5-фтор-N-(2-фтор-6-изопропилбензил)-1-метил-1H-пиразол-4-карбоксамид, (2.047) N-циклопропил-3-(дифторметил)-5-фтор-N-(2-изопропил-5-метилбензил)-1-метил-1H-пиразол-4-карбоксамид, (2.048) N-циклопропил-3-(дифторметил)-5-фтор-N-(2-изопропилбензил)-1-метил-1H-пиразол-4-карботиоамид, (2.049) N-циклопропил-3-(дифторметил)-5-фтор-N-(2-изопропилбензил)-1-метил-1H-пиразол-4-карбоксамид, (2.050) N-циклопропил-3-(дифторметил)-5-фтор-N-(5-фтор-2-изопропилбензил)-1-метил-1H-пиразол-4-карбоксамид, (2.051) N-циклопропил-3-(дифторметил)-N-(2-этил-4,5-диметилбензил)-5-фтор-1-метил-1H-пиразол-4-карбоксамид, (2.052) N-циклопропил-3-(дифторметил)-N-(2-этил-5-фторбензил)-5-фтор-1-метил-1H-пиразол-4-карбоксамид, (2.053) N-циклопропил-3-(дифторметил)-N-(2-этил-5-метилбензил)-5-фтор-1-метил-1H-пиразол-4-карбоксамид, (2.054) N-циклопропил-N-(2-циклопропил-5-фторбензил)-3-(дифторметил)-5-фтор-1-метил-1H-пиразол-4-карбоксамид, (2.055) N-циклопропил-N-(2-циклопропил-5-метилбензил)-3-(дифторметил)-5-фтор-1-метил-1H-пиразол-4-карбоксамид, (2.056) N-

циклопропил-N-(2-циклопропилбензил)-3-(дифторметил)-5-фтор-1-метил-1H-пиразол-4-карбоксамид, (2.057) пирпропоин, (2.058) N-[rac-(1S,2S)-2-(2,4-дихлорфенил)циклобутил]-2-(трифторметил)никотинамид, (2.059) N-[(1S,2S)-2-(2,4-дихлорфенил)циклобутил]-2-(трифторметил)никотинамид, (2.060) флубентерам.

3) Ингибиторы дыхательной цепи в комплексе III, например, (3.001) аметоктрадин, (3.002) амисульбром, (3.003) азоксистробин, (3.004) коуметоксистробин, (3.005) коумоксистробин, (3.006) циазофамид, (3.007) димоксистробин, (3.008) эноксастробин, (3.009) фамоксадон, (3.010) фенамидон, (3.011) флуфеноксистробин, (3.012) флуоксастробин, (3.013) крезоксим-метил, (3.014) метоминостробин, (3.015) оризастробин, (3.016) пикоксистробин, (3.017) пираклостробин, (3.018) пираметостробин, (3.019) пираоксистробин, (3.020) трифлуксистробин, (3.021) (2E)-2-{2-[(1E)-1-(3-{(E)-1-фтор-2-фенилвинил]окси}фенил)этилиден]амино}окси)метил]фенил}-2-(метоксиимино)-N-метилацетамид, (3.022) (2E,3Z)-5-{[1-(4-хлорфенил)-1H-пиразол-3-ил]окси}-2-(метоксиимино)-N,3-диметилпент3-енамид, (3.023) (2R)-2-{2-[(2,5-диметилфенокси)метил]фенил}-2-метокси-N-метилацетамид, (3.024) (2S)-2-{2-[(2,5-диметилфенокси)метил]фенил}-2-метокси-N-метилацетамид, (3.025) фенпикоксамид, (3.026) мандестробин, (3.027) N-(3-этил-3,5,5-триметилциклогексил)-3-формамидо-2-гидроксибензамид, (3.028) (2E,3Z)-5-{[1-(4-хлор-2-фторфенил)-1H-пиразол-3-ил]окси}-2-(метоксиимино)-N,3-диметилпент3-енамид, (3.029) метил {5-[3-(2,4-диметилфенил)-1H-пиразол-1-ил]-2-метилбензил}карбамат, (3.030) метилтетрапрол, (3.031) флорилпикоксамид, (3.032) (2S,3S)-3-(о-толил)бутан-2-ил N-{[4-метокси-3-(пропаноилокси)-2-пиридил]карбонил}-L-аланинат.

4) Ингибиторы митоза и клеточного деления, например, (4.001) карбендазим, (4.002) диэтофенкарб, (4.003) этабоксам, (4.004) флуопиколоид, (4.005) пенцикурон, (4.006) тиабендазол, (4.007) тиофанат-метил, (4.008) зоксамид, (4.009) пиридахлометил, (4.010) 3-хлор-5-(4-хлорфенил)-4-(2,6-дифторфенил)-6-метилпиридазин, (4.011) 3-хлор-5-(6-хлорпиридин-3-ил)-6-метил-4-(2,4,6-трифторфенил)пиридазин, (4.012) 4-(2-бром-4-фторфенил)-N-(2,6-дифторфенил)-1,3-диметил-1H-пиразол-5-амин, (4.013) 4-(2-бром-4-фторфенил)-N-(2-бром-6-фторфенил)-1,3-диметил-1H-пиразол-5-амин, (4.014) 4-(2-бром-4-фторфенил)-N-

(2-бромфенил)-1,3-диметил-1Н-пиразол-5-амин, (4.015) 4-(2-бром-4-фторфенил)-N-(2-хлор-6-фторфенил)-1,3-диметил-1Н-пиразол-5-амин, (4.016) 4-(2-бром-4-фторфенил)-N-(2-хлорфенил)-1,3-диметил-1Н-пиразол-5-амин, (4.017) 4-(2-бром-4-фторфенил)-N-(2-фторфенил)-1,3-диметил-1Н-пиразол-5-амин, (4.018) 4-(2-хлор-4-фторфенил)-N-(2,6-дифторфенил)-1,3-диметил-1Н-пиразол-5-амин, (4.019) 4-(2-хлор-4-фторфенил)-N-(2-хлор-6-фторфенил)-1,3-диметил-1Н-пиразол-5-амин, (4.020) 4-(2-хлор-4-фторфенил)-N-(2-хлорфенил)-1,3-диметил-1Н-пиразол-5-амин, (4.021) 4-(2-хлор-4-фторфенил)-N-(2-фторфенил)-1,3-диметил-1Н-пиразол-5-амин, (4.022) 4-(4-хлорфенил)-5-(2,6-дифторфенил)-3,6-диметилпиридазин, (4.023) N-(2-бром-6-фторфенил)-4-(2-хлор-4-фторфенил)-1,3-диметил-1Н-пиразол-5-амин, (4.024) N-(2-бромфенил)-4-(2-хлор-4-фторфенил)-1,3-диметил-1Н-пиразол-5-амин, (4.025) N-(4-хлор-2,6-дифторфенил)-4-(2-хлор-4-фторфенил)-1,3-диметил-1Н-пиразол-5-амин, (4.026) флуопимомид.

5) Соединения, способные иметь мультисайтовое действие, например, (5.001) бордосская жидкость, (5.002) каптафол, (5.003) каптан, (5.004) хлорталонил, (5.005) гидроксид меди, (5.006) нафтенат меди, (5.007) оксид меди, (5.008) оксихлорид меди, (5.009) меди(2+) сульфат, (5.010) дитианон, (5.011) додин, (5.012) фолпет, (5.013) манкозеп, (5.014) манеб, (5.015) метирам, (5.016) метирам цинк, (5.017) оксин-медь, (5.018) пропинеб, (5.019) сера и препараты серы, включая полисульфид кальция, (5.020) тирам, (5.021) зинеб, (5.022) зирам, (5.023) 6-этил-5,7-диоксо-6,7-дигидро-5Н-пирроло[3',4':5,6][1,4]дитиино[2,3-с][1,2]тиазол-3-карбонитрил.

6) Соединения, способные индуцировать защиту хозяина, например, (6.001) ацибензолар-S-метил, (6.002) изотианил, (6.003) пробеназол, (6.004) тиадинил.

7) Ингибиторы биосинтеза аминокислоты и/или белка, например, (7.001) ципродинил, (7.002) касугамицин, (7.003) касугамицин гидрохлорид гидрат, (7.004) окситетрациклин, (7.005) пириметанил, (7.006) 3-(5-фтор-3,3,4,4-тетраметил-3,4-дигидроизохинолин-1-ил)хинолин.

8) Ингибиторы производства АТФ, например, (8.001) силтиофам.

9) Ингибиторы синтеза клеточной стенки, например, (9.001) бентиаваликарб, (9.002) диметоморф, (9.003) флуморф, (9.004) ипроваликарб, (9.005) мандипропамид, (9.006) пириморф, (9.007) валифеналат, (9.008) (2E)-3-(4-трет-

бутилфенил)-3-(2-хлорпиридин-4-ил)-1-(морфолин-4-ил)проп-2-ен-1-он, (9.009) (2Z)-3-(4-трет-бутилфенил)-3-(2-хлорпиридин-4-ил)-1-(морфолин-4-ил)проп-2-ен-1-он.

10) Ингибиторы синтеза липидов и мембран, например, (10.001) пропамокарб, (10.002) пропамокарб гидрохлорид, (10.003) толклофос-метил.

11) Ингибиторы биосинтеза меланина, например, (11.001) трициклазол, (11.002) толпрокарб.

12) Ингибиторы синтеза нуклеиновых кислот, например, (12.001) беналаксил, (12.002) беналаксил-М (киралаксил), (12.003) металаксил, (12.004) металаксил-М (мефеноксам).

13) Ингибиторы сигнальной трансдукции, например, (13.001) флудиоксонил, (13.002) ипродион, (13.003) процимидон, (13.004) проквиназид, (13.005) хиноксифен, (13.006) винклозолин.

14) Соединения, способные действовать как разобщитель, например, (14.001) флуазилам, (14.002) мептилдинокап.

15) Дополнительные фунгициды, выбранные из группы, состоящей из (15.001) абсцизовой кислоты, (15.002) бентиазола, (15.003) бетоксазина, (15.004) капсимицина, (15.005) карвона, (15.006) хинометионата, (15.007) куфранеба, (15.008) цифлуфенамида, (15.009) цимоксанила, (15.010) ципросульфамида, (15.011) флутианила, (15.012) фосетил-алюминия, (15.013) фосетил-кальция, (15.014) фосетил-натрия, (15.015) метил изотиоцианата, (15.016) метрафенона, (15.017) милдиомицина, (15.018) натамицина, (15.019) диметилдитиокарбамата никеля, (15.020) нитротал-изопропила, (15.021) оксамокарба, (15.022) оксатиапипролина, (15.023) оксифентиина, (15.024) пентахлорфенола и солей, (15.025) фосфорной кислоты и ее солей, (15.026) пропамокарб-фосетилата, (15.027) пириофенона (хлазафенона), (15.028) тебуфлоквина, (15.029) теклофалама, (15.030) толнифанида, (15.031) 1-(4-{4-[(5R)-5-(2,6-дифторфенил)-4,5-дигидро-1,2-оксазол-3-ил]-1,3-тиазол-2-ил}пиперидин-1-ил)-2-[5-метил-3-(трифторметил)-1Н-пиразол-1-ил]этанона, (15.032) 1-(4-{4-[(5S)-5-(2,6-дифторфенил)-4,5-дигидро-1,2-оксазол-3-ил]-1,3-тиазол-2-ил}пиперидин-1-ил)-2-[5-метил-3-(трифторметил)-1Н-пиразол-1-ил]этанона, (15.033) 2-(6-бензилпиридин-2-ил)хиназолина, (15.034) дипиметитрона, (15.035) 2-[3,5-бис(дифторметил)-1Н-пиразол-1-ил]-1-[4-(4-{5-[2-

(проп-2-ин-1-илокси)фенил]-4,5-дигидро-1,2-оксазол-3-ил}-1,3-тиазол-2-ил)пиперидин-1-ил]этанона, (15.036) 2-[3,5-бис(дифторметил)-1Н-пиразол-1-ил]-1-[4-(4-{5-[2-хлор-6-(проп-2-ин-1-илокси)фенил]-4,5-дигидро-1,2-оксазол-3-ил}-1,3-тиазол-2-ил)пиперидин-1-ил]этанона, (15.037) 2-[3,5-бис(дифторметил)-1Н-пиразол-1-ил]-1-[4-(4-{5-[2-фтор-6-(проп-2-ин-1-илокси)фенил]-4,5-дигидро-1,2-оксазол-3-ил}-1,3-тиазол-2-ил)пиперидин-1-ил]этанона, (15.038) 2-[6-(3-фтор-4-метоксифенил)-5-метилпиридин-2-ил]хиназолина, (15.039) 2-{(5R)-3-[2-(1-{[3,5-бис(дифторметил)-1Н-пиразол-1-ил]ацетил} пиперидин-4-ил)-1,3-тиазол-4-ил]-4,5-дигидро-1,2-оксазол-5-ил}-3-хлорфенил метансульфоната, (15.040) 2-{(5S)-3-[2-(1-{[3,5-бис(дифторметил)-1Н-пиразол-1-ил]ацетил} пиперидин-4-ил)-1,3-тиазол-4-ил]-4,5-дигидро-1,2-оксазол-5-ил}-3-хлорфенил метансульфоната, (15.041) ипфлуфеноквина, (15.042) 2-{2-фтор-6-[(8-фтор-2-метилхинолин-3-ил)окси]фенил}пропан-2-ола, (15.043) флуоксапипролина, (15.044) 2-{3-[2-(1-{[3,5-бис(дифторметил)-1Н-пиразол-1-ил]ацетил} пиперидин-4-ил)-1,3-тиазол-4-ил]-4,5-дигидро-1,2-оксазол-5-ил}фенил метансульфоната, (15.045) 2-фенилфенола и солей, (15.046) 3-(4,4,5-трифтор-3,3-диметил-3,4-дигидроизохинолин-1-ил)хинолина, (15.047) хинофумелина, (15.048) 4-амино-5-фторпиримидин-2-ола (таутомерная форма: 4-амино-5-фторпиримидин-2(1Н)-он), (15.049) 4-оксо-4-[(2-фенилэтил)амино]бутановой кислоты, (15.050) 5-амино-1,3,4-тиадиазол-2-тиола, (15.051) 5-хлор-N'-фенил-N'-(проп-2-ин-1-ил)тиофен-2-сульфоногидразида, (15.052) 5-фтор-2-[(4-фторбензил)окси]пиримидин-4-амина, (15.053) 5-фтор-2-[(4-метилбензил)окси]пиримидин-4-амина, (15.054) 9-фтор-2,2-диметил-5-(хинолин-3-ил)-2,3-дигидро-1,4-бензоксазепина, (15.055) бут-3-ин-ил {6-[[{(Z)-(1-метил-1Н-тетразол-5-ил)(фенил)метилен]амино}окси]метил]пиридин-2-ил}карбамата, (15.056) этил (2Z)-3-амино-2-циано-3-фенилакрилата, (15.057) феназин-1-карбоновой кислоты, (15.058) пропил 3,4,5-тригидроксibenzoата, (15.059) хинолин-8-ола, (15.060) хинолин-8-ол сульфата (2:1), (15.061) трет-бутил {6-[[{(1-метил-1Н-тетразол-5-ил)(фенил)метилен]амино}окси]метил]пиридин-2-ил}карбамата, (15.062) 5-фтор-4-имино-3-метил-1-[(4-метилфенил)сульфонил]-3,4-дигидропиримидин-2(1Н)-она, (15.063) аминопирифена, (15.064) (N'-[2-хлор-4-(2-фторфенокси)-5-метилфенил]-N-этил-N-метилимидоформамида), (15.065) (N'-(2-хлор-5-метил-4-феноксифенил)-N-этил-N-метилимидоформамида), (15.066) (2-{2-[7,8-дифтор-2-метилхинолин-3-ил)окси]-6-фторфенил}пропан-2-ола), (15.067) (5-бром-1-(5,6-диметилпиридин-3-ил)-3,3-диметил-3,4-дигидроизохинолина),

(15.068) (3-(4,4-дифтор-5,5-диметил-4,5-дигидротиено[2,3-с]пиридин-7-ил)хинолина), (15.069) (1-(4,5-диметил-1Н-бензимидазол-1-ил)-4,4-дифтор-3,3-диметил-3,4-дигидроизохинолина), (15.070) 8-фтор-3-(5-фтор-3,3-диметил-3,4-дигидроизохинолин-1-ил)хинолона, (15.071) 8-фтор-3-(5-фтор-3,3,4,4-тетраметил-3,4-дигидроизохинолин-1-ил)хинолона, (15.072) 3-(4,4-дифтор-3,3-диметил-3,4-дигидроизохинолин-1-ил)-8-фторхинолина, (15.073) (N-метил-N-фенил-4-[5-(трифторметил)-1,2,4-оксадиазол-3-ил]бензамида), (15.074) метил {4-[5-(трифторметил)-1,2,4-оксадиазол-3-ил]фенил}карбамата, (15.075) (N-{4-[5-(трифторметил)-1,2,4-оксадиазол-3-ил]бензил}циклопропанкарбоксамид), (15.076) N-метил-4-(5-(трифторметил)-1,2,4-оксадиазол-3-ил]бензамида, (15.077) N-[(E)-метоксииминометил]-4-[5-(трифторметил)-1,2,4-оксадиазол-3-ил]бензамида, (15.078) N-[(Z)-метоксииминометил]-4-[5-(трифторметил)-1,2,4-оксадиазол-3-ил]бензамида, (15.079) N-[4-[5-(трифторметил)-1,2,4-оксадиазол-3-ил]фенил]циклопропанкарбоксамид, (15.080) N-(2-фторфенил)-4-[5-(трифторметил)-1,2,4-оксадиазол-3-ил]бензамида, (15.081) 2,2-дифтор-N-метил-2-[4-[5-(трифторметил)-1,2,4-оксадиазол-3-ил]фенил]ацетамида, (15.082) N-аллил-N-[[4-[5-(трифторметил)-1,2,4-оксадиазол-3-ил]фенил]метил]ацетамида, (15.083) N-[(E)-N-метокси-С-метил-карбонимидоила]-4-(5-(трифторметил)-1,2,4-оксадиазол-3-ил]бензамида, (15.084) N-[(Z)-N-метокси-С-метил-карбонимидоила]-4-[5-(трифторметил)-1,2,4-оксадиазол-3-ил]бензамида, (15.085) N-аллил-N-[[4-[5-(трифторметил)-1,2,4-оксадиазол-3-ил]фенил]метил]пропанамида, (15.086) 4,4-диметил-1-[[4-[5-(трифторметил)-1,2,4-оксадиазол-3-ил]фенил]метил]пирролидин-2-она, (15.087) N-метил-4-[5-(трифторметил)-1,2,4-оксадиазол-3-ил]бензолкарботиоамида, (15.088) 5-метил-1-[[4-[5-(трифторметил)-1,2,4-оксадиазол-3-ил]фенил]метил]пирролидин-2-она, (15.089) N-((2,3-дифтор-4-[5-(трифторметил)-1,2,4-оксадиазол-3-ил]фенил]метил)-3,3,3-трифторпропанамида, (15.090) 1-метокси-1-метил-3-[[4-[5-(трифторметил)-1,2,4-оксадиазол-3-ил]фенил]метил]мочевины, (15.091) 1,1-диэтил-3-[[4-[5-(трифторметил)-1,2,4-оксадиазол-3-ил]фенил]метил]мочевины, (15.092) N-[[4-[5-(трифторметил)-1,2,4-оксадиазол-3-ил]фенил]метил]пропанамида, (15.093) N-метокси-N-[[4-[5-(трифторметил)-1,2,4-оксадиазол-3-ил]фенил]метил]циклопропанкарбоксамид, (15.094) 1-метокси-3-метил-1-[[4-[5-(трифторметил)-1,2,4-оксадиазол-3-ил]фенил]метил]мочевины, (15.095) N-метокси-N-[[4-[5-(трифторметил)-1,2,4-оксадиазол-3-

ил]фенил]метил]циклопропанкарбоксамида, (15.096) N,2-диметокси-N-[[4-[5-(трифторметил)-1,2,4-оксадиазол-3-ил]фенил]метил]пропанамида, (15.097) N-этил-2-метил-N-[[4-[5-(трифторметил)-1,2,4-оксадиазол-3-ил]фенил]метил]пропанамида, (15.098) 1-метокси-3-метил-1-[[4-[5-(трифторметил)-1,2,4-оксадиазол-3-ил]фенил]метил]мочевины, (15.099) 1,3-диметокси-1-[[4-[5-(трифторметил)-1,2,4-оксадиазол-3-ил]фенил]метил]мочевины, (15.100) 3-этил-1-метокси-1-[[4-[5-(трифторметил)-1,2,4-оксадиазол-3-ил]фенил]метил]мочевины, (15.101) 1-[[4-[5-(трифторметил)-1,2,4-оксадиазол-3-ил]фенил]метил]пиперидин-2-она, (15.102) 4,4-диметил-2-[[4-[5-(трифторметил)-1,2,4-оксадиазол-3-ил]фенил]метил]изооксазолидин-3-она, (15.103) 5,5-диметил-2-[[4-[5-(трифторметил)-1,2,4-оксадиазол-3-ил]фенил]метил]изоксазолидин-3-она, (15.104) 3,3-диметил-1-[[4-[5-(трифторметил)-1,2,4-оксадиазол-3-ил]фенил]метил]пиперидин-2-она, (15.105) 1-[[3-фтор-4-(5-(трифторметил)-1,2,4-оксадиазол-3-ил]фенил]метил]азепан-2-она, (15.106) 4,4-диметил-2-[[4-(5-(трифторметил)-1,2,4-оксадиазол-3-ил]фенил]метил]изоксазолидин-3-она, (15.107) 5,5-диметил-2-[[4-[5-(трифторметил)-1,2,4-оксадиазол-3-ил]фенил]метил]изоксазолидин-3-она, (15.108) этил 1-{4-[5-(трифторметил)-1,2,4-оксадиазол-3-ил]бензил}-1H-пиразол-4-карбоксилата, (15.109) N,N-диметил-1-{4-[5-(трифторметил)-1,2,4-оксадиазол-3-ил]бензил}-1H-1,2,4-триазол-3-амин, (15.110) N-{2,3-дифтор-4-[5-(трифторметил)-1,2,4-оксадиазол-3-ил]бензил}бутанамида, (15.111) N-(1-метилциклопропил)-4-[5-(трифторметил)-1,2,4-оксадиазол-3-ил]бензамида, (15.112) N-(2,4-дифторфенил)-4-[5-(трифторметил)-1,2,4-оксадиазол-3-ил]бензамида, (15.113) 1-(5,6-диметилпиридин-3-ил)-4,4-дифтор-3,3-диметил-3,4-дигидроизохинолина, (15.114) 1-(6-(дифторметил)-5-метил-пиридин-3-ил)-4,4-дифтор-3,3-диметил-3,4-дигидроизохинолина, (15.115) 1-(5-(фторметил)-6-метил-пиридин-3-ил)-4,4-дифтор-3,3-диметил-3,4-дигидроизохинолина, (15.116) 1-(6-(дифторметил)-5-метокси-пиридин-3-ил)-4,4-дифтор-3,3-диметил-3,4-дигидроизохинолина, (15.117) 4-[5-(трифторметил)-1,2,4-оксадиазол-3-ил]фенил диметилкарбамата, (15.118) N-{4-[5-(трифторметил)-1,2,4-оксадиазол-3-ил]фенил}пропанамида, (15.119) 3-[2-(1-{5-метил-3-(трифторметил)-1H-пиразол-1-ил]ацетил}пиперидин-4-ил)-1,3-тиазол-4-ил]-1,5-дигидро-2,4-бензодиоксепин-6-ил метансульфоната, (15.120) 9-фтор-3-[2-(1-{5-метил-3-(трифторметил)-1H-пиразол-1-ил]ацетил}пиперидин-4-ил)-1,3-тиазол-4-ил]-1,5-дигидро-2,4-

бензодиоксепин-6-ил метансульфоната, (15.121) 3-[2-(1-{[3,5-бис(дифторметил)-1Н-пиразол-1-ил]ацетил}пиперидин-4-ил)-1,3-тиазол-4-ил]-1,5-дигидро-2,4-бензодиоксепин-6-ил метансульфоната, (15.122) 3-[2-(1-{[3,5-бис(дифторметил)-1Н-пиразол-1-ил]ацетил}пиперидин-4-ил)-1,3-тиазол-4-ил]-9-фтор-1,5-дигидро-2,4-бензодиоксепин-6-ил метансульфоната, (15.123) 1-(6,7-диметилпиразоло[1,5-а]пиридин-3-ил)-4,4-дифтор-3,3-диметил-3,4-дигидроизохинолина, (15.124) 8-фтор-N-(4,4,4-трифтор-2-метил-1-фенилбутан-2-ил)хинолин-3-карбоксамида, (15.125) 8-фтор-N-[(2S)-4,4,4-трифтор-2-метил-1-фенилбутан-2-ил]хинолин-3-карбоксамида, (15.126) N-(2,4-диметил-1-фенилпентап-2-ил)-8-фторхинолин-3-карбоксамида, (15.127) N-[(2S)-2,4-диметил-1-фенилпентап-2-ил]-8-фторхинолин-3-карбоксамида и (15.128) D-тагатозы.

Все указанные вещества для использования в смеси классов (1) – (15) в соответствии с описанием в настоящем документе выше могут присутствовать в виде свободного соединения и/или в виде агрохимически активных солей, если их функциональные группы позволяют это.

Соединение формулы (I) и композиция по изобретению также могут быть объединены с одним или более агентами биологической борьбы.

В контексте настоящего документа под термином «биологический контроль» понимается контроль вредных организмов, таких как фитопатогенные грибы и/или насекомые и/или акариды и/или нематоды, посредством использования или применения агента биологической борьбы.

В контексте настоящего документа под термином «агент биологической борьбы» понимается организм, отличный от вредных организмов и/или белков, или вторичных метаболитов, производимых таким организмом в целях биологической борьбы. В определение агента биологического контроля включены мутанты второго организма. Термин «мутант» относится к варианту родительского штамма, а также к способам получения мутанта или варианта, в котором пестицидная активность выше, чем у родительского штамма. Под термином «родительский штамм» в настоящем документе понимается исходный штамм до мутагенеза. Для получения таких мутантов родительский штамм можно обработать химическим веществом, таким как N-метил-N'-нитро-N-нитрозогуанидин, этилметансульфон, или облучить с использованием гамма-, рентгеновского или УФ-излучения, или

другими способами, которые хорошо известны специалистам в данной области. Среди известных механизмов действия агентов биологического контроля использование кишечных бактерий, которые контролируют корневую гниль, вытесняя грибы с мест их размещения на поверхности корня. Для борьбы с патогенами использовались бактериальные токсины, такие как антибиотики. Токсин может выделяться и наноситься непосредственно на растение, или же могут быть введены виды бактерий, которые будут производить токсин *in situ*.

«Вариант» представляет собой штамм, который обладает всеми идентификационными характеристиками номеров доступа NRRL или ATCC, как указано в данном тексте, и может быть идентифицирован как обладающий геномом, который в условиях высокой степени строгости гибридизируется с геномом номеров доступа NRRL или ATCC.

Под термином «гибридизация» понимается реакция, в рамках которой один или несколько полинуклеотидов реагируют с образованием комплекса, который стабилизируется за счет водородных связей между основаниями нуклеотидных остатков. Связывание водородом может происходить путем спаривания оснований по Уотсону-Крику, связывания Хугстина или любым другим специфичным для последовательности образом. Комплекс может включать две нити, образующие дуплексную структуру, три или более нитей, образующих многоцепочечный комплекс, одну самогибридирующуюся цепь или любую комбинацию вышеуказанного. Реакции гибридизации можно проводить в условиях различной степени «строгости». В целом, реакцию гибридизации с любой степенью строгости проводят при температуре около 40 °C в растворе цитрата и хлорида натрия 10 X SSC или в растворе с эквивалентной ионной силой/температурой. Гибридизацию умеренной строгости обычно проводят при температуре около 50 °C в растворе цитрата и хлорида натрия 6 X SSC, а реакцию гибридизации высокой строгости обычно проводят при температуре около 60 °C в 1 X SSC.

Вариант указанного номера доступа NRRL или ATCC также может быть определен как штамм, имеющий геномную последовательность, которая более чем на 85%, более предпочтительно более чем на 90% или более предпочтительно более чем на 95 % идентична геному указанного номера доступа NRRL или ATCC. Полинуклеотид или полинуклеотидная область (или полипептид или полипептидная область) имеет определенный процент (например, 80%, 85%, 90%

или 95%) «идентичности последовательности» с другой последовательностью, и это означает, что при выравнивании этот процент оснований (или аминокислот) является одинаковым при сравнении двух последовательностей. Данное выравнивание и процент гомологии или идентичность последовательности можно определить с использованием компьютерных программ, известных в данной области техники, например, программ, которые описаны в работе *Current Protocols in Molecular Biology* (F. M. Ausubel et al., изд., 1987).

NRRL – это сокращение от Коллекция культур Службы сельскохозяйственных исследований, международного органа по депонированию штаммов микроорганизмов в соответствии с Будапештским договором о международном признании депонирования микроорганизмов для целей патентной процедуры, с адресом Национальный центр сельскохозяйственных исследований в области утилизации сельскохозяйственных отходов, Служба сельскохозяйственных исследований, Министерство сельского хозяйства США, 1815 ул. Норс Университи Стрит, Перойра, штат Иллинойс, 61604, США.

ATCC – это сокращение от Американская коллекция типовых культур, международного органа по депонированию штаммов микроорганизмов в соответствии с Будапештским договором о международном признании депонирования микроорганизмов для целей патентной процедуры, с адресом Патентный депозитарий ATCC, 10801 б-р Университи, Манассас, штат Вирджиния, 10110, США.

К примерам агентов биологической борьбы, которые можно комбинировать с соединением формулы (I) и композицией по изобретению, можно отнести следующие:

(A) Антибактериальные агенты, выбранные из группы:

(A1) бактерии, такие как (A1.1) *Bacillus subtilis*, в частности, штамм QST713/AQ713 (поставляемый как SERENADE OPTI или SERENADE ASO компании Bayer CropScience LP, US, с № Доступа NRRL B21661, Патент США № 6,060,051); (A1.2) *Bacillus* sp., в частности, штамм D747 (поставляемый как DOUBLE NICKEL® компании Kumiai Chemical Industry Co., Ltd.), с № Доступа FERM BP-8234, Патент США № 7,094,592; (A1.3) *Bacillus pumilus*, в частности, штамм BU F-33, с № Доступа NRRL 50185 (поставляемый как часть продукта

CARTISSA® компании BASF, Рег. № EPA 71840-19); (A1.4) *Bacillus subtilis* var. *amyloliquefaciens* штамм FZB24 с № Доступа DSM 10271 (поставляемый компанией Novozymes как TAEGRO® или TAEGRO® ECO (Регистрационный № EPA 70127-5)); (A1.5) *Paenibacillus* sp. штамм с № Доступа NRRL B-50972 или № Доступа NRRL B-67129, WO 2016/154297; (A1.6) *Bacillus subtilis* штамм BU1814, (поставляемый как VELONDIS® PLUS, VELONDIS® FLEX и VELONDIS® EXTRA компании BASF SE); (A1.7) *Bacillus mojavensis* штамм R3B (№ Доступа NCAIM (P) B001389) (WO 2013/034938) компании Certis USA LLC, дочерней компании Mitsui & Co.; (A1.8) *Bacillus subtilis* CX-9060 компании Certis USA LLC, дочерней компании Mitsui & Co.; (A1.9) *Paenibacillus polymyxa*, в частности, штамм AC-1 (например, TOPSEED® компании Green Biotech Company Ltd.); (A1.10) *Pseudomonas proradix* (например, PRORADIX® компании Sourcon Padena); (A1.11) *Pantoea agglomerans*, в частности, штамм E325 (№ Доступа NRRL B-21856) (поставляемый как BLOOMTIME BIOLOGICAL™ FD BIOPESTICIDE компании Northwest Agri Products); и

(A2) грибы, такие как (A2.1) *Aureobasidium pullulans*, в частности, бластоспоры штамма DSM14940, бластоспоры штамма DSM 14941 или смеси бластоспор штаммов DSM14940 и DSM14941 (например, BOTECTOR® и BLOSSOM PROTECT® компании bio-ferm, CH); (A2.2) *Pseudozyma aphidis* (как раскрыто в WO2011/151819 компании Yissum Research Development Company of the Hebrew University of Jerusalem); (A2.3) *Saccharomyces cerevisiae*, в частности, штаммы CNCM № I-3936, CNCM № I-3937, CNCM № I-3938 или CNCM № I-3939 (WO 2010/086790) компании Lesaffre et Compagnie, FR;

(B) биологические фунгициды, выбранные из группы:

(B1) бактерии, например, (B1.1) *Bacillus subtilis*, в частности, штамм QST713/AQ713 (поставляемый как SERENADE OPTI или SERENADE ASO компании Bayer CropScience LP, US, с № Доступа NRRL B21661 и раскрытый в Патенте США № 6,060,051); (B1.2) *Bacillus pumilus*, в частности, штамм QST2808 (поставляемый как SONATA® компании Bayer CropScience LP, US, с № Доступа NRRL B-30087 и раскрытый в Патенте США № 6,245,551); (B1.3) *Bacillus pumilus*, в частности, штамм GB34 (поставляемый как Yield Shield® компании Bayer AG, DE); (B1.4) *Bacillus pumilus*, в частности, штамм BU F-33, с № Доступа NRRL 50185 (поставляемый как часть продукта CARTISSA компании BASF, Рег. № EPA 71840-

19); (B1.5) *Bacillus amyloliquefaciens*, в частности, штамм D747 (поставляемый как Double Nickel™ компании Kumiai Chemical Industry Co., Ltd., с № Доступа FERM BP-8234, Патент США № 7,094,592); (B1.6) *Bacillus subtilis* Y1336 (поставляемый как BIOBAC® WP компании Bion-Tech, Тайвань, зарегистрированный как биологический фунгицид в Тайване под Регистрационным № 4764, 5454, 5096 и 5277); (B1.7) *Bacillus subtilis* штамм MBI 600 (поставляемый как SUBTILEX компании BASF SE), с № Доступа NRRL B-50595, Патент США № 5,061,495; (B1.8) *Bacillus subtilis* штамм GB03 (поставляемый как Kodiak® компании Bayer AG, DE); (B1.9) *Bacillus subtilis* var. *amyloliquefaciens* штамм FZB24 с № Доступа DSM 10271 (поставляемый компанией Novozymes как TAEGRO® или TAEGRO® ECO (Регистрационный № EPA 70127-5)); (B1.10) *Bacillus mycoides*, изолят J , с № Доступа B-30890 (поставляемый как BMJ TGAI® или WG и LifeGard™ компании Certis USA LLC, дочерней компании Mitsui & Co.); (B1.11) *Bacillus licheniformis*, в частности, штамм SB3086, с № Доступа ATCC 55406, WO 2003/000051 (поставляемый как ECOGUARD® биофунгицид и GREEN RELEAF™ компании Novozymes); (B1.12) *Paenibacillus* sp. штамм с № Доступа NRRL B-50972 или № Доступа NRRL B-67129, WO 2016/154297; (B1.13) *Bacillus subtilis* штамм BU1814, (поставляемый как VELONDIS® PLUS, VELONDIS® FLEX и VELONDIS® EXTRA компании BASF SE); (B1.14) *Bacillus subtilis* CX-9060 компании Certis USA LLC, дочерней компании Mitsui & Co.; (B1.15) *Bacillus amyloliquefaciens* штамм F727 (также известный как штамм MBI110) (NRRL № Доступа B-50768; WO 2014/028521) (STARGUS® компании Marrone Bio Innovations); (B1.16) *Bacillus amyloliquefaciens* штамм FZB42, № Доступа DSM 23117 (поставляемый как RHIZOVITAL® компании ABiTER, DE); (B1.17) *Bacillus licheniformis* FMCH001 и *Bacillus subtilis* FMCH002 (QUARTZO® (WG) и PRESENCE® (WP) компании FMC Corporation); (B1.18) *Bacillus mojavensis* штамм R3B (№ Доступа NCAIM (P) B001389) (WO 2013/034938) компании Certis USA LLC, дочерней компании Mitsui & Co.; (B1.19) *Paenibacillus polymyxa* ssp. *plantarum* (WO 2016/020371) компании BASF SE; (B1.20) *Paenibacillus epiphyticus* (WO 2016/020371) компании BASF SE; (B1.21) *Pseudomonas chloraphis* штамм AFS009, с № Доступа NRRL B-50897, WO 2017/019448 (например, HOWLER™ и ZIO® компании AgBiome Innovations, US); (B1.22) *Pseudomonas chloraphis*, в частности, штамм MA342 (например, CEDOMON®, CERALL®, и CEDRESS® компании Bioagri и Koppert); (B1.23) *Streptomyces lydicus* штамм WYEC108 (также известный как *Streptomyces lydicus*

штамм WYCD108US) (ACTINO-IRON[®] и ACTINOVATE[®] компании Novozymes); (B1.24) *Agrobacterium radiobacter* штамм K84 (например, GALLTROL-A[®] компании AgBioChem, CA); (B1.25) *Agrobacterium radiobacter* штамм K1026 (например, NOGALL[™] компании BASF SE); (B1.26) *Bacillus subtilis* KTSB штамм (FOLIACTIVE[®] компании Donaghys); (B1.27) *Bacillus subtilis* IAB/BS03 (AVIV[™] компании STK Bio-Ag Technologies); (B1.28) *Bacillus subtilis* штамм Y1336 (поставляемый как BIOBAC[®] WP компании Bion-Tech, Тайвань, зарегистрированный как биологический фунгицид в Тайване под Регистрационным № 4764, 5454, 5096 и 5277); (B1.29) *Bacillus amyloliquefaciens* изолят B246 (например, AVOGREEN[™] компании University of Pretoria); (B1.30) *Bacillus метилотrophicus* штамм BAC-9912 (компании Chinese Academy of Sciences' Institute of Applied Ecology); (B1.31) *Pseudomonas proradix* (например, PRORADIX[®] компании Sourcon Padena); (B1.32) *Streptomyces griseoviridis* штамм K61 (также известный как *Streptomyces galbus* штамм K61) (№ Доступа DSM 7206) (MYCOSTOP[®] компании Verdera; PREFENCE[®] компании BioWorks; см. Crop Protection 2006, 25, 468-475); (B1.33) *Pseudomonas fluorescens* штамм A506 (например, BLIGHTBAN[®] A506 компании NuFarm); и

(B2) грибы, например: (B2.1) *Coniothyrium minitans*, в частности, штамм CON/M/91-8 (№ Доступа DSM-9660; например, Contans[®] компании Bayer CropScience Biologics GmbH); (B2.2) *Metschnikowia fructicola*, в частности, штамм NRRL Y-30752; (B2.3) *Microsphaeropsis ochracea*; (B2.5) *Trichoderma atroviride*, в частности, штамм SC1 (с № Доступа CBS 122089, WO 2009/116106 и Патент США № 8,431,120 (компании Bi-PA)), штамм 77B (T77 компании Andermatt Biocontrol) или штамм LU132 (например, Sentinel компании Agrimm Technologies Limited); (B2.6) *Trichoderma harzianum* штамм T-22 (например, Triatum-P компании Andermatt Biocontrol или Koppert) или штамм Сера Simb-T5 (компании Simbiose Agro); (B2.14) *Gliocladium roseum* (также известный как *Clonostachys rosea f. rosea*), в частности, штамм 321U компании Adjuvants Plus, штамм ACM941 как раскрыто в Xue (Efficacy of *Clonostachys rosea* strain ACM941 and fungicide seed treatments for controlling the root rot complex of field pea, Can Jour Plant Sci 83(3): 519-524), или штамм IK726 (Jensen DF, et al. Development of a biocontrol agent for plant disease control with special emphasis on the near commercial fungal antagonist *Clonostachys rosea* штамм 'IK726'; Australas Plant Pathol. 2007; 36:95–101); (B2.35) *Talaromyces*

flavus, штамм V117b; (B2.36) *Trichoderma viride*, в частности, штамм B35 (Pietr et al., 1993, Zesz. Nauk. A R w Szczecinie 161: 125-137); (B2.37) *Trichoderma asperellum*, в частности, штамм SKT-1, с № Доступа FERM P-16510 (например, ECO-HOPE® компании Kumiai Chemical Industry), штамм T34 (например, T34 Biocontrol компании Biocontrol Technologies S.L., ES) или штамм ICC 012 компании Isagro; (B2.38) *Trichoderma atroviride*, штамм CNCM I-1237 (например, Esquive® WP компании Agrauxine, FR); (B2.39) *Trichoderma atroviride*, штамм № V08/002387; (B2.40) *Trichoderma atroviride*, штамм NMI № V08/002388; (B2.41) *Trichoderma atroviride*, штамм NMI № V08/002389; (B2.42) *Trichoderma atroviride*, штамм NMI № V08/002390; (B2.43) *Trichoderma atroviride*, штамм LC52 (например, Tenet компании Agrimm Technologies Limited); (B2.44) *Trichoderma atroviride*, штамм ATCC 20476 (IMI 206040); (B2.45) *Trichoderma atroviride*, штамм T11 (IMI352941/CECT20498); (B2.46) *Trichoderma harzianum*; (B2.47) *Trichoderma harzianum*; (B2.48) *Trichoderma harzianum rifai* T39 (например, Trichodex® компании Makhteshim, US); (B2.49) *Trichoderma asperellum*, в частности, штамм kd (например, T-Gro компании Andermatt Biocontrol); (B2.50) *Trichoderma harzianum*, штамм ITEM 908 (например, Trianum-P компании Koppert); (B2.51) *Trichoderma harzianum*, штамм TH35 (например, Root-Pro компании Mycontrol); (B2.52) *Trichoderma virens* (также известный как *Gliocladium virens*), в частности, штамм GL-21 (например, SoilGard компании Certis, US); (B2.53) *Trichoderma viride*, штамм TV1 (например, Trianum-P компании Koppert); (B2.54) *Ampelomyces quisqualis*, в частности, штамм AQ 10 (например, AQ 10® компании IntrachemBio Italia); (B2.56) *Aureobasidium pullulans*, в частности, бластоспоры штамма DSM14940; (B2.57) *Aureobasidium pullulans*, в частности, бластоспоры штамма DSM 14941; (B2.58) *Aureobasidium pullulans*, в частности, смеси бластоспор штаммов DSM14940 и DSM 14941 (например, Botector® компании bio-ferm, CH); (B2.64) *Cladosporium cladosporioides*, штамм H39, с № Доступа CBS122244, US 2010/0291039 (компания Stichting Dienst Landbouwkundig Onderzoek); (B2.69) *Gliocladium catenulatum* (Synonym: *Clonostachys rosea* f. *catemulate*) штамм J1446 (например, Prestop® компании Lallemand); (B2.70) *Lecanicillium lecanii* (ранее известный как *Verticillium lecanii*) *conidia* штамма KV01 (например, Vertalec® компании Koppert/Arysta); (B2.71) *Penicillium vermiculatum*; (B2.72) *Pichia anomala*, штамм WRL-076 (NRRL Y-30842), Патент США № 7,579,183; (B2.75) *Trichoderma atroviride*, штамм SKT-1 (FERM P-16510), JP Patent Publication (Kokai) 11-253151 A; (B2.76) *Trichoderma*

atroviride, штамм SKT-2 (FERM P-16511), JP Patent Publication (Kokai) 11-253151 A; (B2.77) *Trichoderma atroviride*, штамм SKT-3 (FERM P-17021), JP Patent Publication (Kokai) 11-253151 A; (B2.78) *Trichoderma gamsii* (formerly *T. viride*), штамм ICC080 (IMI CC 392151 CABI, например, BioDerma компании AGROBIOSOL DE MEXICO, S.A. DE C.V.); (B2.79) *Trichoderma harzianum*, штамм DB 103 (поставляемый как T-GRO[®] 7456 компании Dagutat Biolab); (B2.80) *Trichoderma polysporum*, штамм IMI 206039 (например, Binab TF WP компании BINAB Bio-Innovation AB, Sweden); (B2.81) *Trichoderma stromaticum*, с № Доступа Ts3550 (например, Tricovab компании CEPLAC, Brazil); (B2.83) *Ulocladium oudemansii* штамм U3, с № Доступа NM 99/06216 (например, BOTRY-ZEN[®] компании Botry-Zen Ltd, New Zealand и BOTRYSTOP[®] компании BioWorks, Inc.); (B2.84) *Verticillium albo-atrum* (formerly *V. dahliae*), штамм WCS850 с № Доступа WCS850, депонированный в Центральное Бюро Грибных Культур (например, DUTCH TRIG[®] компании Tree Care Innovations); (B2.86) *Verticillium chlamydosporium*; (B2.87) смеси *Trichoderma asperellum* штамм ICC 012 (также известный как *Trichoderma harzianum* ICC012), с № Доступа CABI CC IMI 392716 и *Trichoderma gamsii* (formerly *T. viride*) штамм ICC 080, с № Доступа IMI 392151 (например, BIO-TAM[™] компании Isagro USA, Inc. и BIODERMA[®] компании Agrobiosol de Mexico, S.A. de C.V.); (B2.88) *Trichoderma asperelloides* JM41R (№ Доступа NRRL B-50759) (TRICHO PLUS[®] компании BASF SE); (B2.89) *Aspergillus flavus* штамм NRRL 21882 (продукты, известные как AFLA-GUARD[®] компании Syngenta/ChemChina); (B2.90) *Chaetomium cupreum* (№ Доступа CABI 353812) (например, BIOKUPRUM[™] компании AgriLife); (B2.91) *Saccharomyces cerevisiae*, в частности, штамм LASO2 (компании Agro-Levures et Dérivés), штамм LAS117 клеточные стенки (CEREVISANE[®] компании Lesaffre; ROMEO[®] компании BASF SE), штаммы CNCM № I-3936, CNCM № I-3937, CNCM № I-3938, CNCM № I-3939 (WO 2010/086790) компании Lesaffre et Compagnie, FR; (B2.92) *Trichoderma virens* штамм G-41, ранее известный как *Gliocladium virens* (№ Доступа ATCC 20906) (например, ROOTSHIELD[®] PLUS WP и TURFSHIELD[®] PLUS WP компании BioWorks, US); (B2.93) *Trichoderma hamatum*, с № Доступа ATCC 28012; (B2.94) *Ampelomyces quisqualis* штамм AQ10, с № Доступа CNCM I-807 (например, AQ 10[®] компании IntrachemBio Italia); (B2.95) *Phlebiopsis gigantea* штамм VRA 1992 (ROTSTOP[®] С компании Danstar Ferment); (B2.96) *Penicillium steckii* (DSM 27859; WO 2015/067800) компании BASF SE; (B2.97) *Chaetomium globosum* (поставляемый

как RIVADIOM[®] компании Rivale); (B2.98) *Cryptococcus flavescens*, штамм 3C (NRRL Y-50378); (B2.99) *Dactylaria candida*; (B2.100) *Dilophosphora alopecuri* (поставляемый как TWIST FUNGUS[®]); (B2.101) *Fusarium oxysporum*, штамм Fo47 (поставляемый как FUSACLEAN[®] компании Natural Plant Protection); (B2.102) *Pseudozyma flocculosa*, штамм PF-A22 UL (поставляемый как SPORODEX[®] L компании Plant Products Co., CA); (B2.103) *Trichoderma gamsii* (formerly *T. viride*), штамм ICC 080 (IMI CC 392151 CABI) (поставляемый как BIODERMA[®] компании AGROBIOSOL DE MEXICO, S.A. DE C.V.); (B2.104) *Trichoderma fertile* (например, product TrichoPlus компании BASF); (B2.105) *Muscodora roseus*, в частности, штамм A3-5 (№ Доступа NRRL 30548); (B2.106) *Simplicillium lanosoniveum*;

агенты биологической борьбы, обладающие эффектом улучшения роста и/или здоровья растений, которые могут быть объединены в комбинации соединений по изобретению, включая

(C1) бактерии, выбранные из группы, состоящей из *Bacillus pumilus*, в частности, штамм QST2808 (с № Доступа NRRL № B-30087); *Bacillus subtilis*, в частности, штамм QST713/AQ713 (с № Доступа NRRL B-21661 и раскрытый в Патенте США № 6,060,051; поставляемый как SERENADE[®] OPTI или SERENADE[®] ASO компании Bayer CropScience LP, US); *Bacillus subtilis*, в частности, штамм AQ30002 (с № Доступа NRRL B-50421 и описанный в Заявке на Патент США № 13/330,576); *Bacillus subtilis*, в частности, штамм AQ30004 (and NRRL B-50455 и описанный в Заявке на Патент США № 13/330,576); *Sinorhizobium meliloti* штамм NRG-185-1 (NITRAGIN[®] GOLD компании Bayer CropScience); *Bacillus subtilis* штамм BU1814, (поставляемый как TEQUALIS[®] компании BASF SE); *Bacillus subtilis* rm303 (RHIZOMAX[®] компании Biofilm Crop Protection); *Bacillus amyloliquefaciens* pm414 (LOLI-PEPTA[®] компании Biofilm Crop Protection); *Bacillus mycoides* BT155 (NRRL № B-50921), *Bacillus mycoides* EE118 (NRRL № B-50918), *Bacillus mycoides* EE141 (NRRL № B-50916), *Bacillus mycoides* BT46-3 (NRRL № B-50922), *Bacillus cereus* элемент семейства EE128 (NRRL № B-50917), *Bacillus thuringiensis* BT013A (NRRL № B-50924) также известный как *Bacillus thuringiensis* 4Q7, *Bacillus cereus* элемент семейства EE349 (NRRL № B-50928), *Bacillus amyloliquefaciens* SB3281 (ATCC # PTA-7542; WO 2017/205258), *Bacillus amyloliquefaciens* TJ1000 (поставляемый как QUIKROOTS[®] компании Novozymes); *Bacillus firmus*, в частности, штамм CNMC I-1582 (например, VOTIVO[®] компании

BASF SE); *Bacillus pumilus*, в частности, штамм GB34 (например, YIELD SHIELD® компании Bayer Crop Science, DE); *Bacillus amyloliquefaciens*, в частности, штамм IN937a; *Bacillus amyloliquefaciens*, в частности, штамм FZB42 (например, RHIZOVITAL® компании ABiTEP, DE); *Bacillus amyloliquefaciens* BS27 (№ Доступа NRRL B-5015); смесь *Bacillus licheniformis* FMCH001 и *Bacillus subtilis* FMCH002 (поставляемый как QUARTZO® (WG), PRESENCE® (WP) компании FMC Corporation); *Bacillus cereus*, в частности, штамм BP01 (ATCC 55675; например, МЕРИХЛОР® компании Arysta Lifescience, US); *Bacillus subtilis*, в частности, штамм MBI 600 (например, SUBTILEX® компании BASF SE); *Bradyrhizobium japonicum* (например, OPTIMIZE® компании Novozymes); *Mesorhizobium cicer* (например, NODULATOR компании BASF SE); *Rhizobium leguminosarium biovar viciae* (например, NODULATOR компании BASF SE); *Delftia acidovorans*, в частности, штамм RAY209 (например, BIOBOOST® компании Brett Young Seeds); *Lactobacillus* sp. (например, LACTOPLANT® компании LactoPAFI); *Paenibacillus polymyxa*, в частности, штамм AC-1 (например, TOPSEED® компании Green Biotech Company Ltd.); *Pseudomonas proraдix* (например, PRORADIX® компании Sourcon Padena); *Azospirillum brasilense* (например, VIGOR® компании KALO, Inc.); *Azospirillum lipoferum* (например, VERTEX-IF™ компании TerraMax, Inc.); смесь *Azotobacter vinelandii* и *Clostridium pasteurianum* (поставляемый как INVIGORATE® компании Aggrinos); *Pseudomonas aeruginosa*, в частности, штамм PN1; *Rhizobium leguminosarum*, в частности, *bv. viciae* штамм Z25 (№ Доступа СЕСТ 4585); *Azorhizobium caulinodans*, в частности, штамм ZB-SK-5; *Azotobacter chroococcum*, в частности, штамм H23; *Azotobacter vinelandii*, в частности, штамм ATCC 12837; *Bacillus siamensis*, в частности, штамм KCTC 13613T; *Bacillus tequilensis*, в частности, штамм NII-0943; *Serratia marcescens*, в частности, штамм SRM (№ Доступа MTCC 8708); *Thiobacillus* sp. (например, CROPAID® компании Cropaid Ltd UK); и

(C2) грибы, выбранные из группы, состоящей из *Purpureocillium lilacinum* (ранее известной как *Paecilomyces lilacinus*) штамм 251 (AGAL 89/030550; например, BioAct компании Bayer CropScience Biologics GmbH) *Penicillium bilaii*, штамм ATCC 22348 (например, JumpStart® компании Acceleron BioAg), *Talaromyces flavus*, штамм V117b; *Trichoderma atroviride* штамм CNCM I-1237 (например, Esquive® WP компании Agrauxine, FR), *Trichoderma viride*, например,

штамм B35 (Pietr et al., 1993, Zesz. Nauk. A R w Szczecinie 161: 125-137); *Trichoderma atroviride* штамм LC52 (также известный как *Trichoderma atroviride* штамм LU132; например, Sentinel компании Agrimm Technologies Limited); *Trichoderma atroviride* штамм SC1, описанный в Международной Заявке № PCT/IT2008/000196); *Trichoderma asperellum* штамм kd (например, T-Gro компании Andermatt Biocontrol); *Trichoderma asperellum* штамм Eco-T (Plant Health Products, ZA); *Trichoderma harzianum* штамм T-22 (например, Triatum-P компании Andermatt Biocontrol или Koppert); *Myrothecium verrucaria* штамм AARC-0255 (например, DiTera™ компании Valent Biosciences); *Penicillium bilaii* штамм ATCC ATCC20851; *Pythium oligandrum* штамм M1 (ATCC 38472; например, Polyversum компании Bioprepaty, CZ); *Trichoderma virens* штамм GL-21 (например, SoilGard® компании Certis, USA); *Verticillium albo-atrum* (formerly *V. dahliae*) штамм WCS850 (CBS 276.92; например, Dutch Trig компании Tree Care Innovations); *Trichoderma atroviride*, в частности, штамм № V08/002387, штамм № NMI № V08/002388, штамм № NMI № V08/002389, штамм № NMI № V08/002390; *Trichoderma harzianum* штамм ITEM 908; *Trichoderma harzianum*, штамм TSTh20; *Trichoderma harzianum* штамм 1295-22; *Pythium oligandrum* штамм DV74; *Rhizopogon amylopogon* (например, содержащийся в Мусо-Sol компании Helena Chemical Company); *Rhizopogon fulvigleba* (например, содержащийся в Мусо-Sol компании Helena Chemical Company); и *Trichoderma virens* штамм GI-3;

инсектицидно активные агенты биологической борьбы, выбранные из следующего:

(D1) бактерии, выбранные из группы, состоящей из *Bacillus thuringiensis subsp. aizawai*, в частности, штамм ABTS-1857 (SD-1372; например, XENTARI® компании Valent BioSciences); *Bacillus mycoides*, изолят J. (например, BmJ компании Certis USA LLC, дочерней компании Mitsui & Co.); *Bacillus sphaericus*, в частности, Серотип H5a5b штамм 2362 (штамм ABTS-1743) (например, VECTOLEX® компании Valent BioSciences, US); *Bacillus thuringiensis subsp. kurstaki* штамм BMP 123 компании Becker Microbial Products, IL; *Bacillus thuringiensis subsp. aizawai*, в частности, серотип H-7 (например, FLORBAC® WG компании Valent BioSciences, US); *Bacillus thuringiensis subsp. kurstaki* штамм HD-1 (например, DIPEL® ES компании Valent BioSciences, US); *Bacillus thuringiensis subsp. kurstaki* штамм BMP 123 компании Becker Microbial Products, IL; *Bacillus*

thuringiensis israelensis штамм BMP 144 (например, AQUABAC® компании Becker Microbial Products IL); *Burkholderia spp.*, в частности, *Burkholderia rinojensis* штамм A396 (также известный как *Burkholderia rinojensis* штамм MBI 305) (№ Доступа NRRL B-50319; WO 2011/106491 и WO 2013/032693; например, MBI-206 TGAI и ZELTO® компании Marrone Bio Innovations); *Chromobacterium subtsugae*, в частности, штамм PRAA4-1T (MBI-203; например, GRANDEVO® компании Marrone Bio Innovations); *Paenibacillus popilliae* (formerly *Bacillus popilliae*; например, MILKY SPORE POWDER™ и MILKY SPORE GRANULAR™ компании St. Gabriel Laboratories); *Bacillus thuringiensis* subsp. *israelensis* (серотип H-14) штамм AM65-52 (№ Доступа ATCC 1276) (например, VECTOBAC® компании Valent BioSciences, US); *Bacillus thuringiensis* var. *kurstaki* штамм EVB-113-19 (например, BIOPROTEC® компании AEF Global); *Bacillus thuringiensis* subsp. *tenebrionis* штамм NB 176 (SD-5428; например, NOVODOR® FC компании BioFa DE); *Bacillus thuringiensis* var. *japonensis* штамм Buibui; *Bacillus thuringiensis* subsp. *kurstaki* штамм ABTS 351; *Bacillus thuringiensis* subsp. *kurstaki* штамм PB 54; *Bacillus thuringiensis* subsp. *kurstaki* штамм SA 11; *Bacillus thuringiensis* subsp. *kurstaki* штамм SA 12; *Bacillus thuringiensis* subsp. *kurstaki* штамм EG 2348; *Bacillus thuringiensis* var. *Colmeri* (например, TIANBAOBTC компании Changzhou Jianghai Chemical Factory); *Bacillus thuringiensis* subsp. *aizawai* штамм GC-91; *Serratia entomophila* (например, INVADE® компании Wrightson Seeds); *Serratia marcescens*, в частности, штамм SRM (№ Доступа MTCC 8708); и *Wolbachia pipientis* ZAP штамм (например, ZAP MALES® компании MosquitoMate); и

(D2) грибы, выбранные из группы, состоящей из *Isaria fumosorosea* (ранее известного как *Paecilomyces fumosoroseus*) штамм аорка 97; *Beauveria bassiana* штамм ATCC 74040 (например, NATURALIS® компании Intrachem Bio Italia); *Beauveria bassiana* штамм GHA (№ Доступа ATCC74250; например, BOTANIGUARD® ES и MYCONTROL-O® компании Laverlam International Corporation); *Zoophtora radicans*; *Metarhizium robertsii* 15013-1 (депонированный под номером доступа NRRL 67073), *Metarhizium robertsii* 23013-3 (депонированный под номером доступа NRRL 67075), и *Metarhizium anisopliae* 3213-1 (депонированный под номером доступа NRRL 67074) (WO 2017/066094; Pioneer Hi-Bred International); *Beauveria bassiana* штамм ATP02 (№ Доступа DSM 24665).

Среди них, *Isaria fumosorosea* (ранее известный как *Paecilomyces fumosoroseus*) штамм аорпка 97 является особенно предпочтительным;

(Е) вирусы, выбранные из группы, состоящей из *Adoxophyes orana* (желтая листовертка) вирус гранулеза (GV), *Cydia pomonella* (плодожорка яблочная) вирус гранулеза (GV), *Helicoverpa armigera* (хлопковая совка) вирус ядерного полиэдроза (NPV), *Spodoptera exigua* (свекловичная совка) mNPV, *Spodoptera frugiperda* (осенняя совка) mNPV и *Spodoptera littoralis* (африканская хлопковая листовертка) NPV.

(F) бактерии и грибы, которые могут быть добавлены в качестве инокулянта к растениям, частям растений или органам растений и которые в силу своих особых свойств способствуют росту растений и их здоровью. Примеры: *Agrobacterium spp.*, *Azorhizobium caulinodans*, *Azospirillum spp.*, *Azotobacter spp.*, *Bradyrhizobium spp.*, *Burkholderia spp.*, в частности, *Burkholderia cepacia* (ранее известный как *Pseudomonas cepacia*), *Gigaspora spp.*, или *Gigaspora monosporum*, *Glomus spp.*, *Laccaria spp.*, *Lactobacillus buchneri*, *Paraglomus spp.*, *Pisolithus tinctorius*, *Pseudomonas spp.*, *Rhizobium spp.*, в частности, *Rhizobium trifolii*, *Rhizopogon spp.*, *Scleroderma spp.*, *Suillus spp.*, и *Streptomyces spp.*; и

(G) экстракты и продукты из растений, образованные микроорганизмами, включая белки и вторичные метаболиты, которые могут использоваться в качестве агентов биологической борьбы, например, *Allium sativum*, *Artemisia absinthium*, азадирахтин, Biokeeper WP, *Cassia nigricans*, *Celastrus angulatus*, *Chenopodium anthelminticum*, хитин, Armour-Zen, *Dryopteris filix-mas*, *Equisetum arvense*, Fortune Aza, Fungastop, Heads Up (*Chenopodium quinoa* экстракт сапонины), *Pyrethrum/Pyrethrins*, *Quassia amara*, *Quercus*, *Quillaja*, Regalia, "Requiem™ Insecticide", ротенон, *ryania*/рианодин, *Symphytum officinale*, *Tanacetum vulgare*, тимол, Triact 70, TriCon, *Tropaeolum majus*, *Urtica dioica*, Veratrin, *Viscum album*, экстракт *Brassicaceae*, в частности, порошок из семян рапса или горчичный порошок, а также биоинсектицидные/акарицидные активные вещества, полученные из оливкового масла, в частности, ненасыщенные жирные/карбоновые кислоты с длиной углеродных цепей C₁₆-C₂₀ в качестве активных ингредиентов, такие как, например, содержащиеся в продукте с торговым названием FLiPPER®.

Соединение формулы (I) и композиция по изобретению могут быть объединены с одним или более активными ингредиентами, выбранными из инсектицидов, акарицидов и нематоцидов.

«Инсектициды», а также термин «инсектицидные» относятся к способности вещества повышать смертность или замедлять скорость роста насекомых. В контексте настоящего документа термин «насекомые» включает в себя все организмы класса «Insecta».

«Нематоцид» и «нематоцидный» относятся к способности вещества повышать смертность или замедлять скорость роста нематод. Как правило, термин «нематода» включает яйца, личинки, ювенильные и зрелые формы указанного организма.

«Акарициды» и «акарицидные» относятся к способности вещества повышать смертность или замедлять скорость роста эктопаразитов, принадлежащих к подклассу Acari класса Arachnida.

К примерам инсектицидов, акарицидов и нематоцидов, соответственно, которые можно смешивать с соединением формулы (I) и композицией по изобретению, можно отнести следующие:

(1) Ингибиторы ацетилхолинэстеразы (AChE), такие как, например, карбаматы, например, аланикарб, алдикарб, бендиокарб, бенфуракарб, бутокарбоксим, бутоксикарбоксим, карбарил, карбофуран, карбосульфат, этиофенкарб, фенобукарб, форметанат, фуратиокарб, изопрокарб, метиокарб, метомил, метолкарб, оксамил, пиримикарб, пропоксур, тиодикарб, тиофанокс, триазамат, триметакарб, ХМС, ксилкарб; или органофосфаты, например, ацефат, азаметифос, азинфос-этил, азинфос-метил, кадусафос, хлоретоксифос, хлорфенвинфос, хлормефос, хлорпирифос-метил, кумафос, цианофенфос, диметон-S-метил, диазинон, дихлорфос/DDVP, дикротофос, диметоат, диметилвинфос, дисульфотон, EPN, этион, этопрофос, фамфур, фенамифос, фенитротрион, фентион, фостиазат, гептенофос, имициафос, изофенфос, изопропил О-(метоксиаминотиофосфорил) салицилат, изоксатион, малатион, мекарбам, метамидофос, метидатион, мевинфос, монокротофос, налед, ометоат, оксидеметон-метил, паратион-метил, фентоат, форат, фозалон, фосмет, фосфамидон, фоксим, пиримифос-метил, профенофос, пропафос, пропетамфос, протиофос, пираклофос,

пиридафентион, хиналфос, сульфотеп, тебупиримфос, темефос, тербуфос, тетрахлорвинфос, тиометон, триазофос, трихлорфон, вимидотион.

(2) Блокаторы ГАМК-управляемых хлоридных каналов, такие как, например, циклодиен-органохлорорганические соединения, например, хлордан и эндосульфат или фенилпиразолы (фипролы), например, этипрол и фипронил.

(3) Модуляторы натриевых каналов, такие, например, как пиретроиды, например, акринатрин, аллетрин, d-цис-транс-аллетрин, d-транс-аллетрин, бифентрин, биоаллетрин, биоаллетрин-S-циклопентенил изомер, биорезметрин, циклопротрин, цифлутрин, бета-цифлутрин, цигалотрин, лямбда-цигалотрин, гамма-цигалотрин, циперметрин, альфа-циперметрин, бета-циперметрин, тета-циперметрин, зета-циперметрин, цифенотрин [(1R)-транс-изомер], дельтаметрин, эмпентрин [(EZ)-(1R)-изомер], эсфенвалерат, этофенпрокс, фенпропатрин, фенвалерат, флуцитринат, флуметрин, тау-флувалинат, галфенпрокс, имипротрин, кадетрин, момфтортрин, перметрин, фенотрин [(1R)-транс-изомер], праллетрин, пиретрины (пиретрум), резметрин, силафлуофен, тефлутрин, тетраметрин, тетраметрин [(1R)-изомер)], тралометрин и трансфлутрин или ДДТ или метоксихлор.

(4) Конкурентные модуляторы никотинового холинорецептора (nAChR), такие как, например, неоникотиноиды, например, ацетамиприд, клотианидин, динотефуран, имидаклоприд, нитенпирам, тиаклоприд и тиаметоксам или никотин, или сульфоксафлор, или флупирадифурон.

(5) Аллостерические модуляторы никотиновых ацетилхолиновых рецепторов (nAChR), такие как, например, спинозины, например, спинеторам и спиносад.

(6) Аллостерические модуляторы глутамат-управляемых хлорных каналов (GluCl), такие как, например, авермектины/милбемицины, например, абамектин, эмамектин, бензоат, лепимектин и мильбемектин.

(7) Миметики ювенильного гормона, такие как, например, аналоги ювенильного гормона, например, гидропрен, кинопрен и метопрен или феноксикарб или пирипроксифен.

(8) Различные неспецифические (мультисайтовые) ингибиторы, такие как, например, алкилгалогениды, например, метилбромид и прочие алкилгалогениды;

или хлорпикрин или сульфурил фторид или боракс или антимонитартрат калия или генераторы метилизоцианата, например, диазомер и метам.

(9) Модуляторы хордотональных органов, такие как, например, пиметрозин или флоникамид.

(10) Ингибиторы роста клещей, например, клофентезин, гекситиазокс и дифлоvidaзин или этоксазол.

(11) Микробиальный дезинтегратор кишечной мембраны насекомого, такие как, например, *Bacillus thuringiensis* подвиды *israelensis*, *Bacillus sphaericus*, *Bacillus thuringiensis* подвиды *aizawai*, *Bacillus thuringiensis* подвиды *kurstaki*, *Bacillus thuringiensis* подвиды *tenebrionis*, и *B.t.* растительные протеины: Cry1Ab, Cry1Ac, Cry1Fa, Cry1A.105, Cry2Ab, Vip3A, mCry3A, Cry3Ab, Cry3Bb, Cry34Ab1/35Ab1.

(12) Ингибиторы митохондриальной АТФ-синтазы, такие как разрушители АТФ, такие как, например, диафентиурон или оловоорганические соединения, например, азоциклоолово, цигексаолово и оксид фенбутаолова или пропаргит или тетрадифон.

(13) Агенты, способствующие разрыву связей при окислительном фосфорилировании посредством разрушения протонного градиента, такие как, например, хлорфенапир, DNOC и сульфурамид.

(14) Блокаторы каналов никотиновых рецепторов ацетилхолина, такие как, например, бенсультап, картап гидрохлорид, тиоцилам и тиосультап-натрий.

(15) Ингибиторы биосинтеза хитина типа 0, такие как, например, бистрифлурон, хлорфлуазурон, дифлубензурон, флуциклоксурон, флуфеноксурон, гексафлумурон, луфенурон, новалурон, новифлумурон, тефлубензурон и трифлумурон.

(16) Ингибиторы биосинтеза хитина типа 1, например, бупрофезин.

(17) Нарушитель линьки (в частности, для *Diptera*, т.е. двукрылых), такой как, например, циромазин.

(18) Агонисты рецептора экдизона, такие как, например, хромафенозид, галофенозид, метоксифенозид и тебуфенозид.

(19) Агонисты рецепторов октопамина, такие как, например, амитраз.

(20) Профлуазол переноса электронов митохондриального комплекса III, такие как, например, гидраметилнон или ацехиноцил или флуакрипирим.

(21) Ингибиторы переноса электронов митохондриального комплекса I из группы METI акарицидов, например, феназахин, фенпироксимат, пиримидифен, пиридабен, тебуфенпирад и толфенпирад или ротенон (Derris).

(22) Регулируемые напряжением блокаторы натриевых каналов, такие как, например, индоксакарб или метафлумизон.

(23) Ингибиторы ацетил-СоА карбоксилазы, такие как, например, производные тетроновой и тетраминовой кислоты, например, спиродиклофен, спиромезифен и спиротетрамат.

(24) Ингибиторы переноса электронов митохондриального комплекса IV, такие как, например, фосфины, например, фосфид алюминия, фосфид кальция, фосфин и фосфид цинка или цианиды, например, цианид кальция, цианид калия и цианид натрия.

(25) Ингибиторы переноса электронов митохондриального комплекса II, такие как, например, производные бета-кетонитрила, например, циенопирафен и цифлуметофен и карбоксанилиды, такие как, например, пифлубумид.

(28) Модуляторы рианодиновых рецепторов, такие как, например, диамиды, например, хлорантранилипрол, циантранилипрол и флубендиамид,

другие активные соединения, такие как, например, афидопирен, афоксоланер, азадирахтин, бенклотиаз, бензоксимат, бифеназат, брофланилид, бромпропилат, хинометионат, хлорпраллетрин, криолит, цикланилипрол, циклоксаприд, цигалодиамид, диклоромезотиаз, дикофол, эпсилон-метофлутрин, эпсилон-момфлутрин, флометоксин, флузаиндолизин, флуенсульфон, флуфенерим, флуфеноксистробин, флуфипрол, флугексафон, флуопирам, флураланер, флуксаметамид, фуфенозид, гвадипир, гептафлутрин, имидаклотиз, ипродион, каппа-бифентрин, каппа-тефлутрин, лотиланер, меперфлутрин, пайчонгдин, пиридалил, пирифлухиназон, пириминостробин, спиробудиклофен, тетраметилфлутрин, тетранилипрол, тетрахлорантранилипрол, тиголанер, тиоксазафен, тиофлуоксимат, трифлумезопирим и йодметан; другие препараты на

основе *Bacillus firmus* (I-1582, BioNeem, Votivo) и следующие соединения: 1-{2-фтор-4-метил-5-[(2,2,2-трифторэтил)сульфинил]фенил}-3-(трифторметил)-1*H*-1,2,4-триазол-5-амин (известный из WO2006/043635) (CAS 885026-50-6), {1'-[(2*E*)-3-(4-хлорфенил)проп-2-ен-1-ил]-5-фторспиро[индол-3,4'-пиперидин]-1(2*H*)-ил}(2-хлорпиридин-4-ил)метанон (известный из WO2003/106457) (CAS 637360-23-7), 2-хлор-*N*-[2-{1'-[(2*E*)-3-(4-хлорфенил)проп-2-ен-1-ил]пиперидин-4-ил}-4-(трифторметил)фенил]isonикотинамид (известный из WO2006/003494) (CAS 872999-66-1), 3-(4-хлор-2,6-диметилфенил)-4-гидрокси-8-метокси-1,8-дiazаспиро[4.5]дек-3-ен-2-он (известный из WO 2010052161) (CAS 1225292-17-0), 3-(4-хлор-2,6-диметилфенил)-8-метокси-2-оксо-1,8-дiazаспиро[4.5]дек-3-ен-4-ил этил карбонат (известный из EP2647626) (CAS 1440516-42-6), 4-(*but*-2-ин-1-илокси)-6-(3,5-диметилпиперидин-1-ил)-5-фторпиримидин (известный из WO2004/099160) (CAS 792914-58-0), PF1364 (известный из JP2010/018586) (CAS 1204776-60-2), *N*-[(2*E*)-1-[(6-хлорпиридин-3-ил)метил]пиридин-2(1*H*)-илиден]-2,2,2-трифторацетамид (известный из WO2012/029672) (CAS 1363400-41-2), (3*E*)-3-[1-[(6-хлор-3-пиридил)метил]-2-пиридилиден]-1,1,1-трифтор-пропан-2-он (известный из WO2013/144213) (CAS 1461743-15-6), *N*-[3-(бензилкарбамоил)-4-хлорфенил]-1-метил-3-(пентафторэтил)-4-(трифторметил)-1*H*-пиразол-5-карбоксамид (известный из WO2010/051926) (CAS 1226889-14-0), 5-бром-4-хлор-*N*-[4-хлор-2-метил-6-(метилкарбамоил)фенил]-2-(3-хлор-2-пиридил)пиразол-3-карбоксамид (известный из CN103232431) (CAS 1449220-44-3), 4-[5-(3,5-дихлорфенил)-4,5-дигидро-5-(трифторметил)-3-изоксазолил]-2-метил-*N*-(*цис*-1-оксидо-3-тиетанил)-бензамид, 4-[5-(3,5-дихлорфенил)-4,5-дигидро-5-(трифторметил)-3-изоксазолил]-2-метил-*N*-(*транс*-1-оксидо-3-тиетанил)-бензамид и 4-[(5*S*)-5-(3,5-дихлорфенил)-4,5-дигидро-5-(трифторметил)-3-изоксазолил]-2-метил-*N*-(*цис*-1-оксидо-3-тиетанил)бензамид (известный из WO 2013/050317 A1) (CAS 1332628-83-7), *N*-[3-хлор-1-(3-пиридинил)-1*H*-пиразол-4-ил]-*N*-этил-3-[(3,3,3-трифторпропил)сульфинил]-пропанамид, (+)-*N*-[3-хлор-1-(3-пиридинил)-1*H*-пиразол-4-ил]-*N*-этил-3-[(3,3,3-трифторпропил)сульфинил]-пропанамид и (-)-*N*-[3-хлор-1-(3-пиридинил)-1*H*-пиразол-4-ил]-*N*-этил-3-[(3,3,3-трифторпропил)сульфинил]-пропанамид (известный из WO 2013/162715 A2, WO 2013/162716 A2, US 2014/0213448 A1) (CAS 1477923-37-7), 5-[(2*E*)-3-хлор-2-пропен-1-ил]амино]-1-[2,6-дихлор-4-(трифторметил)фенил]-4-[(трифторметил)сульфинил]-1*H*-пиразол-3-карбонитрил (известный из CN 101337937 A) (CAS 1105672-77-2), 3-

бром-*N*-[4-хлор-2-метил-6-[(метиламино)тиоксометил]фенил]-1-(3-хлор-2-пиридинил)-1*H*-пиразол-5-карбоксамид, (Liudaibenjiaxuanan, известный из CN 103109816 A) (CAS 1232543-85-9); *N*-[4-хлор-2-[(1,1-диметилэтил)амино]карбонил]-6-метилфенил]-1-(3-хлор-2-пиридинил)-3-(фторметокси)-1*H*-Пиразол-5-карбоксамид (известный из WO 2012/034403 A1) (CAS 1268277-22-0), *N*-[2-(5-амино-1,3,4-тиадиазол-2-ил)-4-хлор-6-метилфенил]-3-бром-1-(3-хлор-2-пиридинил)-1*H*-пиразол-5-карбоксамид (известный из WO 2011/085575 A1) (CAS 1233882-22-8), 4-[3-[2,6-дихлор-4-[(3,3-дихлор-2-пропен-1-ил)окси]феноксипропокси]-2-метокси-6-(трифторметил)-пиримидин (известный из CN 101337940 A) (CAS 1108184-52-6); (2*E*)- и 2(*Z*)-2-[2-(4-цианофенил)-1-[3-(трифторметил)фенил]этилиден]-*N*-[4-(дифторметокси)фенил]-гидразинкарбоксамид (известный из CN 101715774 A) (CAS 1232543-85-9); эфир 3-(2,2-дихлорэтенил)-2,2-диметил-4-(1*H*-бензимидазол-2-ил)фенил-циклопропанкарбоновой кислоты (известный из CN 103524422 A) (CAS 1542271-46-4); метиловый эфир (4*aS*)-7-хлор-2,5-дигидро-2-[[[(метоксикарбонил)[4-[(трифторметил)тио]фенил]амино]карбонил]-индено[1,2-*e*][1,3,4]оксадиазин-4*a*(3*H*)-карбоновой кислоты (известный из CN 102391261 A) (CAS 1370358-69-2); 6-деокси-3-*O*-этил-2,4-ди-*O*-метил-, 1-[*N*-[4-[1-[4-(1,1,2,2,2-пентафторэтокси)фенил]-1*H*-1,2,4-триазол-3-ил]фенил]карбамат]- α -L-маннопираноза (известная из US 2014/0275503 A1) (CAS 1181213-14-8); 8-(2-циклопропилметокси-4-трифторметил-феноксид)-3-(6-трифторметил-пиридазин-3-ил)-3-аза-бицикло[3.2.1]октан (CAS 1253850-56-4), (8-*анти*)-8-(2-циклопропилметокси-4-трифторметил-феноксид)-3-(6-трифторметил-пиридазин-3-ил)-3-аза-бицикло[3.2.1]октан (CAS 933798-27-7), (8-*сун*)-8-(2-циклопропилметокси-4-трифторметил-феноксид)-3-(6-трифторметил-пиридазин-3-ил)-3-аза-бицикло[3.2.1]октан (известный из WO2007/040280 A1, WO 2007040282 A1) (CAS 934001-66-8), *N*-[3-хлор-1-(3-пиридинил)-1*H*-пиразол-4-ил]-*N*-этил-3-[(3,3,3-трифторпропил)тио]-пропанамид (известный из WO 2015/058021 A1, WO 2015/058028 A1) (CAS 1477919-27-9) и *N*-[4-(аминотиоксометил)-2-метил-6-[(метиламино)карбонил]фенил]-3-бром-1-(3-хлор-2-пиридинил)-1*H*-пиразол-5-карбоксамид (известный из CN 103265527 A) (CAS 1452877-50-7), 5-(1,3-диоксан-2-ил)-4-[[4-(трифторметил)фенил]метокси]-пиримидин (известный из WO 2013/115391 A1) (CAS 1449021-97-9), 3-(4-хлор-2,6-диметилфенил)-4-гидрокси-8-метокси-1-метил-1,8-дiazаспиро[4.5]дек-3-ен-2-он (известный из WO 2010/066780 A1, WO 2011/151146 A1) (CAS 1229023-34-0), 3-(4-

хлор-2,6-диметилфенил)-8-метокси-1-метил-1,8-дiazаспиро[4.5]декан-2,4-дион (известный из WO 2014/187846 A1) (CAS 1638765-58-8), этиловый эфир 3-(4-хлор-2,6-диметилфенил)-8-метокси-1-метил-2-оксо-1,8-дiazаспиро[4.5]дек-3-ен-4-ил-карбоновой кислоты (известный из WO 2010/066780 A1, WO 2011151146 A1) (CAS 1229023-00-0), N-[1-[(6-хлор-3-пиридинил)метил]-2(1*H*)-пиридилиден]-2,2,2-трифтор-ацетамид (известный из DE 3639877 A1, WO 2012029672 A1) (CAS 1363400-41-2), [N(*E*)]-N-[1-[(6-хлор-3-пиридинил)метил]-2(1*H*)-пиридилиден]-2,2,2-трифтор-ацетамид, (известный из WO 2016005276 A1) (CAS 1689566-03-7), [N(*Z*)]-N-[1-[(6-хлор-3-пиридинил)метил]-2(1*H*)-пиридилиден]-2,2,2-трифтор-ацетамид, (CAS 1702305-40-5), 3-эндо-3-[2-пропокси-4-(трифторметил)фенокси]-9-[[5-(трифторметил)-2-пиридинил]окси]-9-азабицикло[3.3.1]нонан (известный из WO 2011/105506 A1, WO 2016/133011 A1) (CAS 1332838-17-1).

Примерами гербицидов, которые могут быть смешаны с соединением формулы (I) и композицией по изобретению, являются:

ацетохлор, ацифлуорфен, ацифлуорфен-натрий, аклонифен, алахлор, аллидохлор, аллоксидим, аллоксидим-натрий, аметрин, амикарбазон, амидохлор, амидосульфурон, 4-амино-3-хлор-5-фтор-6-(7-фтор-1*H*-индол-6-ил)пиридин-2-карбоновая кислота, аминоклопирахлор, аминоклопирахлор-калий, аминоклопирахлор-метил, аминоклопирахлор-натрий, амитрол, сульфамат аммония, анилофос, асулам, атразин, азафенидин, азимсульфурон, бифлутамид, беназолин, беназолин-этил, бенфлуралин, бенфурезат, бенсульфурон, бенсульфурон-метил, бенсулид, бентазон, бензобициклон, бензофенап, бициклопирон, бифенокс, биланафос, биланафос-натрий, биспирибак, биспирибак-натрий, биксозон, бромацил, бромбутид, бромфеноксим, бромксинил, бромксинил-бутират, -калий, -гептаноат, и -октаноат, бузоксинон, бутахлор, бутафенацил, бутаифом, бутенахлор, бутралин, бутроксидим, бутилат, кафенстрол, карбетамид, карфентразон, карфентразон-этил, хлорамбен, хлорбромурон, 1-{2-хлор-3-[(3-циклопропил-5-гидрокси-1-метил-1*H*-пиразол-4-ил)карбонил]-6-(трифторметил)фенил}пиперидин-2-он, 4-{2-хлор-3-[(3,5-диметил-1*H*-пиразол-1-ил)метил]-4-(метилсульфонил)бензоил}-1,3-диметил-1*H*-пиразол-5-ил-1,3-диметил-1*H*-пиразол-4-карбоксилат, хлорфенак, хлорфенак-натрий, хлорфенпроп, хлорфлуренол, хлорфлуренол-метил, хлоридазон, хлоримурон, хлоримурон-этил, 2-[2-хлор-4-(метилсульфонил)-3-(морфолин-4-илметил)бензоил]-3-

гидроксциклогекс-2-ен-1-он, 4-{2-хлор-4-(метилсульфонил)-3-[(2,2,2-трифторэтокс)метил]-бензоил}-1-этил-1Н-пиразол-5-ил-1,3-диметил-1Н-пиразол-4-карбоксилат, хлорфталим, хлортолурун, хлортал-диметил, 3-[5-хлор-4-(трифторметил)пиридин-2-ил]-4-гидрокси-1-метилимидазолидин-2-он, хлорсульфурон, цинидон, цинидон-этил, цинметилин, циноссульфурон, клацифос, клетодим, клодинафоп, клодинафоп-пропаргил, кломазон, клемеппроп, клопиралид, клорансулам, клорансулам-метил, кумилурон, цианамид, цианазин, циклоат, циклопиранил, циклопириморат, циклосульфамурон, циклоксидим, цигалофоп, цигалофоп-бутил, ципразин, 2,4-D, 2,4-D-бутотил, -бутил, -диметиламмоний, -диоламин, -этил, -2-этилгексил, -изобутил, -изооктил, -изопропиламмоний, -калий, -триизопропаноламмоний, и -троламин, 2,4-DB, 2,4-DB-бутил, -диметиламмоний, -изооктил, -калий, и -натрий, даймурон (димрон), далапон, дазомет, н-деканол, десмедифам, детосил-пиразолат (DTP), дикамба, дихлобенил, дихлорпроп, дихлорпроп-Р, диклофоп, диклофоп-метил, диклофоп-Р-метил, диклосулам, дифензокват, дифлуфеникан, дифлуфензопир, дифлуфензопир-натрий, димефурон, димепиперат, диметахлор, диметаметрин, диметенамид, диметенамид-Р, 3-(2,6-диметилфенил)-6-[(2-гидрокси-6-оксоциклогекс-1-ен-1-ил)карбонил]-1-метилхиназолин-2,4(1Н,3Н)-дион, 1,3-диметил-4-[2-(метилсульфонил)-4-(трифторметил)бензоил]-1Н-пиразол-5-ил-1,3-диметил-1Н-пиразол-4-карбоксилат, диметрасульфурон, динитрамин, динотерб, дифенамид, дикват, дикват-дибромид, дитиопир, диурон, DMPA, DNOC, эндотал, ЕРТС, эспрокарб, эталфлуралин, этаметсульфурон, этаметсульфурон-метил, этиоцин, этофумезат, этоксифен, этоксифен-этил, этокисульфурон, этобензанид, этил-[(3-{2-хлор-4-фтор-5-[3-метил-2,6-диоксо-4-(трифторметил)-3,6-дигидропиримидин-1(2Н)-ил]фенокси}пиридин-2-ил)окси]ацетат, F-9960, F-5231, т.е. N-{2-хлор-4-фтор-5-[4-(3-фторпропил)-5-оксо-4,5-дигидро-1Н-тетразол-1-ил]фенил}этансульфонамид, F-7967, i. e. 3-[7-хлор-5-фтор-2-(трифторметил)-1Н-бензимидазол-4-ил]-1-метил-6-(трифторметил)пиримидин-2,4(1Н,3Н)-дион, феноксапроп, феноксапроп-Р, феноксапроп-этил, феноксапроп-Р-этил, феноксасульфон, фенквинотрион, фентразамид, флампроп, флампроп-М-изопропил, флампроп-М-метил, флазасульфурон, флорасулам, флуазифоп, флуазифоп-Р, флуазифоп-бутил, флуазифоп-Р-бутил, флукарбазон, флукарбазон-натрий, флуцетосульфурон, флухлоралин, флуфенацет, флуфенпир, флуфенпир-этил, флуметсулам, флумиклорак, флумиклорак-пентил, флумиоксазин, флуометурон, флуренол,

флуренол-бутил, -диметиламмоний и -метил, фторгликофен, фторгликофен-этил, флупропанат, флупирсульфурон, флупирсульфурон-метил-натрий, флуридон, флуорохлоридон, флуорокспир, флуорокспир-мептил, флуртамон, флутиацет, флутиацет-метил, фомесафен, фомесафен-натрий, форамсульфурон, фосамин, глюфосинат, глюфосинат-аммоний, глюфосинат-Р-натрий, глюфосинат-Р-аммоний, глюфосинат-Р-натрий, глифосат, глифосат-аммоний, -изопропиламмоний, -диаммоний, -диметиламмоний, -калий, -натрий, и -тримезиум, Н-9201, т.е. О-(2,4-диметил-6-нитрофенил) О-этил изопропилфосфорамидотиоат, галауксифен, галауксифен-метил, галосафен, галосульфурон, галосульфурон-метил, галоксифоп, галоксифоп-Р, галоксифоп-этоксиэтил, галоксифоп-Р-этоксиэтил, галоксифоп-метил, галоксифоп-Р-метил, гексазинон, НW-02, т.е. 1-(диметоксифосфорил) этил-(2,4-дихлорфенокс)ацетат, 4-гидрокси-1-метокси-5-метил-3-[4-(трифторметил)пиридин-2-ил]имидазолидин-2-он, 4-гидрокси-1-метил-3-[4-(трифторметил)пиридин-2-ил]имидазолидин-2-он, (5-гидрокси-1-метил-1Н-пиразол-4-ил)(3,3,4-триметил-1,1-диоксидо-2,3-дигидро-1-бензотиофен-5-ил)methanon, 6-[(2-гидрокси-6-оксоциклогекс-1-ен-1-ил)карбонил]-1,5-диметил-3-(2-метилфенил)хиназолин-2,4(1Н,3Н)-дион, имазаметабенз, имазаметабенз-метил, имазамокс, имазамокс-аммоний, имазапик, имазапик-аммоний, имазапир, имазапир-изопропиламмоний, имазаквин, имазаквин-аммоний, имазетапир, имазетапир-иммоний, имазосульфурон, инданофан, индазифлам, йодосульфурон, йодосульфурон-метил-натрий, иоксинил, иоксинил-октаноат, -калий и -натрий, ипфенкарбазон, изопротурон, изоурон, изоксабен, изоксафлутол, карбутилат, КУН-043, т.е. 3-([5-(дифторметил)-1-метил-3-(трифторметил)-1Н-пиразол-4-ил]метил)сульфонил)-5,5-диметил-4,5-дигидро-1,2-оксазол, кетоспирадокс, лактофен, ленацил, линурон, МСРА, МСРА-бутотил, -диметиламмоний, -2-этилгексил, -изопропиламмоний, -калий, и -натрий, МСРВ, МСРВ-метил, -этил, и -натрий, мекопроп, мекопроп-натрий, и -бутотил, мекопроп-Р, мекопроп-Р-бутотил, -диметиламмоний, -2-этилгексил, и -калий, мефенацет, мефлуидид, мезосульфурон, мезосульфурон-метил, мезотрион, метабензтиазурон, метам, метамифоп, метамитрон, метазахлор, метазосульфурон, метабензтиазурон, метиопирсульфурон, метиозолин, 2-([2-(метоксиэтокси)метил]-6-(трифторметил)пиридин-3-ил)карбонил)циклогексан-1,3-дион, метил изотиоцианат, 1-метил-4-[(3,3,4-триметил-1,1-диоксидо-2,3-дигидро-1-бензотиофен-5-ил)карбонил]-1Н-пиразол-5-илпропан-1-сульфонат,

метобромурон, метолахлор, S-метолахлор, метосулам, метоксурон, метрибузин, метсульфурон, метсульфурон-метил, молинат, монолинурон, моноссульфурон, моноссульфурон-эфир, МТ-5950, т.е. N-(3-хлор-4-изопропилфенил)-2-метилпентанамид, NGGC-011, напропамид, NC-310, т.е. [5-(бензилокси)-1-метил-1H-пиразол-4-ил](2,4-дихлорфенил)метанон, небурон, никосульфурон, нонановая кислота (пеларгоновая кислота), норфлуразон, олеиновая кислота (жирные кислоты), орбенкарб, ортосульфамурон, оризалин, оксадиаргил, оксадиазон, оксасульфурон, оксацикломефон, оксифлуорфен, паракват, паракват дихлорид, пебулат, пендиметалин, пеноксулам, пентахлорфенол, пентоксазон, петоксамид, нефтяные масла, фенмедифам, пиклорам, пиколинафен, пиноксаден, пиперофос, претилахлор, примисульфурон, примисульфурон-метил, продиамин, профоксидим, прометон, прометрин, пропахлор, пропанил, пропаквизафоп, пропазин, профам, пропизохлор, пропоксикарбазон, пропоксикарбазон-натрий, пропирисульфурон, пропизамид, просульфокарб, просульфурон, пираклонил, пирафлуфен, пирафлуфен-этил, пирасульфотол, пиразолинат (пиразолат), пиразосульфурон, пиразосульфурон-этил, пиразоксифен, пирибамбенз, пирибамбенз-изопропил, пирибамбенз-пропил, пирибензоксим, пирибутикарб, пиридафол, пиридат, пирифталид, пириминобак, пириминобак-метил, пиримисульфам, пиритиобак, пиритиобак-натрий, пироксасульфам, пироксулам, квинклорак, квинмерак, хинокламин, квизалофоп, квизалофоп-этил, квизалофоп-Р, квизалофоп-Р-этил, квизалофоп-Р-тефурил, QYM-201, QYR-301, римсульфурон, сафлуфенацил, сетоксидим, сидурон, симазин, симетрин, SL-261, сулкотрион, сульфентразон, сульфометурон, сульфометурон-метил, сульфосульфурон, SYN-523, SYP-249, т.е. 1-этоксиг-3-метил-1-оксобут-3-ен-2-ил 5-[2-хлор-4-(трифторметил)феноксиг]-2-нитробензоат, SYP-300, т.е. 1-[7-фтор-3-оксо-4-(проп-2-ин-1-ил)-3,4-дигидро-2H-1,4-бензоксазин-6-ил]-3-пропил-2-тиоксоимидазолидин-4,5-дион, 2,3,6-ТВА, ТСА (трихлоруксусная кислота), ТСА-натрий, тебутиурон, тефурилтрион, темботрион, тепралоксидим, тербацил, тербукарб, тербуметон, тербутилазин, тербутрин, тетфлупиролимет, тенилхлор, тиазопир, тиенкарбазон, тиенкарбазон-метил, тифенсульфурон, тифенсульфурон-метил, тиобенкарб, тиафенацил, толпиралат, топрамезон, тралкоксидим, триафамон, три-аллат, триасульфурон, триазифлам, трибенурон, трибенурон-метил, триклопир, триэтазин, трифлорисульфурон, трифлорисульфурон-натрий, трифлудимоксазин, трифлуралин, трифлусульфурон, трифлусульфурон-метил,

тритосульфурон, сульфат мочевины, вернолат, ZJ-0862, т.е. 3,4-дихлор-N-{2-[(4,6-диметоксипиримидин-2-ил)окси]бензил}анилин.

Примерами регуляторов роста растений являются:

Ацибензолар, ацибензолар-S-метил, 5-аминолевулиновая кислота, анцимидол, 6-бензиламинопурин, Брассинолид, катехин, хлормекват хлорид, клопроп, цикланилид, 3-(циклопроп-1-енил) пропионовая кислота, даминозид, дазомет, н-деканол, дикегулак, дикегулак-натрий, эндотал, эндотал-дикалий, -динатрий, и -моно(N,N-диметилалкиламмоний), этефон, флуметралин, флуренол, флуренол-бутил, флурпримидол, форхлорфенурон, гиббереллиновая кислота, инабенфид, индол-3-уксусная кислота (IAA), 4-индол-3-илмасляная кислота, изопротиолан, пробеназол, жасмоновая кислота, гидразид малеиновой кислоты, мепикват хлорид, 1-метилциклопропен, метиловый жасмонат, 2-(1-нафтил)ацетамид, 1-нафтилуксусная кислота, 2- нафтилоксиуксусная кислота, нитрофенолат-смесь, паклобутразол, N-(2-фенилэтил)-бета-аланин, N-фенилфаламовая кислота, прогексадион, прогексадион-кальций, прогидрожасмон, салициловая кислота, стриголактон, техназен, тидиазурон, триаконтанол, тринексапак, тринексапак-этил, тситодеф, униконазол, униконазол-Р.

Примерами антидотов, которые могут быть смешаны с соединением формулы (I) и композицией согласно изобретению, являются, например, беноксакор, клоквинтоцет (-мексил), циометринил, ципросульфамид, дихлормид, фенхлоразол (-этил), фенклорим, флуразол, флуксофеним, фурилазол, изоксадифен (-этил), мефенпир (-диэтил), нафталиевый ангидрид, оксабетринил, 2-метокси-N-({4-[(метилкарбамоил)амино]фенил}сульфонил)бензамид (CAS 129531-12-0), 4-(дихлорацетил)-1-окса-4-азаспиро[4.5]декан (CAS 71526-07-3), 2,2,5-триметил-3-(дихлорацетил)-1,3-оксазолидин (CAS 52836-31-4).

Примеры ингибиторов нитрификации, которые могут быть смешаны с соединением формулы (I) и композицией согласно изобретению, выбраны из группы, состоящей из 2-(3,4-диметил-1 Н-пиразол-1-ил) янтарной кислоты, 2-(4,5-диметил-1 Н-пиразол-1-ил)янтарной кислоты, 3,4-диметилпиразолий гликолята, 3,4-диметилпиразолий цитрата, 3,4-диметилпиразолий лактата, 3,4-диметилпиразолий манделата, 1,2,4-триазола, 4-хлор-3-метилпиразола, N-((3(5)-

метил-1Н-пиразол-1-ил)метил)ацетамида, N-((3(5)-метил-1 Н-пиразол-1-ил)метил)формамида, N-((3(5),4-диметилпиразол-1-ил)метил)формамида, N-((4-хлор-3(5)-метил-пиразол-1-ил)метил)формамида; аддуктов реакции дициандиамида, мочевины и формальдегида, аддуктов триазонил-формальдегид-дициандиамида, 2-циано-1-((4-оксо-1,3,5-триазинан-1-ил)метил)гуанидин, 1-((2-цианогуанидино)метил)мочевины, 2-циано-1-((2-цианогуанидино)метил)-гуанидина, 2-хлор-6-(трихлорметил)-пиридина (нитрапирина или N-serve), дициандиамида, 3,4-диметилпиразол фосфата, 4,5-диметилпиразол фосфата, 3,4-диметилпиразола, 4,5-диметилпиразола, аммонийтисульфата, неема, продуктов на основе ингредиентов неема, линоленовой кислоты, альфа-линоленовой кислоты, метил р-коумарата, метилферулата, метил 3-(4-гидроксифенил) пропионата, каранджина, брахиалактона, р-бензохинон сорголеона, 4-амино-1,2,4-триазол гидрохлорида, 1-амидо-2-тиомочевины, 2-амино-4-хлор-6-метилпиримидина, 2-меркапто-бензотиазола, 5-этоксиг-3-трихлорметил-1,2,4-тиодиазола (терразола, этридиязола), 2-сульфаниламидотиазола, 3-метилпиразола, 1,2,4-триазол тиомочевины, цианамида, меламина, цеолитового порошка, катехола, бензохинона, тетрабората натрия, аллилтиомочевины, солей хлората, и сульфата цинка.

Соединение формулы (I) и композиция по изобретению могут быть объединены с одним или более полезными для сельского хозяйства веществами.

К примерам полезных для сельского хозяйства веществ можно отнести биостимуляторы, регуляторы роста растений, сигнальные молекулы растений, усилители роста, микробные стимулирующие молекулы, биомолекулы, почвенные добавки, питательные вещества, усилители питательных веществ для растений и т.д., такие как липохитоолигосахариды (LCO), хитоолигосахариды (CO), хитиновые соединения, флавоноиды, жасмоновая кислота или ее производные (например, жасмонаты), цитокинины, ауксины, гиббереллины, абсциновая кислота, этилен, брассиностероиды, салицилаты, макро- и микроэлементы, линолевая кислота или ее производные, линоленовая кислота или ее производные, каррикины и полезные микроорганизмы (например, *Rhizobium* spp., *Bradyrhizobium* spp., *Sinorhizobium* spp., *Azorhizobium* spp., *Glomus* spp., *Gigaspora* spp., *Hymenoscyphous* spp., *Oidiodendron* spp., *Laccaria* spp., *Pisolithus* spp., *Rhizopogon* spp., *Scleroderma* spp., *Rhizoctonia* spp., *Acinetobacter* spp., *Arthrobacter* spp., *Arthrobotrys* spp., *Aspergillus* spp., *Azospirillum* spp., *Bacillus* spp., *Burkholderia* spp.,

Candida spp., *Chryseomonas* spp., *Enterobacter* spp., *Eupenicillium* spp., *Exiguobacterium* spp., *Klebsiella* spp., *Kluyvera* spp., *Microbacterium* spp., *Mucor* spp., *Paecilomyces* spp., *Paenibacillus* spp., *Penicillium* spp., *Pseudomonas* spp., *Serratia* spp., *Stenotrophomonas* spp., *Streptomyces* spp., *Streptosporangium* spp., *Swaminathania* spp., *Thiobacillus* spp., *Torulospora* spp., *Vibrio* spp., *Xanthobacter* spp., *Xanthomonas* spp., и т.д.), и их комбинации.

Способы и области применения

Соединение формулы (I) и композиция по изобретению обладают сильной микробицидной активностью и/или способностью модулировать защиту растений. Они могут использоваться для борьбы с нежелательными микроорганизмами на растениях, такими как нежелательные грибы и бактерии. Они могут особенно эффективно использоваться для защиты растений (для борьбы с микроорганизмами, вызывающими заболевания растений) или для защиты материалов (например, промышленных материалов, древесины, товаров при хранении), как более подробно описано ниже. В частности, соединение формулы (I) и композиция по соединению могут использоваться для защиты семян, прорастающих растений, рассады, растений, частей растений, плодов, урожая и/или почвы, на которой произрастают растения, от нежелательных микроорганизмов.

При использовании по тексту настоящего документа термин «борьба» включает профилактическую обработку от нежелательных микроорганизмов, а также обработку для лечения от нежелательных микроорганизмов или обработку для уничтожения нежелательных микроорганизмов. Нежелательными микроорганизмами могут быть патогенные бактерии, патогенные вирусы, патогенные оомицеты или патогенные грибы, в частности, фитопатогенные бактерии, фитопатогенные вирусы, фитопатогенные оомицеты или фитопатогенные грибы. Как подробно описано ниже, эти фитопатогенные микроорганизмы являются возбудителями широкого спектра заболеваний растений.

Более конкретно, соединение формулы (I) и композиция по изобретению могут быть использованы в качестве фунгицидов. Для целей настоящего описания термин «фунгицид» относится к соединению или к композиции, которые могут

использоваться для защиты растений с целью борьбы с нежелательными грибами, такими как плазмодиофоромицеты, хитридиомицеты, зигомицеты, аскомицеты, базидиомицеты и дейтеромицеты и/или для борьбы с оомицетами.

Соединение формулы (I) и композиция по изобретению также могут использоваться в качестве антибактериального средства. В частности, они могут быть использованы для защиты растений, например, для борьбы с нежелательными бактериями, такими как бактерии семейств *Pseudomonadaceae*, *Rhizobiaceae*, *Xanthomonadaceae*, *Enterobacteriaceae*, *Corynebacteriaceae* и *Streptomycetaceae*.

Соединение формулы (I) и композиция по изобретению также могут использоваться в качестве противовирусного средства для защиты растений. Например, соединение формулы (I) и композиция по изобретению могут обладать активностью в отношении заболеваний, вызываемых вирусами растений, таким как вирус мозаики табака (TMV), вирус погремковости табака, вирус травянистой низкорослости табака (TStuV), вирус курчавости листьев табака (VLCV), вирус прожилковой мозаики табака (TVBMV), вирус некротической карликовости табака (TNDV), вирус штриховатости табака (TSV), вирус картофеля X (PVX), вирусы картофеля Y, S, M и A, вирус аукуба-мозаики картофеля (PAMV), вирус метельчатости верхушки картофеля (PMTV), вирус скручивания листьев картофеля (PLRV), вирус мозаики люцерны (AMV), вирус мозаики огурца (CMV), вирус зеленой крапчатой мозаики огурца (CGMMV), вирус желтизны огурца (CuYV), вирус мозаики арбуза (WMV), вирус бронзовости томата (TSWV), вирус кольцевой пятнистости томата (TomRSV), вирус мозаики сахарного тростника (SCMV), вирус карликовости риса, вирус штриховатости риса, вирус чёрнополосатой карликовости риса, вирус крапчатости клубники (SMoV), вирус прожилковой мозаики клубники (SVBV), слабого пожелтения краев клубники (SMYEV), вирус складчатости клубники (SCrV), вирус широкого увядания бобов (BBWV) и вирус некротических пятен дыни (MNSV).

Настоящее изобретение также касается способа борьбы с нежелательными микроорганизмами, такими как нежелательные грибы, оомицеты и бактерии на растениях, который включает этап нанесения, по меньшей мере, одного соединения формулы (I) или по меньшей мере одной композиции по изобретению на микроорганизмы и/или на место их обитания (на растения, части растений, семена, плоды или почву, на которой произрастают растения).

Как правило, когда соединение формулы (I) и композиция по изобретению используют в способах лечения или защиты для борьбы с фитопатогенными грибами и/или фитопатогенными оомицетами, осуществляется обработка эффективным нефитотоксичным количеством соединения формулы (I) и композиции, содержащей соединение формулы (I), растений, частей растений, фруктов, семян или почвы или субстрата, в котором растут растения. Подходящие субстраты, которые могут быть использованы для выращивания растений включают субстраты на неорганической основе, такие как минеральная вата, в частности, каменная вата, перлит, песок или гравий; органические субстраты, такие как торф, сосновая кора или опилки; и субстраты на основе нефти, такие как полимерные пены или пластиковые шарики. Выражение «эффективное нефитотоксичное количество» означает такое количество, которое достаточно эффективно для борьбы с грибковым заболеванием культуры или для полного устранения грибкового заболевания, и которое при этом не вызывает каких бы то ни было заметных симптомов фитотоксичности. Такое количество может варьироваться в широком диапазоне, в зависимости от того, от какого вида грибов осуществляется защита, от вида культуры, ее стадии роста, от климатических условий и от соответствующего используемого соединения или от композиции по изобретению. Такое количество может быть определено с помощью систематических полевых испытаний, известных специалистам.

Растения и части растений

Соединение формулы (I) и композиция по изобретению могут применяться к любым растениям или частям растений.

Термин «растения» включает все растения и популяции растений, такие как желательные и нежелательные дикорастущие растения или сельскохозяйственные культуры (включая свободнорастущие сельскохозяйственные культуры). К сельскохозяйственным культурам могут относиться растения, которые могут быть получены путем обычного разведения растений и способов оптимизации, или способами биотехнологии и генной инженерии, или путем сочетания данных методов, включая генетически модифицированные растения (ГМО или трансгенные растения) и их сорта, которые могут быть защищены и не могут быть незащищены правами растениеводов-селекционеров.

Под термином «сорта растений» подразумеваются растения, обладающие новыми свойствами («характеристиками»), которые были получены методами обычного разведения, мутагенезом или с применением технологии рекомбинантных ДНК. Это могут быть сорта, разновидности, био- или генотипы.

Под частями растения понимаются все части и органы растения, которые располагаются над и под землей, такие как побеги, листья, иглы, цветоножки, стебли, цветки, плодовые тела, плоды, семена, корни, клубни и корневища. К частям растений также относится собранный материал и материал для вегетативного и генеративного размножения, например, черенки, клубни, корневища, побеги и семена.

Растения, которые могут быть обработаны в соответствии с методами настоящего изобретения, включают следующие: хлопок, лен, виноград, фрукты, овощи, такие как *Rosaceae sp.* (например, семечковые плоды, такие как яблоки и груши, но также и косточковые плоды, такие как абрикосы, вишни, миндальные орехи и персики, а также бескосточковые ягоды, такие как клубника), *Ribesioidea sp.*, *Juglandaceae sp.*, *Betulaceae sp.*, *Anacardiaceae sp.*, *Fagaceae sp.*, *Moraceae sp.*, *Oleaceae sp.*, *Actinidaceae sp.*, *Lauraceae sp.*, *Musaceae sp.* (например, банановые деревья и плантации),), *Rubiaceae sp.* (например, кофе), *Theaceae sp.*, *Sterculiaceae sp.*, *Rutaceae sp.* (например, лимоны, апельсины и грейпфруты); *Solanaceae sp.* (например, помидоры), *Liliaceae sp.*, *Asteraceae sp.* (например, салат-латук), *Umbelliferae sp.*, *Cruciferae sp.*, *Chenopodiaceae sp.*, *Cucurbitaceae sp.* (например, огурец), *Alliaceae sp.* (например, лук-порей, лук), *Papilionaceae sp.* (например, горох); основные сельскохозяйственные культуры, такие как *Gramineae sp.* (например, маис, дерновые культуры, злаки, такие как пшеница, рожь, рис, ячмень, овес, просо и тритикале), *Asteraceae sp.* (например, подсолнух), *Brassicaceae sp.* (например, белокочанная капуста, краснокочанная капуста, брокколи, цветная капуста, брюссельская капуста, китайская капуста, кольраби, редис и масличный рапс, горчица, хрен и кресс-салат), *Fabaceae sp.* (например, бобы, арахис), *Papilionaceae sp.* (например, соя), *Solanaceae sp.* (например, картофель), *Chenopodiaceae sp.* (например, сахарная свекла, кормовая свекла, листовая свекла, свекла); полезные и декоративные растения для садов и лесопосадок; а также генетически модифицированные разновидности данных растений.

Растения и сорта растений, которые могут подвергаться обработке описанными способами, включают растения, которые являются устойчивыми к одному или нескольким факторам биотического стресса, т.е. указанные растения проявляют повышенную устойчивость по отношению к животным-вредителям и микробиальным вредителям, например, к нематодам, насекомым, клещам, фитопатогенным грибам, бактериям, вирусам и/или вириоидам.

Растения и сорта растений, которые могут быть обработаны описанными способами, включают такие растения, которые являются устойчивыми к одному или нескольким факторам абиотического стресса. Условия абиотического стресса включают, например, засуху, высокие и низкие температуры, осмотический стресс, затопление, повышенная засоленность почвы, повышенное присутствие минералов в почве, присутствие экстраординарных количеств озона, избыточный свет, недостаток азотных или фосфорных питательных веществ, отсутствие затенения.

Растения и сорта растений, которые могут быть обработаны описанными способами, включают такие растения, которые характеризуются характеристиками улучшенной урожайности. Улучшенная урожайность указанных растений может быть результатом, например, улучшенных показателей физиологии, роста и развития растения, таких как эффективность использования воды, эффективность влагоудерживания, улучшенная усвояемость азота, усиленная ассимиляция углерода, улучшенный фотосинтез, повышенная всхожесть и ускоренное созревание. На урожайность, кроме того, может оказывать влияние улучшение организации растений (при стрессовых и нестрессовых условиях), включая, помимо прочего, раннее начало цветения, контроль цветения для получения гибридных семян, всхожесть, размер растения, количество междоузлий и расстояние между ними, рост корневой системы, размер семян, размер плодов, размер стручков, количество стручков или колосьев, количество семян в стручке или колосе, масса семени, увеличение процентного отношения выполненных семян, сниженное осыпание семян, сниженное растрескивание стручков и устойчивость к полеганию. Другие характеристики урожайности включают состав семян, например, содержание и композиция углеводов, например, хлопок или крахмал, содержание белков, масличность и состав жиров, пищевая ценность, сниженное содержание не обладающих пищевой ценностью веществ, улучшенная пригодность для переработки и лучшая устойчивость при хранении.

Растения и сорта растений, которые могут быть обработаны описанными способами, включают гибридные растения, которые уже проявляют признаки гетерозиса или гибридной силы, что в результате приводит в целом к улучшенной урожайности, силе, жизнеспособности и устойчивости к факторам биотического и абиотического стресса.

Трансгенные растения, обработка семян и линии интеграции

Соединение формулы (I) можно успешно использовать для обработки трансгенных растений, культурных сортов растений или частей растений, которые получили генетический материал, придающий выгодные и/или полезные свойства (признаки) этим растениям, культурным сортам растений или частям растений. Таким образом, предполагается, что настоящее изобретение может быть объединено с одним или более рекомбинантными признаками или трансгенной(ыми) линией(ями) или их комбинацией. Для целей настоящей заявки трансгенную линию создают путем встраивания определенной молекулы рекомбинантной ДНК в определенную позицию (локус) в хромосоме генома растения. Вставка создает новую последовательность ДНК, называемую «событием», и характеризуется вставленной молекулой рекомбинантной ДНК и некоторым количеством геномной ДНК, непосредственно примыкающим к обоим концам вставленной ДНК или граничащим с ними. Такие признаки или трансгенные линии включают, помимо прочего, устойчивость к вредителям, эффективность использования воды, урожайность, засухоустойчивость, качество семян, улучшенную пищевую ценность, производство гибридных семян и устойчивость к гербицидам, в которых признак измеряется по отношению к растению, не имеющему такого признака или трансгенной линии. Конкретными примерами таких предпочтительных и/или полезных свойств (признаков) являются лучший рост растений, сила роста, стрессоустойчивость, устойчивость к полеганию, поглощение питательных веществ, питание растений и/или урожайность, в частности, улучшенный рост, повышенная устойчивость к высоким или низким температурам, повышенная устойчивость к засухе или уровню воды или засоленности почвы, улучшенное цветение, более легкий сбор урожая, ускоренное созревание, более высокая урожайность, более высокое качество и/или более высокая пищевая ценность собранной продукции, лучший срок хранения и/или технологичность собранных продуктов и повышение устойчивости к

животным и микробным вредителям, таким как насекомые, паукообразные, нематоды, клещи, слизни и улитки.

Среди последовательностей ДНК, кодирующих белки, которые передают свойства устойчивости к таким животным и микробным вредителям, в частности к насекомым, необходимо упомянуть генетический материал от *Bacillus thuringiensis*, кодирующий белки Bt, которые широко описаны в литературе и хорошо известны специалистам. Необходимо упомянуть также белки, выделенные из бактерий, таких как *Photorhabdus* (WO97/17432 и WO98/08932). В частности, будут упомянуты белки Bt Cry или VIP, которые включают белки CryIA, CryIAb, CryIAc, CryIIA, CryIIIA, CryIIIB2, Cry9c Cry2Ab, Cry3Bb и CryIF или их токсичные фрагменты, а также их гибриды или комбинации, в частности, CryIF. белок или гибриды, полученные из белка CryIF (например, гибридные белки CryIA-CryIF или их токсичные фрагменты), белки типа CryIA или их токсичные фрагменты, впоследствии белок CryIAc или гибриды, полученные из белка CryIAc (например, гибридные белки CryIAbCryIAc) или белок CryIAb или Bt2 или их токсичные фрагменты, белки Cry2Ae, Cry2Af или Cry2Ag или их токсичные фрагменты, белок CryIA.105 или его токсичный фрагмент, белок VIP3Aa19, белок VIP3Aa20, белки VIP3A, производимые в COT202, или линии COT203 хлопка, белок VIP3Aa или его токсичный фрагмент, как описано в Estruch et al. (1996), Proc Natl Acad Sci US A. 28;93(11):5389-94, белки Cry, как описано в WO 2001/47952, инсектицидные белки из *Xenorhabdus* (как описано в WO 98/50427), *Serratia* (в частности, из *S. entomophila*) или штаммы видов *Photorhabdus*, такие как Tc-белки *Photorhabdus*, как описано в WO98/08932. Предлагаемое изобретение включает также любые варианты или мутанты любого из этих белков, которые отличаются определенными (1-10, предпочтительно, 1-5) аминокислотами в указанных выше последовательностях, в особенности, в последовательности токсичного фрагмента, или которые сливаются с транзитным пептидом, таким как пластидный транзитный пептид, либо с другим белком или пептидом.

Другим примером таких свойств, на котором делается особый акцент, является толерантность к одному или нескольким гербицидам, например, имидазолинонам, сульфонилмочевинам, глифосату или фосфинотрицину. Среди последовательностей ДНК, кодирующих белки, которые передают трансформированным растениям или клеткам растений свойства устойчивости к

определенным гербицидам, в частности будет указан *bar*-ген или *pat*-ген или ген *Streptomyces coelicolor*, описанный в документе WO2009/152359, передающий устойчивость к гербицидам класса глюфосината, ген, кодирующий соответствующую EPSPS (5-энолпирувилшикимат-3-фосфат-синтаза), передающий устойчивость к гербицидам, которые используют EPSPS в качестве целевого фермента, особенно к гербицидам, таким как глифосат и его соли, ген, кодирующий глифосат-н-ацетилтрансферазу, или ген кодирующий глифосат оксидоредуктазу. Другие подходящие характеристики устойчивости к гербицидам включают по крайней мере один ингибитор ALS (ацетолактатсинтазы) (например, WO2007/024782), мутированный ген ALS/AHAS арабидопсиса (например, патент США 6,855,533), гены, кодирующие 2,4-D-монооксигеназы, передающие устойчивость к 2,4-D (2,4-дихлорфеноксисукусная кислота) и гены, кодирующие дикамба-монооксигеназы, передающие устойчивость к дикамбе (3,6-дихлор-2-метоксибензойной кислоте).

Еще одним примером таких свойств является устойчивость к одному или нескольким фитопатогенным грибам, например, к азиатской ржавчине сои. Среди последовательностей ДНК, кодирующих белки, которые передают свойства устойчивости к таким заболеваниям, в частности, следует упомянуть генетический материал из глицина *tomentella*, например, из любой из общедоступных линий доступа PI441001, PI483224, PI583970, PI446958, PI499939, PI505220, PI499933, PI441008, PI505256 или PI446961, как описано в WO 2019/103918.

Дополнительными примерами таких свойств, на которые делается особый акцент, являются повышенная устойчивость к бактериям и/или вирусам, обусловленная, например, системной приобретенной устойчивостью (SAR), системинном, фитоалексинами, элиситорами, а также генами устойчивости и соответственно экспрессированными белками и токсинами.

Особенно полезные трансгенные линии в трансгенных растениях или сортах растений, которые предпочтительно можно обрабатывать в соответствии с изобретением, включают Объект 531/ PV-GHBK04 (хлопок, борьба с насекомыми, описан в WO2002/040677), Объект 1143-14A (хлопок, борьба с насекомыми, не депонирован, описан в WO2006/128569); Объект 1143-51B (хлопок, борьба с насекомыми, не депонирован, описан в WO2006/128570); Объект 1445 (хлопок, устойчивость к гербицидам, не депонирован, описан в US-A 2002-120964 или

WO2002/034946); Объект 17053 (рис, устойчивость к гербицидам, депонирован как РТА-9843, описан в WO2010/117737); Объект 17314 (рис, устойчивость к гербицидам, депонирован как РТА-9844, описан в WO2010/117735); Объект 281-24-236 (хлопок, борьба с насекомыми - устойчивость к гербицидам, депонирован как РТА-6233, описан в WO2005/103266 или US-A 2005-216969); Объект 3006-210-23 (хлопок, борьба с насекомыми - устойчивость к гербицидам, депонирован как РТА-6233, описан в US-A 2007-143876 от WO2005/103266); Объект 3272 (кукуруза, свойство качества, депонирован как РТА-9972, описан в WO2006/098952 или US-A 2006-230473); Объект 33391 (пшеница, устойчивость к гербицидам, депонирован как РТА-2347, описан в WO2002/027004), Объект 40416 (кукуруза, борьба с насекомыми - устойчивость к гербицидам, депонирован как ATCC РТА-11508, описан в WO 11/075593); Объект 43A47 (кукуруза, борьба с насекомыми - устойчивость к гербицидам, депонирован как ATCC РТА-11509, описан в WO2011/075595); Объект 5307 (кукуруза, борьба с насекомыми, депонирован как ATCC РТА-9561, описан в WO2010/077816); Объект ASR-368 (полевица, устойчивость к гербицидам, депонирован как ATCC РТА-4816, описан в US-A 2006-162007 или WO2004/053062); Объект B16 (кукуруза, устойчивость к гербицидам, не депонирован, описан в US-A 2003-126634); Объект BPS-CV127- 9 (соевые бобы, устойчивость к гербицидам, депонирован как NCIMB № 41603, описан в WO2010/080829); Объект BLR1 (рапс масличный, восстановление мужского бесплодия, депонирован как NCIMB 41193, описан в WO2005/074671), Объект CE43-67B (хлопок, борьба с насекомыми, депонирован как DSM ACC2724, описан в US-A 2009-217423 или WO2006/128573); Объект CE44-69D (хлопок, борьба с насекомыми, не депонирован, описан в US-A 2010- 0024077); Объект CE44-69D (хлопок, борьба с насекомыми, не депонирован, описан в WO2006/128571); Объект CE46-02A (хлопок, борьба с насекомыми, не депонирован, описан в WO2006/128572); Объект COT102 (хлопок, борьба с насекомыми, не депонирован, описан в US-A 2006-130175 или WO2004/039986); Объект COT202 (хлопок, борьба с насекомыми, не депонирован, описан в US-A 2007-067868 или WO2005/054479); Объект COT203 (хлопок, борьба с насекомыми, не депонирован, описан в WO2005/054480);); Объект DAS21606-3 / 1606 (соевые бобы, устойчивость к гербицидам, депонирован как РТА-11028, описан в WO2012/033794), Объект DAS40278 (кукуруза, устойчивость к гербицидам, депонирован как ATCC РТА-10244, описан в WO2011/022469); Объект DAS-44406-

6 / pDAB8264.44.06.1 (соевые бобы, устойчивость к гербицидам, депонирован как РТА-11336, описан в WO2012/075426), Объект DAS-14536-7 /pDAB8291.45.36.2 (соевые бобы, устойчивость к гербицидам, депонирован как РТА-11335, описан в WO2012/075429), Объект DAS-59122-7 (кукуруза, борьба с насекомыми - устойчивость к гербицидам, депонирован как ATCC РТА 11384, описан в US-A 2006-070139); Объект DAS-59132 (кукуруза, борьба с насекомыми - устойчивость к гербицидам, не депонирован, описан в WO2009/100188); Объект DAS68416 (соевые бобы, устойчивость к гербицидам, депонирован как ATCC РТА-10442, описан в WO2011/066384 или WO2011/066360); Объект DP-098140-6 (кукуруза, устойчивость к гербицидам, депонирован как ATCC РТА-8296, описан в US-A 2009- 137395 или WO 08/112019); Объект DP-305423-1 (соевые бобы, свойство качества, не депонирован, описан в US-A 2008-312082 или WO2008/054747); Объект DP-32138-1 (кукуруза, hybridization system, депонирован как ATCC РТА-9158, описан в US-A 2009-0210970 или WO2009/103049); Объект DP-356043-5 (соевые бобы, устойчивость к гербицидам, депонирован как ATCC РТА-8287, описан в US-A 2010-0184079 или WO2008/002872); Объект EE-I (баклажан, борьба с насекомыми, не депонирован, описан в WO 07/091277); Объект Fil 17 (кукуруза, устойчивость к гербицидам, депонирован как ATCC 209031, описан в US-A 2006-059581 или WO 98/044140); Объект FG72 (соевые бобы, устойчивость к гербицидам, депонирован как РТА-11041, описан в WO2011/063413), Объект GA21 (кукуруза, устойчивость к гербицидам, депонирован как ATCC 209033, описан в US-A 2005-086719 или WO 98/044140); Объект GG25 (кукуруза, устойчивость к гербицидам, депонирован как ATCC 209032, описан в US-A 2005-188434 или WO98/044140); Объект GHB119 (хлопок, борьба с насекомыми - устойчивость к гербицидам, депонирован как ATCC РТА-8398, описан в WO2008/151780); Объект GHB614 (хлопок, устойчивость к гербицидам, депонирован как ATCC РТА-6878, описан в US-A 2010-050282 или W02007/017186); Объект GJ11 (кукуруза, устойчивость к гербицидам, депонирован как ATCC 209030, описан в US-A 2005-188434 или WO98/044140); Объект GM RZ13 (свёкла сахарная, устойчивость к вирусу, депонирован как NCIMB-41601, описан в WO2010/076212); Объект H7-I (свёкла сахарная, устойчивость к гербицидам, депонирован как NCIMB 41158 или NCIMB 41159, описан в US-A 2004-172669 или WO 2004/074492); Объект JOPLINI (пшеница, устойчивость к болезням, не депонирован, описан в US-A 2008-064032); Объект LL27 (соевые бобы, устойчивость к гербицидам, депонирован как

NCIMB41658, описан в WO2006/108674 или US-A 2008-320616); Объект LL55 (соевые бобы, устойчивость к гербицидам, депонирован как NCIMB 41660, описан в WO 2006/108675 или US-A 2008-196127); Объект LLхлопок25 (хлопок, устойчивость к гербицидам, депонирован как ATCC PTA-3343, описан в WO2003/013224 или US- A 2003-097687); Объект LLRICE06 (рис, устойчивость к гербицидам, депонирован как ATCC 203353, описан в US 6,468,747 или WO2000/026345); Объект LLRice62 (рис, устойчивость к гербицидам, депонирован как ATCC 203352, описан в WO2000/026345), Объект LLRICE601 (рис, устойчивость к гербицидам, депонирован как ATCC PTA-2600, описан в US-A 2008-2289060 или WO2000/026356); Объект LY038 (кукуруза, свойство качества, депонирован как ATCC PTA-5623, описан в US-A 2007-028322 или WO2005/061720); Объект MIR162 (кукуруза, борьба с насекомыми, депонирован как PTA-8166, описан в US-A 2009-300784 или WO2007/142840); Объект MIR604 (кукуруза, борьба с насекомыми, не депонирован, описан в US-A 2008-167456 или WO2005/103301); Объект MON15985 (хлопок, борьба с насекомыми, депонирован как ATCC PTA-2516, описан в US-A 2004-250317 или WO2002/100163); Объект MON810 (кукуруза, борьба с насекомыми, не депонирован, описан в US-A 2002-102582); Объект MON863 (кукуруза, борьба с насекомыми, депонирован как ATCC PTA-2605, описан в WO2004/011601 или US-A 2006-095986); Объект MON87427 (кукуруза, контроль опыления, депонирован как ATCC PTA-7899, описан в WO2011/062904); Объект MON87460 (кукуруза, stress tolerance, депонирован как ATCC PTA-8910, описан в WO2009/111263 или US-A 2011-0138504); Объект MON87701 (соевые бобы, борьба с насекомыми, депонирован как ATCC PTA-8194, описан в US-A 2009-130071 или WO2009/064652); Объект MON87705 (соевые бобы, свойство качества - устойчивость к гербицидам, депонирован как ATCC PTA-9241, описан в US-A 2010-0080887 или WO2010/037016); Объект MON87708 (соевые бобы, устойчивость к гербицидам, депонирован как ATCC PTA-9670, описан в WO2011/034704); Объект MON87712 (соевые бобы, выход, депонирован как PTA-10296, описан в WO2012/051199), Объект MON87754 (соевые бобы, свойство качества, депонирован как ATCC PTA-9385, описан в WO2010/024976); Объект MON87769 (соевые бобы, свойство качества, депонирован как ATCC PTA- 8911, описан в US-A 2011-0067141 или WO2009/102873); Объект MON88017 (кукуруза, борьба с насекомыми - устойчивость к гербицидам, депонирован как ATCC PTA-5582, описан в US-A

2008-028482 или WO2005/059103); Объект MON88913 (хлопок, устойчивость к гербицидам, депонирован как ATCC PTA-4854, описан в WO2004/072235 или US-A 2006-059590); Объект MON88302 (рапс масличный, устойчивость к гербицидам, депонирован как PTA-10955, описан в WO2011/153186), Объект MON88701 (хлопок, устойчивость к гербицидам, депонирован как PTA-11754, описан в WO2012/134808), Объект MON89034 (кукуруза, борьба с насекомыми, депонирован как ATCC PTA-7455, описан в WO 07/140256 или US-A 2008-260932); Объект MON89788 (соевые бобы, устойчивость к гербицидам, депонирован как ATCC PTA-6708, описан в US-A 2006-282915 или WO2006/130436); Объект MSI 1 (рапс масличный, контроль опыления - устойчивость к гербицидам, депонирован как ATCC PTA-850 или PTA-2485, описан в WO2001/031042); Объект MS8 (рапс масличный, контроль опыления - устойчивость к гербицидам, депонирован как ATCC PTA-730, описан в WO2001/041558 или US-A 2003-188347); Объект NK603 (кукуруза, устойчивость к гербицидам, депонирован как ATCC PTA-2478, описан в US-A 2007-292854); Объект PE-7 (рис, борьба с насекомыми, не депонирован, описан в WO2008/114282); Объект RF3 (рапс масличный, контроль опыления - устойчивость к гербицидам, депонирован как ATCC PTA-730, описан в WO2001/041558 или US-A 2003-188347); Объект RT73 (рапс масличный, устойчивость к гербицидам, не депонирован, описан в WO2002/036831 или US-A 2008-070260); Объект SYHT0H2 / SYN-000H2-5 (соевые бобы, устойчивость к гербицидам, депонирован как PTA-11226, описан в WO2012/082548), Объект T227-1 (свёкла сахарная, устойчивость к гербицидам, не депонирован, описан в WO2002/44407 или US-A 2009-265817); Объект T25 (кукуруза, устойчивость к гербицидам, не депонирован, описан в US-A 2001-029014 или WO2001/051654); Объект T304-40 (хлопок, борьба с насекомыми - устойчивость к гербицидам, депонирован как ATCC PTA-8171, описан в US-A 2010-077501 или WO2008/122406); Объект T342-142 (хлопок, борьба с насекомыми, не депонирован, описан в WO2006/128568); Объект TC1507 (кукуруза, борьба с насекомыми - устойчивость к гербицидам, не депонирован, описан в US-A 2005-039226 или WO2004/099447); Объект VIP1034 (кукуруза, борьба с насекомыми - устойчивость к гербицидам, депонирован как ATCC PTA-3925, описан в WO2003/052073), Объект 32316 (кукуруза, борьба с насекомыми-устойчивость к гербицидам, депонирован как PTA-11507, описан в WO2011/084632), Объект 4114 (кукуруза, борьба с насекомыми-устойчивость к гербицидам, депонирован как PTA-11506,

описан в WO2011/084621), объект EE-GM3 / FG72 (соевые бобы, устойчивость к гербицидам, ATCC № Доступа РТА-11041), при необходимости, пакетированная с объектом EE-GM1/LL27 или объектом EE-GM2/LL55 (WO2011/063413A2), объект DAS-68416-4 (соевые бобы, устойчивость к гербицидам, ATCC № Доступа РТА-10442, WO2011/066360A1), объект DAS-68416-4 (соевые бобы, устойчивость к гербицидам, ATCC № Доступа РТА-10442, WO2011/066384A1), объект DP-040416-8 (кукуруза, борьба с насекомыми, ATCC № Доступа РТА-11508, WO2011/075593A1), объект DP-043A47-3 (кукуруза, борьба с насекомыми, ATCC № Доступа РТА-11509, WO2011/075595A1), объект DP-004114-3 (кукуруза, борьба с насекомыми, ATCC № Доступа РТА-11506, WO2011/084621A1), объект DP-032316-8 (кукуруза, борьба с насекомыми, ATCC № Доступа РТА-11507, WO2011/084632A1), объект MON-88302-9 (рапс масличный, устойчивость к гербицидам, ATCC № Доступа РТА-10955, WO2011/153186A1), объект DAS-21606-3 (соевые бобы, устойчивость к гербицидам, ATCC № Доступа РТА-11028, WO2012/033794A2), объект MON-87712-4 (соевые бобы, свойство качества, ATCC № Доступа РТА-10296, WO2012/051199A2), объект DAS-44406-6 (соевые бобы, пакетированная устойчивость к гербицидам, ATCC № Доступа РТА-11336, WO2012/075426A1), объект DAS-14536-7 (соевые бобы, пакетированная устойчивость к гербицидам, ATCC № Доступа РТА-11335, WO2012/075429A1), объект SYN-000H2-5 (соевые бобы, устойчивость к гербицидам, ATCC № Доступа РТА-11226, WO2012/082548A2), объект DP-061061-7 (рапс масличный, устойчивость к гербицидам, номер в депозитории не доступен, WO2012071039A1), объект DP-073496-4 (рапс масличный, устойчивость к гербицидам, номер в депозитории не доступен, US2012131692), объект 8264.44.06.1 (соевые бобы, пакетированная устойчивость к гербицидам, № Доступа РТА-11336, WO2012075426A2), объект 8291.45.36.2 (соевые бобы, пакетированная устойчивость к гербицидам, № Доступа РТА-11335, WO2012075429A2), объект SYHT0H2 (соевые бобы, ATCC № Доступа РТА-11226, WO2012/082548A2), объект MON88701 (хлопок, ATCC № Доступа РТА-11754, WO2012/134808A1), объект KK179-2 (люцерна, ATCC № Доступа РТА-11833, WO2013/003558A1), объект pDAB8264.42.32.1 (соевые бобы, пакетированная устойчивость к гербицидам, ATCC № Доступа РТА-11993, WO2013/010094A1), объект MZDT09Y (кукуруза, ATCC № Доступа РТА-13025, WO2013/012775A1).

Кроме того, список таких трансгенных событий предоставляется Службой контроля здоровья животных и растений (APHIS) Министерства сельского хозяйства США (USDA), и он представлен на их веб-сайте во всемирной паутине по адресу aphis.usda.gov. Для этой заявки важное значение имеет статус такого списка на дату подачи этой заявки.

Гены/линии, которые придают рассматриваемые желательные признаки, могут также присутствовать в комбинациях друг с другом в трансгенных растениях. Среди стоящих упоминания примеров трансгенных растений можно привести важные сельскохозяйственные растения, такие как злаки (пшеница, рис, тритикале, ячмень, рожь, овес), кукуруза, соевые бобы, картофель, сахарная свекла, сахарный тростник, помидоры, горох и другие виды овощей, хлопок, табак, масличный рапс, а также плодовые растения (с плодами в виде яблок, груш, цитрусовых и винограда), с особым упором на кукурузу, соевые бобы, пшеницу, рис, картофель, хлопок, сахарный тростник, табак и масличный рапс. К признакам, на которые делается особый акцент, относятся повышенная устойчивость растений к насекомым, пакуобразным, нематодам, слизням и улиткам, а также повышенная устойчивость растений к одному или нескольким гербицидам.

Коммерчески доступные примеры таких растений, частей растений или семян растений, которые могут быть предпочтительно обработаны в соответствии с изобретением, включают коммерческие продукты, такие как семена растений, продаваемые или распространяемые под торговыми наименованиями GENUITY®, DROUGHTGARD®, SMARTSTAX®, RIB COMPLETE®, ROUNDUP READY®, VT DOUBLE PRO®, VT TRIPLE PRO®, BOLLGARD II®, ROUNDUP READY 2 YIELD®, YIELDGARD®, ROUNDUP READY® 2 XTEN^{DTM}, INTACTA RR2 PRO®, VISTIVE GOLD® и/или XTENDFLEX™.

Патогены

Неограничивающие примеры возбудителей грибковых заболеваний, которые можно лечить в соответствии с изобретением, включают:

болезни, вызванные возбудителями мучнистой росы, например, видами *Blumeria*, например, *Blumeria graminis*; видами *Podosphaera*, например, *Podosphaera leucotricha*; видами *Sphaerotheca*, например, *Sphaerotheca fuliginea*; видами *Uncinula*, например, *Uncinula necator*;

болезни, вызванные возбудителями ржавчинной болезни, например, видами *Gymnosporangium*, например, *Gymnosporangium sabinae*; видами *Hemileia*, например, *Hemileia vastatrix*; видами *Phakopsora*, например, *Phakopsora pachyrhizi* или *Phakopsora meibomia*; видами *Puccinia*, например, *Puccinia recondita*, *Puccinia graminis* или *Puccinia striiformis*; видами *Uromyces*, например, *Uromyces appendiculatus*;

болезни, вызванные патогенами из группы Оомицетов, например, видами *Albugo*, например, *Albugo candida*; видами *Bremia*, например, *Bremia lactucae*; видами *Peronospora*, например, *Peronospora pisi* или *P. brassicae*; видами *Phytophthora*, например, *Phytophthora infestans*; видами *Plasmopara*, например, *Plasmopara viticola*; видами *Pseudoperonospora*, например, *Pseudoperonospora humuli* или *Pseudoperonospora cubensis*; видами *Pythium*, например, *Pythium ultimum*;

болезни, вызываемые пятнистостью листьев и болезни, вызываемые увяданием листьев, например, видами *Alternaria*, например, *Alternaria solani*; видами *Cercospora*, например, *Cercospora beticola*; видами *Cladosporium*, например, *Cladosporium cucumerinum*; видами *Cochliobolus*, например, *Cochliobolus sativus* (конидиальная форма: *Drechslera*, син: *Helminthosporium*) или *Cochliobolus miyabeanus*; *Colletotrichum* видами, например, *Colletotrichum lindemuthianum*; *Corynespora* видами, например, *Corynespora cassiicola*; *Cycloconium* видами, например, *Cycloconium oleaginum*; видами *Diaporthe*, например, *Diaporthe citri*; видами *Elsinoe*, например, *Elsinoe fawcettii*; видами *Gloeosporium*, например, *Gloeosporium laeticolor*; видами *Glomerella*, например, *Glomerella cingulata*; видами *Guignardia*, например, *Guignardia bidwelli*; видами *Leptosphaeria*, например, *Leptosphaeria maculans*; видами *Magnaporthe*, например, *Magnaporthe grisea*; видами *Microdochium*, например, *Microdochium nivale*; видами *Mycosphaerella*, например, *Mycosphaerella graminicola*, *Mycosphaerella arachidicola* или *Mycosphaerella fijiensis*; видами *Phaeosphaeria*, например, *Phaeosphaeria nodorum*; видами *Pyrenophora*, например, *Pyrenophora teres* или *Pyrenophora tritici repentis*; видами *Ramularia*, например, *Ramularia collo-cygni* или *Ramularia areola*; видами *Rhynchosporium*, например, *Rhynchosporium secalis*; видами *Septoria*, например, *Septoria apii* или *Septoria lycopersici*; видами *Stagonospora*, например,

Stagonospora nodorum; видами *Typhula*, например, *Typhula incarnata*; видами *Venturia*, например, *Venturia inaequalis*;

заболевания корней и стеблей, вызванные, например, видами *Corticium*, например, *Corticium graminarum*; видами *Fusarium*, например, *Fusarium oxysporum*; видами *Gaeumannomyces*, например, *Gaeumannomyces graminis*; видами *Plasmodiophora*, например, *Plasmodiophora brassicae*; видами *Rhizoctonia*, например, *Rhizoctonia solani*; видами *Sarocladium*, например, *Sarocladium oryzae*; видами *Sclerotium*, например, *Sclerotium oryzae*; видами *Tapesia*, например, *Tapesia aciformis*; видами *Thielaviopsis*, например, *Thielaviopsis basicola*;

заболевания початков и колосовых метелок (включая кукурузные початки), вызванные, например, видами *Alternaria*, например, *Alternaria spp.*; *Aspergillus* видами, например, *Aspergillus flavus*; видами *Cladosporium*, например, *Cladosporium cladosporioides*; видами *Claviceps*, например, *Claviceps purpurea*; видами *Fusarium*, например, *Fusarium culmorum*; видами *Gibberella*, например, *Gibberella zeae*; видами *Monographella*, например, *Monographella nivalis*; видами *Stagonospora*, например, *Stagonospora nodorum*;

болезни, вызванные головнёвыми грибами, например, видами *Sphacelotheca*, например, *Sphacelotheca reiliana*; видами *Tilletia*, например, *Tilletia caries* или *Tilletia controversa*; видами *Urocystis*, например, *Urocystis occulta*; видами *Ustilago*, например, *Ustilago nuda*;

плодовая гниль, вызванная, например, видами *Aspergillus*, например, *Aspergillus flavus*; видами *Botrytis*, например, *Botrytis cinerea*; видами *Monilinia*, например, *Monilinia laxa*; видами *Penicillium*, например, *Penicillium expansum* или *Penicillium purpurogenum*; видами *Rhizopus*, например, *Rhizopus stolonifer*; видами *Sclerotinia*, например, *Sclerotinia sclerotiorum*; видами *Verticillium*, например, *Verticillium alboatrum*;

семенная и почвенная гниль и болезни увядания, и также болезни рассады, вызванные, например, видами *Alternaria*, например, *Alternaria brassicicola*; видами *Aphanomyces*, например, *Aphanomyces euteiches*; видами *Ascochyta*, например, *Ascochyta lentis*; видами *Aspergillus*, например, *Aspergillus flavus*; видами *Cladosporium*, например, *Cladosporium herbarum*; видами *Cochliobolus*, например, *Cochliobolus sativus* (конидиальная форма: *Drechslera*, Биполярный Син:

Helminthosporium); видами *Colletotrichum*, например, *Colletotrichum coccodes*; видами *Fusarium*, например, *Fusarium culmorum*; видами *Gibberella*, например, *Gibberella zeae*; видами *Macrophomina*, например, *Macrophomina phaseolina*; видами *Microdochium*, например, *Microdochium nivale*; видами *Monographella*, например, *Monographella nivalis*; видами *Penicillium*, например, *Penicillium expansum*; видами *Phoma*, например, *Phoma lingam*; видами *Phomopsis*, например, *Phomopsis sojae*; видами *Phytophthora*, например, *Phytophthora cactorum*; видами *Pyrenophora*, например, *Pyrenophora graminis*; видами *Pyricularia*, например, *Pyricularia oryzae*; видами *Pythium*, например, *Pythium ultimum*; видами *Rhizoctonia*, например, *Rhizoctonia solani*; видами *Rhizopus*, например, *Rhizopus oryzae*; видами *Sclerotium*, например, *Sclerotium rolfsii*; видами *Septoria*, например, *Septoria nodorum*; видами *Typhula*, например, *Typhula incarnata*; видами *Verticillium*, например, *Verticillium dahliae*;

рак, галлы и ведьмина метла, вызванная, например, видами *Nectria*, например, *Nectria galligena*;

болезни увядания, вызванные, например, видами *Verticillium*, например, *Verticillium longisporum*; видами *Fusarium*, например, *Fusarium oxysporum*;

деформации листьев, цветов и плодов, вызванные, например, видами *Exobasidium*, например, *Exobasidium vexans*; видами *Taphrina*, например, *Taphrina deformans*;

дегенеративные заболевания древесных растений, вызванные, например, видами *Esca*, например, *Phaeoconiella chlamydospora*, *Phaeoacremonium aleophilum* или *Fomitiporia mediterranea*; видами *Ganoderma*, например, *Ganoderma boninense*;

болезни клубней растений, вызванные, например, видами *Rhizoctonia*, например, *Rhizoctonia solani*; видами *Helminthosporium*, например, *Helminthosporium solani*;

болезни, вызванные бактериальными патогенами, например, видами *Xanthomonas*, например, *Xanthomonas campestris* pv. *oryzae*; видами *Pseudomonas*, например, *Pseudomonas syringae* pv. *lachrymans*; видами *Erwinia*, например, *Erwinia amylovora*; видами *Liberibacter*, например, *Liberibacter asiaticus*; видами *Xyella*, например, *Xylella fastidiosa*; видами *Ralstonia*, например, *Ralstonia solanacearum*;

видами *Dickeya*, например, *Dickeya solani*; видами *Clavibacter*, например, *Clavibacter michiganensis*; видами *Streptomyces*, например, *Streptomyces scabies*.

Болезни соевых бобов:

Грибковые заболевания листьев, стеблей, стручков и семян, вызванные, например, *Alternaria* пятнистостью листьев (*Alternaria spec. atrans tenuissima*), *Anthraco* (*Colletotrichum gloeosporoides dematium var. truncatum*), бурой пятнистостью (*Septoria glycines*), *cercospora* пятнистостью и гнилью листьев (*Cercospora kikuchii*), *choanephora* пятнистостью листьев (*Choanephora infundibulifera trispora* (Сун.)), *dactuliophora* пятнистостью листьев (*Dactuliophora glycines*), ложномучнистой росой (*Peronospora manshurica*), *drechslera* гнилью (*Drechslera glycini*), пятнистостью листьев и плодов (*Cercospora sojae*), *leptosphaerulina* пятнистостью листьев (*Leptosphaerulina trifolii*), *phyllosticta* пятнистостью листьев (*Phyllosticta sojaecola*), гнилью стручков и стеблей (*Phomopsis sojae*), настоящей мучнистой росой (*Microsphaera diffusa*), *pyrenochaeta* пятнистостью листьев (*Pyrenochaeta glycines*), ризоктонией воздушной, поражающей листву (*Rhizoctonia solani*), ржавчиной (*Phakopsora pachyrhizi*, *Phakopsora meibomia*), паршей (*Sphaceloma glycines*), *stemphylium* пятнистостью листьев (*Stemphylium botryosum*), синдромом внезапной смерти (*Fusarium virguliforme*), мишеневидной пятнистостью листьев (*Corynespora cassicola*).

Грибковые заболевания корней и комеля, вызванные, например, чёрной корневой гнилью (*Calonectria crotalariae*), углистой гнилью (*Macrophomina phaseolina*), фузариозной гнилью или увяданием, корневой гнилью, и стручковой гнилью и гнилью ветвей (*Fusarium oxysporum*, *Fusarium orthoceras*, *Fusarium semitectum*, *Fusarium equiseti*), корневой гнилью миколептодискуса (*Mycoleptodiscus terrestris*), неокосмоспорами (*Neocosmospora vasinfecta*), гнилью стручков и стеблей (*Diaporthe phaseolorum*), стеблевым раком (*Diaporthe phaseolorum var. caulivora*), фитофторозной гнилью (*Phytophthora megasperma*), бурой гнилью стеблей сои (*Phialophora gregata*), грибной гнилью (*Pythium aphanidermatum*, *Pythium irregulare*, *Pythium debaryanum*, *Pythium myriotylum*, *Pythium ultimum*), войлочной болезнью, загниванием стебля, и черной ножкой (*Rhizoctonia solani*), склеротинией (*Sclerotinia sclerotiorum*), склероциальная южной гнилью (*Sclerotinia rolfii*), корневой гнилью, вызываемой тиелавиопсисом (*Thielaviopsis basicola*).

Микотоксины

В дополнение, соединение формулы (I) и композиция согласно изобретению могут снизить содержание микотоксина в собранном материале и пищевых продуктах и приготовленных из них кормах. Микотоксины включают, в частности, но не исключительно, следующие: деоксиниваленол (DON), ниваленол, 15-Ас-DON, 3-Ас-DON, Т2- и HT2-токсин, фумонизины, зеараленон, монилиформин, фузарин, диацетоксискирпенол (DAS), боверицин, энниатин, фузаропротрофериин, фосренол, ократоксины, патулин, алкалоиды спорыньи и афлатоксины, которые могут продуцироваться, например, следующими грибами: *Fusarium* spec., такими как *F. acuminatum*, *F. asiaticum*, *F. avenaceum*, *F. crookwellense*, *F. culmorum*, *F. graminearum* (*Gibberella zeae*), *F. equiseti*, *F. fujikuroi*, *F. musarum*, *F. oxysporum*, *F. proliferatum*, *F. poae*, *F. pseudograminarum*, *F. sambucinum*, *F. scirpi*, *F. semitectum*, *F. solani*, *F. sporotrichoides*, *F. langsethiae*, *F. subglutinans*, *F. tricinctum*, *F. verticillioides*, а также *Aspergillus* spec., такими как *A. flavus*, *A. parasiticus*, *A. nomius*, *A. ochraceus*, *A. clavatus*, *A. terreus*, *A. versicolor*, *Penicillium* spec., такими как *P. verrucosum*, *P. viridicatum*, *P. citrinum*, *P. expansum*, *P. claviforme*, *P. roqueforti*, *Claviceps* spec., такими как *C. purpurea*, *C. fusiformis*, *C. paspali*, *C. africana*, *Stachybotrys* spec. и др.

Защита материалов

Соединение формулы (I) и композиция по изобретению могут также использоваться для защиты материалов, в частности, для защиты промышленных материалов от воздействия фитопатогенных грибов и разрушения фитопатогенными грибами.

Кроме того, соединение формулы (I) и композиция по изобретению могут быть использованы в качестве противообрастающих композиций, отдельно или в комбинациях с другими активными ингредиентами.

В контексте настоящего изобретения под термином «промышленные материалы» подразумеваются неживые материалы, которые предназначены для применения в промышленности. Например, промышленными материалами, защита которых от изменений или разрушения вследствие воздействия микроорганизмов может осуществляться по изобретению, могут являться клеящие вещества, клеи, бумага, обои и доски/картон, текстильные материалы, ковры, кожа, древесина,

волокнистая масса и ткани, краска и изделия из пластика, смазывающе-охлаждающие жидкости, и другие материалы, которые могут поражаться или разрушаться микроорганизмами. Также в составе материалов, защита которых может осуществляться по изобретению, можно упомянуть части производственных установок и зданий, например, контуры циркуляции охлаждающей воды, системы охлаждения и нагрева, а также блоки вентиляции и кондиционирования воздуха, которые могут разрушаться вследствие развития микроорганизмов. Промышленные материалы по настоящему изобретению предпочтительно включают клеящие вещества, грунтовки, бумагу и картон, кожу, древесину, краску, смазывающе-охлаждающие жидкости и теплообменные жидкости, более предпочтительно, древесину.

Соединение формулы (I) и композиция по изобретению могут предотвращать негативные воздействия, такие как гниение, порча, изменение цвета, обесцвечивание или образование плесени.

В случае обработки дерева соединение формулы (I) и композиция по изобретению могут также быть использованы против грибковых заболеваний, которые могут развиваться на поверхности или внутри лесоматериалов.

Термин «лесоматериалы» означает все виды пород дерева и все виды обработанной древесины, предназначенные для строительства, например, цельная древесина, древесина высокой плотности, ламинированная древесина и фанера. В дополнение, соединение формулы (I) и композиция по изобретению могут быть использованы для защиты от биологического обрастания объектов, которые контактируют с минерализованной или соленой водой, в частности, корпуса судов, экраны, сети, строения, мест стоянки и сигнальных систем.

Соединение формулы (I) и композиция по изобретению также могут быть использованы для защиты товаров на хранении. Термин «товары для хранения» означает природные вещества растительного или животного происхождения и полученные путем их переработки продукты природного происхождения, для которых необходима долгосрочная защита. Товары для хранения растительного происхождения включают, например, растения или их части, такие как стебли, листья, клубни, семена, плоды или зерно, могут быть защищены в свежесобранном состоянии или в переработанном виде, например, путем предварительного

высушивания, увлажнения, измельчения, перемалывания, спрессовывания или высокотемпературной обработки. Товары для хранения также включают лесоматериалы, как сырые лесоматериалы, такие как строительные лесоматериалы, опоры линии электропередачи и ограждения, так и лесоматериалы в виде готовых изделий, такие как мебель. Товарами для хранения животного происхождения являются, например, шкуры, кожа, меховые изделия и изделия из волосяной ткани меха. Соединение формулы (I) и композиция по изобретению могут предотвращать негативные воздействия, такие как гниение, порча, изменение цвета, обесцвечивание или образование плесени.

Микроорганизмы, которые способны портить промышленные материалы или изменять их свойства, включают, например, бактерии, грибы, дрожжи, водоросли и организмы, живущие в иле. Соединение формулы (I) и композиция по изобретению предпочтительно оказывают негативное воздействие на грибы, особенно плесневые, деревоокрашивающие и дереворазрушающие грибы (*Ascomycetes*, *Basidiomycetes*, *Deuteromycetes* и *Zygomycetes*), и против слизистых организмов и водорослей. Примеры включают микроорганизмы следующих родов: *Alternaria*, такие как *Alternaria tenuis*; *Aspergillus*, такие как *Aspergillus niger*; *Chaetomium*, такие как *Chaetomium globosum*; *Coniophora*, такие как *Coniophora puetana*; *Lentinus*, такие как *Lentinus tigrinus*; *Penicillium*, такие как *Penicillium glaucum*; *Polyporus*, такие как *Polyporus versicolor*; *Aureobasidium*, такие как *Aureobasidium pullulans*; *Sclerophoma*, такие как *Sclerophoma pityophila*; *Trichoderma*, такие как *Trichoderma viride*; *Ophiostoma* spp., *Ceratocystis* spp., *Humicola* spp., *Petriella* spp., *Trichurus* spp., *Coriolus* spp., *Gloeophyllum* spp., *Pleurotus* spp., *Poria* spp., *Serpula* spp. и *Tyromyces* spp., *Cladosporium* spp., *Paecilomyces* spp. *Mucor* spp., *Escherichia*, такие как *Escherichia coli*; *Pseudomonas*, такие как *Pseudomonas aeruginosa*; *Staphylococcus*, такие как *Staphylococcus aureus*, *Candida* spp. и *Saccharomyces* spp., такие как *Saccharomyces cerevisiae*.

Обработка семян

Соединение формулы (I) и композиция по изобретению также могут использоваться для защиты семян от нежелательных микроорганизмов, таких как фитопатогенные микроорганизмы, например, от фитопатогенных грибов или фитопатогенных оомицетов. В контексте настоящего документа термин «семя» или

«семена» включает семена в состоянии покоя, подготовленные семена, предварительно проросшие семена и семена с появившимися корнями и листьями.

Таким образом, настоящее изобретение также относится к способу защиты семян от нежелательных микроорганизмов, который включает этап обработки семян соединением формулы (I) или композицией по изобретению.

Обработка семян соединением формулы (I) или композицией по изобретению защищает семена от фитопатогенных микроорганизмов, а также защищает прорастающие семена, рассаду и растения после того, как они проросли из обработанных семян. Таким образом, настоящее изобретение также относится к способу защиты семян, прорастающих семян и рассады.

Обработка семян может осуществляться до засева, во время засева и сразу после него.

Когда обработка семян производится до засева (например, в виде так называемого нанесения на семена), она может выполняться следующим образом: семена могут быть помещены в смешивающее устройство вместе с необходимым количеством соединения формулы (I) или композиции по изобретению, семена и соединение формулы (I) или композиция по изобретению смешиваются до однородного распределения соединения или композиции на семенах., при необходимости, семена могут затем быть высушены.

Изобретение также относится к семенам, покрытым соединением формулы (I) или композицией по изобретению.

Предпочтительно, чтобы семена были достаточно твердыми, чтобы не допустить повреждений во время обработки. Обычно обработка семян производится в любое время между сбором урожая и посевом и сразу после посева. Обычно используют семена, которые были отделены от растения и у которых были удалены стержни початка, шелуха, плодоножки, оболочки, волоски или мякоть плода. Например, можно использовать семена, которые были собраны, очищены и высушены так, чтобы содержание влаги составляло менее 15 мас.%. В качестве альтернативы, также можно использовать семена, которые после высушивания, например, были обработаны водой, а затем снова высушены, или же семена сразу после их примирования, семена, которые хранятся в примированном

состоянии, или предварительно проросшие семена, или же семена, посеянные на брудерных лотках, пленке или бумаге.

Количество соединения формулы (I) или композиции по изобретению, наносимое на семена, как правило, таково, чтобы не навредить процессу прорастания семян и самому растению. Это следует обеспечить, в частности, если соединение формулы (I) может иметь фитотоксичное воздействие при определенных дозировках. Чтобы обеспечить оптимальную защиту семян и прорастающих растений с минимальным расходом используемого соединения формулы (I), необходимо также принимать во внимание естественные фенотипы трансгенных растений при определении количества соединения, которым обрабатываются семена.

Соединение формулы (I) может наноситься непосредственно на семена само по себе, т.е. без использования каких-либо других компонентов, без разбавления. Соединением по изобретению также могут обрабатываться семена.

Соединение формулы (I) и композиция по изобретению могут использоваться для защиты семян любых сортов растений. Предпочтительно обрабатываются семена злаковых культур (таких как пшеница, ячмень, рожь, просо, тритикале и овес), масличного рапса, кукурузы, хлопка, сои, риса, картофеля, подсолнечника, бобов, кофе, гороха, свеклы (например, сахарной свеклы и кормовой свеклы), арахиса, овощей (таких как помидор, огурец, лук и салат-латук), дерновых и декоративных культур. Более предпочтительно обрабатываются семена пшеницы, сои, масличного рапса, кукурузы и риса.

Соединение формулы (I) и композиция по изобретению могут быть использованы для обработки трансгенных семян, в частности, семян растений, способных экспрессировать полипептид или белок, который действует против вредителей, гербицидного повреждения или абиотического стресса, в результате чего защитный эффект усиливается. Семена растений, способных экспрессировать полипептид или белок, который действует против вредителей, гербицидного повреждения или абиотического стресса, могут содержать по меньшей мере один гетерологический ген, который обеспечивает экспрессию указанного полипептида или белка. В трансгенных семенах такие гетерологические гены могут происходить, например, из микроорганизмов, таких родов как *Bacillus*, *Rhizobium*,

Pseudomonas, *Serratia*, *Trichoderma*, *Clavibacter*, *Glomus* или *Gliocladium*. Такие гетерологические гены предпочтительно происходят из рода *Bacillus*, в этом случае генный продукт обладает эффективностью в отношении огневки кукурузной и/или западный кукурузный жук. Особенно предпочтительны гетерологические гены, происходящие из *Bacillus thuringiensis*.

Вид обработки

Соединение формулы (I) может применяться в отдельности или, например, в форме готовых растворов, эмульсий, суспензий на водной или масляной основе, порошков, смачиваемых порошков, паст, растворимых порошков, пылевидных препаратов, растворимых гранул, гранул для разбросного внесения, концентратов суспензии, в виде натуральных продуктов, пропитанных соединением формулы (I), синтетических веществ, пропитанных соединением формулы (I), удобрений, а также микрокапсуляций в полимерном веществе.

Обработка осуществляется обычным способом, например, путем полива, распыления, мелкодисперсного разбрызгивания, разбросного внесения, внесения с пеной или распределения по площади посева. Также можно вносить соединение формулы (I) методом ультра-малых объемов или впрыскивать препарат активного вещества или само активное вещество в почву. Кроме того, обработка соединением формулы (I) может осуществляться путем добавления его в замазку или в краску для подкормки повреждённого растения или в иной состав для подкормки повреждённого растения.

Эффективное нефитотоксичное количество соединения формулы (I), которым обрабатываются растения, части растения, плоды, семена или почва, будет зависеть от различных факторов, например, от конкретного используемого соединения/композиции, от того, подвергается ли обработке все растение или часть растения или плод растения, семена или почва, от типа обработки (опрыскивание, распыление, протравливание семян), от цели обработки (лечебная или профилактическая), от типа микроорганизмов, от стадии развития микроорганизмов, от чувствительности микроорганизмов, от стадии роста растений и от условий окружающей среды.

При использовании соединения формулы (I) в качестве фунгицида дозировки могут варьироваться в пределах относительно широкого диапазона, в

зависимости от вида применения. В случае обработки частей растения, например, листьев, дозировка может варьироваться в диапазоне 0,1 - 10 000 г/га, предпочтительно 10 - 1000 г/га, более предпочтительно 50 - 300 г/га (в случае обработки путем полива или орошения, возможно еще более снизить дозировку, в особенности, если используют инертные субстраты, такие как минеральная вата или перлит). Для обработки семян дозировка может варьироваться в диапазоне 0,1 - 200 г на 100 кг семян, предпочтительно 1 - 150 г на 100 кг семян, более предпочтительно 2,5 - 25 г на 100 кг семян, еще более предпочтительно 2,5 - 12,5 г на 100 кг семян. В случае обработки почвы дозировка может варьироваться в диапазоне 0,1 - 10 000 г/га, предпочтительно 1 - 5000 г/га.

Эти нормы внесения приведены исключительно в качестве примера и не предусматривают ограничения области применения настоящего изобретения.

Соединение формулы (I) и композиция по изобретению могут использоваться в сочетании с моделями, например, встроенными в компьютерные программы для управления сельскохозяйственными культурами на конкретных участках, спутникового земледелия, точного земледелия или точного сельского хозяйства. Такие модели поддерживают управление сельскохозяйственными угодьями на конкретных участках с данными из различных источников, таких как почвы, погода, сельскохозяйственные культуры (например, тип, стадия роста, здоровье растений), сорняки (например, тип, стадия роста), болезни, вредители, питательные вещества, вода, влажность, биомасса, спутниковые данные, урожайность и т.д. с целью оптимизации прибыльности, устойчивости и защиты окружающей среды. В частности, такие модели могут помочь оптимизировать агрономические решения, контролировать точность внесения пестицидов и фиксировать выполненную работу.

В качестве примера, соединение формулы (I) можно наносить на сельскохозяйственные культуры согласно соответствующему режиму дозирования, если модель моделирует развитие грибкового заболевания и рассчитывает, что достигнут порог, при котором рекомендуется применять к культурным растениям соединение формулы (I).

К представленным на рынке системам со встроенными агрономическими моделями относятся, например, FieldScripts™ компании The Climate Corporation, Harvio™ компании BASF, AGLogic™ компании John Deere и т.д.

Соединение формулы (I) также можно использовать в сочетании с интеллектуальным оборудованием для распыления, таким как, например, оборудование для точечного распыления или оборудование для высокоточного распыления, прикрепленное или размещенное внутри сельскохозяйственной машины, такой как трактор, робот, вертолет, самолет, беспилотный летательный аппарат (БПЛА), например, дрон и т.д. Такое оборудование обычно включает входные датчики (например, камеру) и блок обработки, настроенный для анализа входных данных и выдачи на их основе решения о применении соединения по изобретению к сельскохозяйственным культурам (соответственно, к сорнякам) конкретным и точным образом. Для использования такого интеллектуального опрыскивающего оборудования обычно также необходимы системы определения местоположения (например, GPS-приемники), обеспечивающие локализацию зарегистрированных данных, а также направление или контроль сельскохозяйственных машин; географические информационные системы (ГИС) для представления информации на понятных картах и соответствующие сельскохозяйственные машины для выполнения необходимых сельскохозяйственных работ, таких как опрыскивание.

Например, грибковые заболевания можно обнаружить по полученным с камеры изображениям. Например, грибковые заболевания можно идентифицировать и/или классифицировать на основе этих изображений. Для такой идентификации и/или классификации могут использоваться алгоритмы обработки изображений. Такие алгоритмы обработки изображений могут использовать алгоритмы машинного обучения, такие как обученные нейронные сети, деревья решений и алгоритмы искусственного интеллекта. За счет этого соединения, описанные в настоящем документе, можно применять только там, где это необходимо.

Далее аспекты настоящего изобретения поясняются в свете следующих примеров, которые не должны рассматриваться, как ограничивающие объем настоящего изобретения.

А. ПРИМЕРЫ

А-1. Общие положения

А-1.1. Измерение значений LogP

Измерение значений LogP, представленных в настоящем документе, осуществлялось в соответствии с Директивой ЕС 79/831/ЕЭС, Приложение V.A8 путем ВЭЖХ (высокоэффективная жидкостная хроматография) на колонках с обращенными фазами с использованием следующих методов:

^[a] Значение LogP определяется посредством измерения LC-UV в кислотном диапазоне использованием 0,1 % муравьиной кислоты в воде и ацетонитрила в качестве элюента (линейный градиент от 10 % до 95 % ацетонитрила).

Значение ^[b] LogP определяется посредством измерения LC-UV в нейтральном диапазоне с использованием 0,001 молярного раствора ацетата аммония в воде и ацетонитрила в качестве элюента (линейный градиент от 10 % до 95 % ацетонитрила).

Значение ^[c] LogP определяется посредством измерения LC-UV в кислотном диапазоне с использованием 0,1 % фосфорной кислоты и ацетонитрила в качестве элюента (линейный градиент от 10 % до 95 % ацетонитрила).

Если в рамках одного и того же метода имеется несколько значений LogP, то приводятся все значения, которые записываются через знак «+».

Калибровка осуществлялась с использованием неразветвленных алкан-2-онов (с 3 – 16 атомами углерода) с известными значениями LogP (измерение значений LogP с использованием времени удержания с линейной интерполяцией между последовательными алканонами). Максимальные лямбда-значения определялись с использованием УФ-спектров от 200 нм до 400 нм и пиковых значений хроматографических сигналов.

А-1.2. Данные ¹H-NMR

Данные ¹H-NMR выбранных примеров, представленных в настоящем документе, приведены в форме перечней пиков ¹H-NMR. Для каждого пика сигнала указаны δ -значение в ppm и интенсивность сигнала в круглых скобках. Между парами δ -значение – интенсивность сигнала в качестве разделителя поставлена точка с запятой.

Таким образом, перечень пиков имеет следующую форму:

δ_1 (интенсивность₁); δ_2 (интенсивность₂);; δ_i (интенсивность_i);; δ_n (интенсивность_n)

Интенсивность острых сигналов взаимосвязана с высотой сигналов в отпечатанном спектре ЯМР в см и показывает фактические отношения интенсивности сигналов. Из широких сигналов могут быть показаны несколько пиков или середина сигнала, а также их относительная интенсивность в сравнении с наиболее интенсивным сигналом в спектре.

Для калибровки химического сдвига для ^1H спектров, нами использовался тетраметилсилан и/или химический сдвиг использовавшегося растворителя, в частности, в случае спектров, измерение которых осуществлялось в ДМСО. Таким образом, в перечнях пиков NMR могут появляться пики тетраметилсилана, но не обязательно.

Перечни пиков ^1H -NMR аналогичны классическим отпечаткам ^1H -NMR и, таким образом, обычно включают все пики, которые перечислены при классической NMR-интерпретации.

Дополнительно могут быть показаны, например, классические сигналы ^1H -ЯМР отпечатков растворителей, стереоизомеров целевых соединений, которые также являются целью изобретения, и/или пики примесей.

Для того чтобы показать сигналы соединений в дельта-диапазоне растворителей и/или воды показаны обычные пики растворителей, например, пики ДМСО в ДМСО- D_6 и пик воды в наших перечнях пиков ^1H -NMR, которые обычно в среднем имеют высокую интенсивность.

Пики стереоизомеров целевых соединений и/или пики примесей обычно в среднем имеют более низкую интенсивность, чем пики целевых соединений (например, с чистотой $>90\%$).

Такие стереоизомеры и/или примеси могут быть типичными для определенных способов получения. Таким образом, их пики могут помочь исследовать воспроизведение способов получения по нашему изобретению с помощью «отпечатков пальцев побочных продуктов».

Специалист, рассчитывающий пики целевых соединений известными методами (MestреС, АСD-симуляция, а также с определенными эмпирически ожидаемыми значениями), может выделить пики целевых соединений, при необходимости, с использованием дополнительных фильтров интенсивности. Такое выделение пиков аналогично выбору соответствующих пиков при классической $^1\text{H-NMR}$ интерпретации.

Более подробная информация по описанию данных ЯМР с перечнем пиков приведена в публикации «Перечисление данных по перечням пиков ЯМР в патентных заявках» в базе данных Research Disclosure Database, № 564025.

Приведенные ниже примеры, не имеющие ограничительного характера, иллюстрируют способы получения и биологическую активность соединения формулы (I) по настоящему изобретению.

А-3. Синтез соединений формулы (I) и промежуточных веществ

Соединения, как показано в Таблице 1 ниже, были получены по аналогии с примерами, приведенными выше, или следующими способами, описанными здесь.

Синтез соединений формулы (I) и промежуточных веществ

Пример приготовления 1: приготовление (5RS)-5-(2-хлор-4-метилбензил)-3-[3-(3-хлорфенокси)-6-метилпиридазин-4-ил]-5,6-дигидро-4Н-1,2,4-оксадиазина (соединение I-004)

Этап 1: приготовление N-[(2RS)-1-хлор-3-(2-хлор-4-метилфенил)пропан-2-ил]-3-(3-хлорфенокси)-6-метилпиридазин-4-карбоксамида (соединение 14-03)

В атмосфере аргона, к раствору 3-(3-хлорфенокси)-6-метилпиридазин-4-карбоновой кислоты (250 мг, 0.95 ммоль) и пропилфосфонового ангидрида (1 мЛ, 3.49 ммоль, 50% в ТГФ) в дихлорметане (8 мЛ) добавили N,N-диизопропилэтиламин (0.6 мЛ, 3.49 ммоль) и (2RS)-1-хлор-3-(2-хлор-4-метилфенил)пропан-2-хлорид аминия (264.5 мг, 1.1 ммоль). Реакционную смесь перемешивали при комнатной температуре в течение 1ч, разбавили водой и экстрагировали дихлорметаном (3 x 200 мЛ). Органические экстракты промыли насыщенным водным раствором бикарбоната натрия и брином, высушили над сульфатом магния, отфильтровали и сконцентрировали при пониженном давлении. В результате очистки остатка с помощью колоночной хроматографии на силикагеле (градиент гептан/этилацетат) получили, после выпаривания растворителей, 257 мг (94% чистота, 55% выход) N-[(2RS)-1-хлор-3-(2-хлор-4-метилфенил)пропан-2-ил]-3-(3-хлорфенокси)-6-метилпиридазин-4-карбоксамида в виде белого твердого вещества.

Этап 2: приготовление N-[(2RS)-1-хлор-3-(2-хлор-4-метилфенил)пропан-2-ил]-3-(3-хлорфенокси)-N'-гидрокси-6-метилпиридазин-4-карбоксимидамида (соединение 15-03)

К раствору N-[(2RS)-1-хлор-3-(2-хлор-4-метилфенил)пропан-2-ил]-3-(3-хлорфенокси)-6-метилпиридазин-4-карбоксамида (257 мг, 0.55 ммоль) в толуоле (11 мЛ) добавили пентахлорид фосфора (345 мг, 1.65 ммоль). Реакционную смесь перемешивали при 75°C в течение 30мин, затем сконцентрировали при пониженном давлении. Остаток растворили в ацетонитриле (10 мЛ) и добавили к раствору гидроксиламина (0.68 мЛ, 11.1 ммоль, 50% в воде) в ацетонитриле (10

мЛ). после перемешивания при комнатной температуре в течение 1ч, реакционную смесь разбавили водой и экстрагировали этилацетатом (3 x 50 мЛ). Органические экстракты промыли водой и брином, высушили над сульфатом натрия, отфильтровали и сконцентрировали при пониженном давлении. В результате очистки остатка с помощью колоночной хроматографии на силикагеле (градиент гептан/этилацетат) получили, после выпаривания растворителей, 91 мг (95% чистота, 32% выход) N-[(2RS)-1-хлор-3-(2-хлор-4-метилфенил)пропан-2-ил]-3-(3-хлорфенокси)-N'-гидрокси-6-метилпиридазин-4-карбоксимидамида.

Этап 3: приготовление (5RS)-5-(2-хлор-4-метилбензил)-3-[3-(3-хлорфенокси)-6-метилпиридазин-4-ил]-5,6-дигидро-4Н-1,2,4-оксадиазина

К раствору N-[(2RS)-1-хлор-3-(2-хлор-4-метилфенил)пропан-2-ил]-3-(3-хлорфенокси)-N'-гидрокси-6-метилпиридазин-4-карбоксимидамида (91 мг, 0.19 ммоль) в тетрагидрофуране (7 мЛ) добавили при 0°C трет-бутоксид натрия (18 мг, 0.19 ммоль). Реакционную смесь перемешивали в течение 10 мин, затем разбавили водой и экстрагировали этилацетатом (3 x 50 мЛ). Органические экстракты высушили над сульфатом натрия, отфильтровали и сконцентрировали при пониженном давлении. В результате очистки остатка с помощью колоночной хроматографии на силикагеле (градиент гептан/этилацетат) получили, после выпаривания растворителей, 37 мг (96% чистота, 42% выход) (5RS)-5-(2-хлор-4-метилбензил)-3-[3-(3-хлорфенокси)-6-метилпиридазин-4-ил]-5,6-дигидро-4Н-1,2,4-оксадиазина.

Пример приготовления 2: приготовление (5RS)-3-[3-(3-хлорфенокси)-6-метилпиридазин-4-ил]-5-(2,4-диметилбензил)-5,6-дигидро-4Н-1,2,4-оксадиазина (соединение I-002)

Этап 1: приготовление 3-(3-хлорфенокси)-N-{(2RS)-1-(2,4-диметилфенил)-3-[(1,3-диоксо-1,3-дигидро-2Н-изоиндол-2-ил)окси]пропан-2-ил}-6-метилпиридазин-4-карбоксамид (соединение 3-01)

В атмосфере аргона, к смеси 3-(3-хлорфенокси)-6-метилпиридазин-4-карбоновой кислоты (250 мг, 0.94 ммоль) и НАТУ (395 мг, 1.0 ммоль) в ДМФ (6 мЛ) добавили при 0°C, 2-[{(2RS)-2-амино-3-(2,4-диметилфенил)пропил]окси}-1Н-изоиндол-1,3(2Н)-дион трифторацетат (455 мг, 1.04 ммоль) и N,N-диизопропилэтиламин (0.49 мЛ, 2.83 ммоль). Через 15 мин при 0°C, реакционную

смесь перемешивали в течение 1ч при комнатной температуре. Затем ее разбавили водой и экстрагировали этилацетатом (2 x 200 мЛ). Органические экстракты высушили над сульфатом магния, отфильтровали и сконцентрировали при пониженном давлении. В результате очистки остатка с помощью колоночной хроматографии на силикагеле (градиент гептан/этилацетат) получили, после выпаривания растворителей, 296 мг (90% чистота, 49% выход) 3-(3-хлорфенокси)-N-{(2RS)-1-(2,4-диметилфенил)-3-[(1,3-диоксо-1,3-дигидро-2H-изоиндол-2-ил)окси]пропан-2-ил}-6-метилпиридазин-4-карбоксамида в виде белого масла.

Этап 2: приготовление N-[(2RS)-1-(аминоокси)-3-(2,4-диметилфенил)пропан-2-ил]-3-(3-хлорфенокси)-6-метилпиридазин-4-карбоксамида (соединение 4-01)

В атмосфере аргона, моногидрат гидразина (0.09 мЛ, 0.55 ммоль) добавили к раствору 3-(3-хлорфенокси)-N-{(2RS)-1-(2,4-диметилфенил)-3-[(1,3-диоксо-1,3-дигидро-2H-изоиндол-2-ил)окси]пропан-2-ил}-6-метилпиридазин-4-карбоксамида (296 мг, 0.51 ммоль) в дихлорметане/метаноле (10 мЛ, 1:1). Реакционную смесь перемешивали в течение 3ч при комнатной температуре и сконцентрировали. Затем ее разбавили водой и экстрагировали дихлорметаном (2 x 200 мЛ). Органические экстракты высушили над сульфатом магния, отфильтровали и сконцентрировали при пониженном давлении. В результате выпаривания растворителей получили 185 мг (85% чистота, 69% выход) N-[(2RS)-1-(аминоокси)-3-(2,4-диметилфенил)пропан-2-ил]-3-(3-хлорфенокси)-6-метилпиридазин-4-карбоксамида в виде бесцветного масла.

Этап 3: приготовление (5RS)-3-[3-(3-хлорфенокси)-6-метилпиридазин-4-ил]-5-(2,4-диметилбензил)-5,6-дигидро-4H-1,2,4-оксадиазина

В атмосфере аргона, POCl₃ (0.09 мЛ, 0.92 ммоль) добавили при 85°C к раствору N-[(2RS)-1-(аминоокси)-3-(2,4-диметилфенил)пропан-2-ил]-3-(3-хлорфенокси)-6-метилпиридазин-4-карбоксамид (135 мг, 0.31 ммоль) в ацетонитриле (22 мЛ). Реакционную смесь перемешивали в течение 2ч при 85°C. После охлаждения до комнатной температуры, смесь влили в насыщенный раствор бикарбоната натрия и экстрагировали этилацетатом (2 x 100 мЛ). Органические экстракты высушили над сульфатом магния, отфильтровали и сконцентрировали при пониженном давлении. В результате очистки остатка с помощью колоночной

хроматографии на силикагеле (градиент гептан/этилацетат) получили, после выпаривания растворителей, 58 мг (97% чистота, 43% выход) (5RS)-3-[3-(3-хлорфенокси)-6-метилпиридазин-4-ил]-5-(2,4-диметилбензил)-5,6-дигидро-4Н-1,2,4-оксадиазина в виде бесцветного масла.

Приготовление примера 3: приготовление (5RS)-3-[6-хлор-3-(2-фтор-3-метилфенокси)пиридазин-4-ил]-5-(2,4-дихлорбензил)-5,6-дигидро-4Н-1,2,4-оксадиазина (соединение I-005)

В атмосфере аргона, раствор 2-фтор-3-метилфенола (77 мг, 0.61 ммоль) в 2-метилтетрагидрофуране (1 мЛ) добавили к суспензии карбоната цезия (249 мг, 0.76 ммоль) в 2-метилтетрагидрофуране (1 мЛ), охлажденной при 0°C. Через 1ч, раствор (5RS)-5-(2,4-дихлорбензил)-3-(3,6-дихлорпиридазин-4-ил)-5,6-дигидро-4Н-1,2,4-оксадиазина (200 мг, 0.51 ммоль) в 2-метилтетрагидрофуране (8 мЛ) добавили к реакционной смеси. Реакцию нагревали при 55°C в течение 4ч, затем разбавили водой и экстрагировали этилацетатом (2 x 50 мЛ). Органические экстракты промыли водой и брином, высушили над сульфатом магния, отфильтровали и сконцентрировали при пониженном давлении. В результате очистки остатка с помощью колоночной хроматографии на силикагеле (градиент гептан/этилацетат) получили, после выпаривания растворителей, 161 мг (90% чистота, 59% выход) (5RS)-3-[6-хлор-3-(2-фтор-3-метилфенокси)пиридазин-4-ил]-5-(2,4-дихлорбензил)-5,6-дигидро-4Н-1,2,4-оксадиазина в виде масла.

Приготовление примера 4: приготовление (5RS)-5-(2,4-дихлорбензил)-3-[3-(2-фтор-3-метилфенокси)-6-метилпиридазин-4-ил]-5,6-дигидро-4Н-1,2,4-оксадиазина (соединение I-007)

В сосуде для микроволновой обработки, (5RS)-3-[6-хлор-3-(2-фтор-3-метилфенокси)пиридазин-4-ил]-5-(2,4-дихлорбензил)-5,6-дигидро-4Н-1,2,4-оксадиазин (130 мг, 0.27 ммоль), 2,4,6-триметил-1,3,5,2,4,6-триоксатриборинан (110 мг, 0.88 ммоль), карбонат цезия (132 мг, 0.41 ммоль) и Pd(dppf)Cl₂ (11 мг, 0.013 ммоль) суспендировали в атмосфере аргона в диоксане/воде (6 мЛ, 2:1). Пробирку запечатали, и реакционную смесь нагревали в микроволновой печи при 110°C в течение 30 мин. Реакционную смесь разбавили водой и экстрагировали этилацетатом (2 x 50 мЛ). Органические экстракты промыли водой и брином, высушили над сульфатом магния, отфильтровали и сконцентрировали при

пониженном давлении. В результате очистки остатка с помощью колоночной хроматографии на силикагеле (градиент гептан/этилацетат) получили, после выпаривания растворителей, 70 мг (95% чистота, 53% выход) (5RS)-5-(2,4-дихлорбензил)-3-[3-(2-фтор-3-метилфенокси)-6-метилпиридазин-4-ил]-5,6-дигидро-4Н-1,2,4-оксадиазина в виде масла.

Приготовление примера 5: приготовление (5RS)-3-[3-(3-циклопропил-2-фтор-фенокси)-6-(1-этоксивинил)пиридазин-4-ил]-5-[(2,4-дихлорфенил)метил]-5,6-дигидро-4Н-1,2,4-оксадиазина (соединение I-020)

В запечатанной пробирке в атмосфере аргона, смесь (5RS)-3-[6-хлор-3-(3-циклопропил-2-фтор-фенокси)пиридазин-4-ил]-5-[(2,4-дихлорфенил)метил]-5,6-дигидро-4Н-1,2,4-оксадиазина [2446127-10-0] (1.4 г, 2.75 ммоль), трибутил(1-этоксивинил)станнана [97674-02-7] (1.244 г, 3.44 ммоль) и бис(трифенилфосфин)палладий (II) дихлорида [13965-03-2] (194 мг, 0.27 ммоль) в ДМФ (9.7 мл) нагревали под воздействием микроволнового излучения при 120°C в течение 20 мин. После охлаждения до комнатной температуры, смесь влили в насыщенный раствор хлорида натрия и экстрагировали этилацетатом. Объединенные органические слои высушили над сульфатом магния, отфильтровали и сконцентрировали при пониженном давлении. В результате очистки остатка с помощью колоночной хроматографии на силикагеле (градиент гептан/этилацетат) получили, после выпаривания растворителей, 1.024 г (87% чистота, 59% выход) (5RS)-3-[3-(3-циклопропил-2-фтор-фенокси)-6-(1-этоксивинил)пиридазин-4-ил]-5-[(2,4-дихлорфенил)метил]-5,6-дигидро-4Н-1,2,4-оксадиазина в виде желтого твердого вещества.

Приготовление примера 6: приготовление (1RS)-1-[6-(3-циклопропил-2-фтор-фенокси)-5-[(5RS)-5-[(2,4-дихлорфенил)метил]-5,6-дигидро-4Н-1,2,4-оксадиазин-3-ил]пиридазин-3-ил]этанола

(соединение I-023)

Этап 1: приготовление 1-[6-(3-циклопропил-2-фтор-фенокси)-5-[(5RS)-5-[(2,4-дихлорфенил)метил]-5,6-дигидро-4Н-1,2,4-оксадиазин-3-ил]пиридазин-3-ил]этанола

К раствору (5RS)-3-[3-(3-циклопропил-2-фтор-фенокси)-6-(1-этоксивинил)пиридазин-4-ил]-5-[(2,4-дихлорфенил)метил]-5,6-дигидро-4Н-1,2,4-

оксадиазина [2446126-79-8] (960 мг, 1.76 ммоль) в ТГФ (5 мЛ) добавили 2N водного раствора HCl (5 мЛ), и реакционную смесь перемешивали при комнатной температуре в течение 30 мин. Реакционную смесь разбавили водой и экстрагировали этилацетатом. Объединенные органические слои высушили над сульфатом магния, отфильтровали и сконцентрировали при пониженном давлении. В результате очистки остатка методом колоночной хроматографии на силикагеле, затем очистки с помощью силикагелевой хроматографии (гептан/этилацетат 100/0 - 60/40) получили 780 мг (99% чистота, 85% выход) 1-[6-(3-циклопропил-2-фтор-фенокси)-5-[(5RS)-5-[(2,4-дихлорфенил)метил]-5,6-дигидро-4Н-1,2,4-оксадиазин-3-ил]пиридазин-3-ил]этенона.

Этап 2: приготовление (1RS)-1-[6-(3-циклопропил-2-фтор-фенокси)-5-[(5RS)-5-[(2,4-дихлорфенил)метил]-5,6-дигидро-4Н-1,2,4-оксадиазин-3-ил]пиридазин-3-ил]этанола

К раствору 1-[6-(3-циклопропил-2-фтор-фенокси)-5-[(5RS)-5-[(2,4-дихлорфенил)метил]-5,6-дигидро-4Н-1,2,4-оксадиазин-3-ил]пиридазин-3-ил]этенона (680 мг, 1.31 ммоль) в метаноле dry (10 мЛ) при 0 °С добавили каплями раствор борогидрида натрия (29 мг, 0.79 ммоль) в метаноле dry (0.5 мЛ). Реакционную смесь перемешивали при 0 °С в течение 10 мин, и затем резко охладили насыщенным водным раствором хлорида аммония. Водную фазу экстрагировали этилацетатом. Объединенные органические слои высушили на гидрофобном фильтре и сконцентрировали. Неочищенный продукт очистили с помощью флэш-хроматографии на силикагеле, с получением 510 мг (99% чистота, 74% выход) (1RS)-1-[6-(3-циклопропил-2-фтор-фенокси)-5-[(5RS)-5-[(2,4-дихлорфенил)-метил]-5,6-дигидро-4Н-1,2,4-оксадиазин-3-ил]пиридазин-3-ил]этанола.

Приготовление примера 7: приготовление (5RS)-3-[3-(3-циклопропил-2-фтор-фенокси)-6-[(1RS)-1-фторэтил]пиридазин-4-ил]-5-[(2,4-дихлорфенил)метил]-5,6-дигидро-4Н-1,2,4-оксадиазина (соединение I-018)

К раствору (1RS)-1-[6-(3-циклопропил-2-фтор-фенокси)-5-[(5RS)-5-[(2,4-дихлорфенил)метил]-5,6-дигидро-4Н-1,2,4-оксадиазин-3-ил]пиридазин-3-ил]этанола (соединение I-023) (410 мг, 0.79 ммоль) в дихлорметане (2 мЛ) при 0 °С добавили каплями трифторид диэтиламиносеры [38078-09-0] (0.209 мЛ, 0.58

ммоль). Реакционную смесь перемешивали при 0 °С в течение 2 ч, затем резко охладили водным насыщенным раствором бикарбоната натрия. Водную фазу экстрагировали этилацетатом. Объединенные органические слои высушили на гидрофобном фильтре и сконцентрировали. Неочищенный продукт очистили с помощью флэш-хроматографии на силикагеле, с получением 240 мг (99% чистота, 58% выход) (5RS)-3-[3-(3-циклопропил-2-фтор-фенокси)-6-[(1RS)-1-фторэтил]пиридазин-4-ил]-5-[(2,4-дихлорфенил)метил]-5,6-дигидро-4Н-1,2,4-оксадиазина.

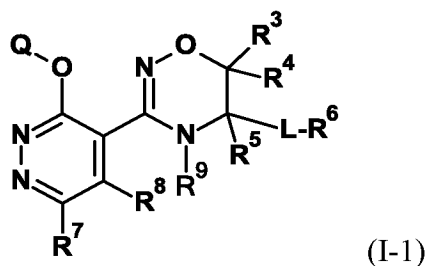
Приготовление примера 8: приготовление (5RS)-3-[6-хлор-3-(3-циклопропил-2-фтор-фенокси)пиридазин-4-ил]-5-[(2,4-дихлорфенил)метил]-5,6-дигидро-1,2,4-оксадиазин-4-карбальдегида (соединение I-025)

Раствор 6-хлор-3-(3-циклопропил-2-фтор-фенокси)-N-[(1RS)-1-(аминооксиметил)-2-(2,4-дихлорфенил)этил]пиридазин-4-карбоксамида (4.78 г, 9.09 ммоль) (соединение 4-02) в ацетонитриле (40 мЛ) нагревали при 85 °С, затем добавили оксихлорид фосфора (2.54 мЛ, 27.2 ммоль), и реакционную смесь перемешивали в течение 18 ч. Реакционную смесь охладили до комнатной температуры, затем влили в насыщенный водный раствор NaHCO₃, и затем экстрагировали этилацетатом. Собранные органические фазы высушили над гидрофобным фильтром и сконцентрировали при пониженном давлении.

Неочищенный продукт очистили методом флэш-хроматографии, и затем ВЭЖХ хроматографии с получением 1.02 г (99% чистота, 21% выход) (5RS)-3-[6-хлор-3-(3-циклопропил-2-фтор-фенокси)пиридазин-4-ил]-5-[(2,4-дихлорфенил)метил]-5,6-дигидро-1,2,4-оксадиазин-4-карбальдегида.

Соединения формулы (I-1), перечисленные в Таблице 1, были приготовлены в соответствии с процедурами, описанными выше.

Таблица 1: Соединения согласно формуле (I-1)



Прим. №	R ⁷	R ⁸	Q	R ⁹	R ³	R ⁴	R ⁵	L-R ⁶	LogP
I-001	метил	H	3-хлорфенил	H	H	H	H	(2-бром-4-метилфенил)метил	3.94 ^[a]
I-002	метил	H	3-хлорфенил	H	H	H	H	(2,4-диметилфенил)метил	3.77 ^[a]
I-003	метил	H	2-фтор-3-метилфенил	H	H	H	H	(2-хлор-4-метилфенил)метил	3.78 ^[a]
I-004	метил	H	3-хлорфенил	H	H	H	H	(2-хлор-4-метилфенил)метил	3.81 ^[a]
I-005	хлор	H	2-фтор-3-метилфенил	H	H	H	H	(2,4-дихлорфенил)метил	4.47 ^[a]
I-006	метил	H	3-хлор-2-фторфенил	H	H	H	H	(2-бром-4-метилфенил)метил	4.01 ^[a]
I-007	метил	H	2-фтор-3-метилфенил	H	H	H	H	(2,4-дихлорфенил)метил	3.91 ^[a]
I-008	метил	H	2-фтор-3-метилфенил	H	H	H	H	(3,5-диметилфенил)метил	3.85 ^[a]
I-009	метил	H	3-хлорфенил	H	H	H	H	(3,5-диметилфенил)метил	3.87 ^[a]
I-010	метил	H	3-хлор-2-фторфенил	H	H	H	H	(3,5-диметилфенил)метил	4.01 ^[a]
I-011	метил	H	3-хлорфенил	H	H	H	H	(2,5-диметилфенил)метил	3.70 ^[a]
I-012	метил	H	3-хлор-2-фторфенил	H	H	H	H	(2,5-диметилфенил)метил	3.80 ^[a]
I-013	метил	H	2-фтор-3-метилфенил	H	H	H	H	(2,5-диметилфенил)метил	3.69 ^[a]
I-014	метил	H	3-этил-2-фторфенил	H	H	H	H	(2,4-диметилфенил)метил	4.12 ^[a]
I-015	метил	H	3-(1-фторциклопропил)фенил	H	H	H	H	(2,4-диметилфенил)метил	3.78 ^[a]
I-016	1-гидроксиэтил	H	3-циклопропилфенил	H	H	H	H	(2,4-диметилфенил)метил	3.55 ^[a]
I-017	хлор	H	3-хлорфенил	H	H	H	H	(2-хлор-4-метилфенил)метил	4.44 ^[a]
I-018	1-фторэтил	H	3-циклопропил-2-фторфенил	H	H	H	H	(2,4-дихлорфенил)метил	4.74 ^[a]
I-019	1-этоксипропан-1-ил	H	3-циклопропилфенил	H	H	H	H	(2,4-дихлорфенил)метил	5.19 ^[a]
I-020	1-этоксипропан-1-ил	H	3-циклопропил-2-фторфенил	H	H	H	H	(2,4-дихлорфенил)метил	5.41 ^[a]
I-021	дихлорметил	H	3-циклопропил-2-фторфенил	H	H	H	H	(2,4-диметилфенил)метил	5.11 ^[a]
I-022	метил	H	3-(1-хлорциклопропил)фенил	H	H	H	H	(2,4-дихлорфенил)метил	4.51 ^[a]
I-023	1-гидроксиэтил	H	3-циклопропил-2-фторфенил	H	H	H	H	(2,4-дихлорфенил)метил	3.87 ^[a]

Прим. №	R ⁷	R ⁸	Q	R ⁹	R ³	R ⁴	R ⁵	L-R ⁶	LogP
I-024	хлор	H	3-(1-хлорцикло- пропил)фенил	H	H	H	H	(2,4- дихлорфенил)метил	4.93 ^[a]
I-025	хлор	H	3-циклопропил- 2-фторфенил	форм ил	H	H	H	(2,4- дихлорфенил)метил	4.93 ^[a]

Таблица 2: ¹H-ЯМР соединений формулы (I-1)

I-001: ¹H-ЯМР(500.1 MHz, CDCl₃): δ= 7.9378 (5.2); 7.3581 (1.3); 7.3418 (2.8); 7.3254 (4.0); 7.3078 (0.5); 7.2680 (1.5); 7.2607 (11.3); 7.2537 (1.3); 7.2517 (1.3); 7.2501 (1.3); 7.1763 (0.3); 7.1722 (0.5); 7.1186 (0.6); 7.0980 (0.4); 7.0607 (1.8); 7.0565 (2.9); 7.0523 (1.7); 7.0427 (2.4); 7.0273 (2.5); 6.9865 (1.1); 6.9849 (1.2); 6.9820 (1.1); 6.9805 (1.0); 6.9702 (1.1); 6.9686 (1.1); 6.9657 (1.0); 6.9641 (1.0); 6.8038 (1.2); 6.8023 (1.2); 6.7886 (1.1); 6.0935 (1.2); 4.2025 (1.0); 4.1958 (1.1); 4.1808 (1.2); 4.1740 (1.2); 4.1427 (0.9); 4.1284 (2.8); 4.1141 (2.8); 4.0998 (1.0); 4.0160 (0.4); 4.0105 (0.5); 4.0058 (0.5); 4.0011 (0.6); 3.9967 (0.5); 3.9918 (0.6); 3.9865 (0.4); 3.8712 (1.4); 3.8602 (1.2); 3.8493 (1.2); 3.8384 (1.1); 3.7454 (0.3); 3.1271 (0.9); 3.1175 (0.9); 3.1001 (1.1); 3.0905 (1.1); 2.8904 (1.1); 2.8713 (1.2); 2.8634 (1.0); 2.8443 (1.0); 2.6448 (16.0); 2.6354 (0.8); 2.5277 (2.2); 2.3491 (1.6); 2.2479 (0.4); 2.2182 (11.4); 2.0434 (12.2); 1.5766 (1.8); 1.2728 (3.2); 1.2586 (6.4); 1.2443 (3.2); 0.0696 (1.3); 0.0062 (0.4); -0.0002 (13.1); -0.0067 (0.5)
I-002: ¹H-ЯМР(500.1 MHz, CDCl₃): δ= 7.9294 (5.2); 7.3486 (1.2); 7.3324 (2.8); 7.3162 (1.8); 7.2648 (1.6); 7.2597 (9.2); 7.2507 (0.9); 7.2490 (1.0); 7.2472 (1.0); 7.0242 (1.5); 7.0200 (2.7); 7.0159 (1.6); 6.9633 (2.0); 6.9480 (2.3); 6.9378 (1.1); 6.9364 (1.2); 6.9336 (1.2); 6.9321 (1.1); 6.9216 (1.1); 6.9201 (1.2); 6.9171 (1.2); 6.9154 (1.3); 6.9086 (2.4); 6.7287 (1.2); 6.7139 (1.1); 6.1077 (1.4); 4.2604 (1.0); 4.2538 (1.1); 4.2389 (1.1); 4.2323 (1.1); 4.1283 (0.4); 4.1140 (0.4); 3.8721 (0.4); 3.8682 (0.5); 3.8645 (0.6); 3.8586 (0.6); 3.8522 (0.6); 3.8486 (0.5); 3.8451 (0.5); 3.8426 (0.4); 3.7993 (1.6); 3.7867 (1.1); 3.7777 (1.4); 3.7651 (1.0); 2.9869 (0.8); 2.9775 (0.8); 2.9595 (1.0); 2.9501 (1.0); 2.7035 (1.1); 2.6836 (1.1); 2.6762 (1.0); 2.6561 (1.0); 2.6382 (16.0); 2.2611 (12.2); 2.2100 (11.5); 2.0431 (1.7); 1.5749 (1.3); 1.2727 (0.5); 1.2584 (1.0); 1.2442 (0.5); 0.0695 (1.0); -0.0002 (10.0); -0.0066 (0.5)
I-003: ¹H-ЯМР(500.1 MHz, CDCl₃): δ= 7.9085 (5.3); 7.2600 (7.8); 7.1115 (2.6); 7.0954 (0.9); 7.0891 (1.8); 7.0734 (2.3); 7.0647 (2.2); 7.0581 (1.4); 7.0494 (3.1); 7.0356 (0.9); 7.0323 (0.8); 7.0210 (0.4); 7.0168 (0.4); 6.6983 (1.2); 6.6831 (1.1); 6.1600 (1.2); 4.1852 (1.0); 4.1785 (1.1); 4.1634 (1.2); 4.1567 (1.2); 4.1427 (0.5); 4.1284 (1.4); 4.1141 (1.4); 4.0998 (0.5); 4.0009 (0.4); 3.9946 (0.6); 3.9890 (0.6); 3.9831 (0.6); 3.9777 (0.6); 3.9715 (0.4); 3.8682 (1.4); 3.8574 (1.2); 3.8464 (1.2); 3.8356 (1.0); 3.1385 (0.8); 3.1281 (0.9); 3.1116 (1.1); 3.1012 (1.0); 2.8890 (1.1); 2.8708 (1.1); 2.8621 (0.9); 2.8439 (0.9); 2.6300 (16.0); 2.3080 (6.6); 2.3042 (6.7); 2.1738 (11.2); 2.0431 (6.0); 1.5613 (6.8); 1.3026 (0.6); 1.2891 (0.8); 1.2727 (2.5); 1.2655 (2.6); 1.2584 (4.2); 1.2442 (1.9); 0.8956 (1.8); 0.8820 (4.7); 0.8677 (2.2); 0.0062 (0.3); -0.0002 (10.2); -0.0067 (0.4)

I-004: ^1H-ЯМР(400.1 MHz, CDCl_3): δ= 7.9354 (5.2); 7.3632 (1.1); 7.3430 (2.8); 7.3228 (2.0); 7.2734 (1.2); 7.2708 (1.5); 7.2686 (1.5); 7.2661 (1.5); 7.2601 (13.0); 7.2533 (1.3); 7.2507 (1.1); 7.2485 (1.2); 7.2460 (1.0); 7.1236 (2.1); 7.0570 (1.5); 7.0516 (2.9); 7.0469 (3.4); 7.0283 (2.4); 6.9852 (1.2); 6.9827 (1.2); 6.9795 (1.2); 6.9770 (1.1); 6.9649 (1.1); 6.9624 (1.1); 6.9592 (1.1); 6.9567 (1.0); 6.7731 (1.1); 6.7708 (1.2); 6.7540 (1.0); 6.7517 (1.0); 6.0933 (1.1); 4.2095 (0.9); 4.2014 (1.0); 4.1825 (1.1); 4.1741 (1.1); 4.0026 (0.4); 3.9961 (0.5); 3.9902 (0.5); 3.9844 (0.6); 3.9789 (0.6); 3.9730 (0.5); 3.9666 (0.5); 3.9608 (0.3); 3.8601 (1.4); 3.8461 (1.1); 3.8328 (1.2); 3.8189 (1.0); 3.1304 (0.8); 3.1184 (0.8); 3.0966 (1.0); 3.0846 (1.0); 2.8763 (1.1); 2.8526 (1.1); 2.8426 (0.9); 2.8189 (0.8); 2.6442 (16.0); 2.2238 (10.4); 2.0047 (2.0); 1.5593 (1.6); 0.0080 (0.5); -0.0002 (16.4); -0.0083 (0.9)
I-005: ^1H-ЯМР(400.1 MHz, d_6-DMSO): δ= 8.0704 (11.3); 7.5381 (5.3); 7.5329 (5.7); 7.4537 (3.4); 7.4446 (3.4); 7.4021 (4.4); 7.3814 (5.3); 7.2523 (2.1); 7.2436 (2.6); 7.2285 (1.9); 7.2075 (1.3); 7.1923 (8.6); 7.1873 (9.2); 7.1731 (7.1); 7.1668 (3.9); 3.8825 (2.9); 3.8585 (5.0); 3.7850 (1.9); 3.7756 (3.0); 3.7557 (2.2); 3.3103 (29.4); 3.2746 (0.4); 3.0344 (0.6); 2.9996 (2.9); 2.9824 (4.6); 2.9699 (3.1); 2.9508 (1.0); 2.9363 (0.7); 2.5049 (13.3); 2.5008 (17.7); 2.4967 (14.1); 2.2949 (16.0); 2.2439 (0.4); 1.2951 (0.4); 1.2788 (0.7); 1.2457 (3.6); 0.8744 (1.4); 0.8582 (3.7); 0.8406 (1.7); -0.0002 (15.0)
I-006: ^1H-ЯМР(500.1 MHz, CDCl_3): δ= 7.9231 (5.0); 7.3564 (0.7); 7.3510 (0.8); 7.3430 (1.3); 7.3360 (1.3); 7.3241 (0.9); 7.3105 (3.1); 7.2598 (11.3); 7.1669 (0.5); 7.1543 (2.9); 7.1505 (3.2); 7.1403 (3.8); 7.1240 (0.4); 7.0600 (2.4); 7.0447 (2.7); 6.7846 (1.6); 6.7694 (1.5); 5.9917 (1.6); 4.2052 (1.2); 4.1985 (1.3); 4.1833 (1.4); 4.1767 (1.4); 4.1284 (0.6); 4.1141 (0.6); 4.0373 (0.5); 4.0312 (0.8); 4.0227 (0.8); 4.0138 (0.8); 4.0079 (0.6); 3.8911 (1.5); 3.8804 (1.3); 3.8693 (1.3); 3.8585 (1.1); 3.1449 (1.0); 3.1349 (1.0); 3.1179 (1.3); 3.1080 (1.2); 2.9059 (1.3); 2.8871 (1.3); 2.8791 (1.1); 2.8602 (1.0); 2.7413 (0.4); 2.6435 (16.0); 2.3293 (0.4); 2.1823 (13.4); 2.0433 (2.5); 1.5686 (0.9); 1.2728 (0.7); 1.2585 (1.4); 1.2443 (0.6); 0.0693 (0.4); -0.0002 (14.3)
I-007: ^1H-ЯМР(500.1 MHz, CDCl_3): δ= 7.8998 (5.2); 7.3148 (2.8); 7.3107 (2.9); 7.2604 (9.1); 7.1340 (2.8); 7.1177 (4.0); 7.1082 (2.9); 7.0930 (2.8); 7.0778 (1.3); 7.0697 (1.1); 7.0657 (1.1); 7.0553 (1.2); 7.0504 (1.1); 7.0416 (0.6); 7.0359 (0.6); 7.0311 (0.5); 6.8732 (1.6); 6.8691 (1.6); 6.8569 (1.4); 6.8528 (1.4); 6.1302 (1.4); 4.1464 (1.2); 4.1402 (1.3); 4.1278 (1.0); 4.1247 (1.5); 4.1182 (1.5); 4.1144 (1.0); 4.0001 (0.5); 3.9937 (0.8); 3.9846 (0.9); 3.9761 (0.8); 3.9663 (0.5); 3.9226 (1.5); 3.9132 (1.2); 3.9007 (1.3); 3.8913 (1.0); 3.1494 (1.0); 3.1392 (1.0); 3.1224 (1.3); 3.1122 (1.3); 2.9592 (1.3); 2.9408 (1.4); 2.9322 (1.1); 2.9139 (1.0); 2.6377 (16.0); 2.6314 (2.4); 2.3111 (8.4); 2.3079 (8.5); 2.2822 (1.0); 2.1739 (0.4); 2.0433 (2.9); 1.5628 (7.5); 1.2728 (0.8); 1.2585 (1.8); 1.2442 (0.8); 0.0696 (1.7); -0.0002 (10.4)
I-008: ^1H-ЯМР(500.1 MHz, CDCl_3): δ= 7.8968 (3.2); 7.2591 (4.5); 7.0893 (0.8); 7.0773 (0.6); 7.0682 (1.0); 7.0525 (1.5); 7.0371 (0.8); 7.0150 (0.6); 7.0000 (0.8); 6.9859 (0.3); 6.7856 (3.7); 6.7620 (1.6); 6.1955 (1.0); 4.2293 (0.7); 4.2223 (0.7); 4.2076 (0.8); 4.2006 (0.8); 3.9027 (0.4); 3.8980 (0.4); 3.8908 (0.4); 3.8863 (0.4); 3.8798 (0.3); 3.7836 (0.9); 3.7708 (0.7); 3.7619 (0.8); 3.7491 (0.7); 2.9338 (0.6); 2.9234 (0.6); 2.9068 (0.7); 2.8964 (0.7); 2.6676 (0.8); 2.6489 (0.8); 2.6406 (0.7); 2.6209 (10.2); 2.4955 (0.6); 2.2945 (5.0); 2.2920 (5.0); 2.2529 (1.2); 2.1243 (16.0); 2.0431 (0.9); 1.2583 (0.5); -0.0002 (5.5)

I-009: ^1H-ЯМР(500.1 MHz, CDCl_3): δ= 7.9190 (2.7); 7.3271 (0.7); 7.3109 (1.7); 7.2947 (1.1); 7.2594 (3.3); 7.2442 (1.1); 7.2277 (0.7); 6.9759 (0.9); 6.9722 (1.7); 6.9287 (0.9); 6.9248 (0.8); 6.9125 (0.8); 6.9086 (0.7); 6.8224 (1.6); 6.7821 (3.8); 6.1128 (1.1); 4.2645 (0.7); 4.2574 (0.7); 4.2427 (0.8); 4.2357 (0.8); 3.9117 (0.4); 3.9018 (0.4); 3.8929 (0.3); 3.7651 (0.9); 3.7519 (0.8); 3.7434 (0.8); 3.7302 (0.7); 2.9596 (0.6); 2.9500 (0.6); 2.9326 (0.7); 2.9230 (0.7); 2.6349 (9.2); 2.5994 (0.8); 2.5796 (0.8); 2.5724 (0.7); 2.5526 (0.6); 2.2605 (0.4); 2.1516 (16.0); -0.0002 (3.7)
I-010: ^1H-ЯМР(500.1 MHz, CDCl_3): δ= 7.9082 (3.0); 7.3405 (0.5); 7.3349 (0.5); 7.3269 (1.0); 7.3117 (0.7); 7.2593 (6.0); 7.1411 (0.5); 7.1242 (1.3); 7.1090 (2.1); 7.1011 (1.0); 7.0979 (1.0); 7.0848 (0.4); 6.7839 (4.2); 6.7611 (1.9); 6.0405 (1.2); 4.2587 (0.7); 4.2521 (0.8); 4.2370 (0.8); 4.2304 (0.8); 3.9201 (0.6); 3.9119 (0.6); 3.7902 (0.9); 3.7772 (0.8); 3.7685 (0.9); 3.7556 (0.7); 2.9580 (0.6); 2.9481 (0.7); 2.9309 (0.8); 2.9211 (0.7); 2.6417 (1.4); 2.6316 (9.2); 2.6164 (1.0); 2.5968 (0.7); 2.3107 (0.4); 2.2637 (1.0); 2.2551 (1.2); 2.2321 (0.7); 2.2174 (0.7); 2.2025 (0.7); 2.1343 (16.0); 2.0551 (0.3); 2.0433 (1.2); 1.5610 (2.1); 1.2726 (0.5); 1.2582 (1.2); 1.2443 (0.5); -0.0002 (7.8)
I-011: ^1H-ЯМР(500.1 MHz, CDCl_3): δ= 8.0108 (0.3); 7.9298 (5.3); 7.3280 (1.2); 7.3118 (2.8); 7.2956 (1.8); 7.2595 (8.6); 7.2440 (1.9); 7.2278 (1.2); 6.9874 (4.2); 6.9718 (2.5); 6.9337 (1.6); 6.9316 (1.5); 6.9290 (1.6); 6.9150 (4.4); 6.9132 (4.4); 6.0858 (1.7); 4.2352 (1.2); 4.2285 (1.2); 4.2135 (1.3); 4.2068 (1.3); 4.1286 (0.4); 4.1143 (0.4); 3.9247 (0.5); 3.9141 (0.8); 3.9063 (0.8); 3.8954 (0.6); 3.8235 (1.6); 3.8112 (1.2); 3.8018 (1.4); 3.7895 (1.1); 2.9694 (1.0); 2.9592 (1.0); 2.9419 (1.3); 2.9317 (1.2); 2.7472 (1.3); 2.7279 (1.4); 2.7198 (1.1); 2.7005 (1.0); 2.6432 (16.0); 2.2469 (13.1); 2.1132 (12.6); 2.0436 (1.8); 1.2728 (0.5); 1.2580 (1.4); 1.2444 (0.5); 0.0700 (10.7); -0.0002 (10.9)
I-012: ^1H-ЯМР(500.1 MHz, CDCl_3): δ= 7.8490 (5.3); 7.2708 (0.6); 7.2640 (0.7); 7.2579 (1.3); 7.2521 (1.0); 7.2423 (0.9); 7.2386 (0.9); 7.1896 (13.3); 7.0729 (0.6); 7.0560 (2.2); 7.0485 (1.7); 7.0420 (4.2); 7.0371 (1.5); 7.0329 (2.0); 7.0207 (0.5); 7.0167 (0.4); 6.9183 (0.4); 6.8855 (0.5); 6.8666 (1.8); 6.8505 (4.8); 6.7794 (1.7); 6.7664 (1.1); 5.9478 (1.5); 4.1610 (1.1); 4.1543 (1.2); 4.1393 (1.2); 4.1326 (1.2); 4.0586 (0.9); 4.0444 (0.9); 3.8649 (0.5); 3.8584 (0.6); 3.8536 (0.7); 3.8466 (0.8); 3.8417 (0.7); 3.8352 (0.6); 3.8299 (0.4); 3.7740 (1.6); 3.7620 (1.2); 3.7524 (1.5); 3.7457 (0.4); 3.7403 (1.1); 2.9045 (0.9); 2.8937 (0.9); 2.8770 (1.2); 2.8663 (1.2); 2.7138 (1.3); 2.6951 (1.4); 2.6864 (1.0); 2.6681 (1.2); 2.5681 (16.0); 2.4002 (2.5); 2.2421 (0.7); 2.1843 (13.8); 2.0350 (11.7); 1.9736 (3.8); 1.9273 (2.0); 1.2029 (1.1); 1.1885 (2.8); 1.1744 (1.1); -0.0002 (20.3); -0.0641 (0.6); -0.0701 (17.3); -0.0762 (0.8)
I-013: ^1H-ЯМР(500.1 MHz, CDCl_3): δ= 7.8373 (5.4); 7.1888 (7.3); 7.0318 (0.6); 7.0187 (1.3); 7.0069 (1.1); 6.9987 (1.6); 6.9829 (2.5); 6.9676 (1.3); 6.9558 (1.0); 6.9530 (1.0); 6.9410 (1.3); 6.9267 (0.6); 6.8724 (1.8); 6.8556 (3.5); 6.7833 (1.7); 6.7680 (1.2); 6.1073 (1.6); 4.1317 (1.2); 4.1250 (1.2); 4.1101 (1.3); 4.1034 (1.3); 4.0580 (0.5); 4.0438 (0.5); 3.8475 (0.5); 3.8417 (0.7); 3.8361 (0.8); 3.8300 (0.8); 3.8244 (0.8); 3.8184 (0.6); 3.8129 (0.4); 3.7675 (1.6); 3.7556 (1.2); 3.7458 (1.4); 3.7340 (1.1); 2.8950 (1.0); 2.8841 (1.0); 2.8676 (1.3); 2.8566 (1.3); 2.7211 (1.3); 2.7030 (1.3); 2.6938 (1.0); 2.6756 (1.0); 2.5572 (16.0); 2.2355 (0.5); 2.2213 (8.5); 2.2189 (8.4); 2.1830 (13.0); 2.0147 (12.4); 1.9729 (2.0); 1.2023 (0.6); 1.1877 (1.5); 1.1738 (0.6); -0.0002 (13.9); -0.0706 (9.4)

I-014: ^1H-ЯМР(400.1 MHz, CDCl_3): δ= 7.9144 (3.2); 7.2618 (2.8); 7.1501 (0.5); 7.1310 (1.2); 7.1208 (2.2); 7.1019 (1.7); 7.0827 (0.8); 7.0217 (0.8); 7.0069 (1.2); 7.0021 (1.2); 6.9842 (1.9); 6.9651 (1.7); 6.9354 (0.3); 6.8682 (2.2); 6.6661 (1.2); 6.6472 (1.1); 6.2204 (1.5); 5.2972 (2.0); 4.2238 (1.0); 4.2043 (1.0); 4.1981 (1.0); 3.8570 (0.7); 3.8445 (0.8); 3.8340 (0.7); 3.8197 (1.5); 3.8046 (0.7); 3.7935 (1.0); 3.7782 (0.7); 2.9865 (0.7); 2.9753 (0.7); 2.9544 (1.8); 2.9414 (1.0); 2.8827 (0.9); 2.7579 (0.9); 2.7255 (1.4); 2.7102 (2.2); 2.6919 (2.4); 2.6730 (1.1); 2.6247 (10.7); 2.6151 (16.0); 2.4491 (0.5); 2.3431 (0.4); 2.2684 (8.7); 2.1402 (8.4); 1.9730 (0.5); 1.2836 (2.7); 1.2647 (5.3); 1.2458 (3.0); -0.0002 (3.5)
I-015: ^1H-ЯМР(400.1 MHz, CDCl_3): δ= 7.9225 (5.3); 7.4096 (1.1); 7.3897 (2.4); 7.3700 (1.4); 7.2598 (6.1); 7.0922 (2.0); 7.0729 (1.8); 7.0068 (3.2); 6.9631 (2.4); 6.9441 (4.2); 6.9280 (1.7); 6.8899 (3.5); 6.6889 (1.9); 6.6699 (1.7); 6.2275 (2.2); 4.2385 (1.2); 4.2315 (1.3); 4.2123 (1.4); 4.2051 (1.4); 3.8488 (1.0); 3.8374 (1.0); 3.8011 (1.9); 3.7853 (1.0); 3.7747 (1.6); 3.7591 (1.1); 2.9869 (1.0); 2.9752 (1.1); 2.9529 (1.4); 2.9409 (1.3); 2.7191 (1.3); 2.6953 (1.3); 2.6855 (1.2); 2.6611 (1.1); 2.6284 (16.0); 2.6130 (1.7); 2.2616 (14.3); 2.1773 (13.8); 2.0029 (2.6); 1.7107 (0.4); 1.7013 (0.4); 1.6650 (0.3); 1.5759 (0.3); 1.5584 (1.0); 1.5418 (2.6); 1.5394 (2.6); 1.5235 (1.1); 1.5109 (1.0); 1.4917 (2.6); 1.4757 (1.1); 1.2555 (2.6); 1.2183 (0.4); 1.1161 (0.8); 1.0982 (2.8); 1.0797 (2.9); 1.0616 (0.7); 0.8810 (0.4); 0.8598 (0.8); 0.8444 (0.9); -0.0002 (6.9)
I-016: ^1H-ЯМР(300.2 MHz, CDCl_3): δ= 8.1407 (6.5); 7.3748 (1.5); 7.3484 (3.3); 7.3221 (2.0); 7.2989 (8.4); 7.0405 (2.0); 7.0141 (1.9); 7.0049 (2.9); 6.9793 (3.1); 6.9302 (3.1); 6.8757 (1.4); 6.8699 (1.7); 6.8490 (1.2); 6.8432 (1.6); 6.8067 (2.2); 6.8011 (3.1); 6.7070 (1.7); 6.6814 (1.5); 6.3114 (1.4); 5.0953 (0.8); 5.0758 (1.1); 5.0574 (0.8); 4.2957 (1.0); 4.2868 (1.4); 4.2615 (1.5); 4.2528 (1.3); 3.8920 (0.8); 3.8761 (0.9); 3.8536 (2.8); 3.8335 (0.7); 3.8197 (1.8); 3.7989 (1.1); 3.7071 (1.0); 3.6969 (1.4); 3.6823 (1.1); 3.0454 (0.9); 3.0306 (0.9); 3.0006 (1.4); 2.9845 (1.3); 2.7670 (1.1); 2.7369 (1.1); 2.7224 (1.0); 2.6912 (0.9); 2.3050 (16.0); 2.2233 (14.5); 2.0834 (1.0); 2.0006 (0.4); 1.9838 (0.7); 1.9724 (0.8); 1.9558 (1.5); 1.9392 (0.9); 1.9278 (0.9); 1.9111 (0.5); 1.6295 (2.4); 1.5981 (5.6); 1.5917 (6.3); 1.5762 (5.6); 1.5698 (6.2); 1.3213 (0.3); 1.2972 (0.7); 1.0718 (0.9); 1.0563 (2.5); 1.0498 (2.8); 1.0351 (1.5); 1.0281 (2.8); 1.0218 (2.7); 1.0072 (1.3); 0.9844 (0.3); 0.9555 (0.5); 0.9308 (0.6); 0.7817 (1.1); 0.7663 (3.2); 0.7607 (3.0); 0.7502 (2.8); 0.7443 (3.4); 0.7283 (1.1); 0.1092 (0.8); 0.0490 (0.3); 0.0383 (10.8); 0.0280 (0.7)
I-017: ^1H-ЯМР(400.1 MHz, d_6-DMSO): δ= 8.0546 (11.0); 7.5371 (1.8); 7.5255 (0.5); 7.5160 (3.9); 7.5098 (0.7); 7.5019 (0.7); 7.4951 (2.8); 7.4205 (2.4); 7.4116 (2.6); 7.4041 (2.1); 7.4017 (2.5); 7.3992 (3.2); 7.3969 (3.4); 7.3925 (3.6); 7.3873 (5.6); 7.3824 (5.5); 7.3472 (0.3); 7.3379 (0.4); 7.3127 (0.4); 7.2903 (0.5); 7.2679 (2.2); 7.2656 (2.4); 7.2624 (2.2); 7.2601 (2.0); 7.2474 (2.0); 7.2447 (2.1); 7.2422 (2.1); 7.2396 (1.8); 7.2244 (7.7); 7.2050 (4.0); 7.1779 (0.4); 7.1285 (0.3); 6.8825 (2.2); 6.8632 (2.0); 3.8214 (2.3); 3.7975 (3.5); 3.7895 (2.2); 3.7733 (2.2); 3.7632 (2.4); 3.7442 (1.4); 3.7340 (0.7); 3.3093 (23.5); 3.2638 (0.4); 2.9354 (2.6); 2.9303 (2.8); 2.9159 (3.4); 2.8970 (0.6); 2.8807 (0.4); 2.5549 (0.3); 2.5094 (6.1); 2.5050 (12.1); 2.5006 (15.8); 2.4961 (11.6); 2.4918 (5.9); 2.4550 (0.6); 2.4505 (0.6); 2.2864 (1.0); 2.2592 (0.5); 2.2268 (16.0); 2.1794 (0.5); 1.9881 (1.3); 1.2972 (0.5); 1.2793 (0.9); 1.2471 (4.4); 1.1926 (0.6); 1.1748 (0.8); 1.1570 (0.5); 0.8750 (1.8); 0.8582 (5.6); 0.8405 (2.3); 0.0078 (0.7); -0.0002 (19.2); -0.0084 (1.2)

I-018: ^1H -ЯМР(300.2 MHz, CDCl_3):

δ = 8.2822 (6.8); 7.3667 (3.9); 7.3644 (3.9); 7.3600 (4.2); 7.2983 (19.5); 7.1965 (4.6); 7.1693 (6.5); 7.1443 (3.0); 7.1180 (2.4); 7.0778 (1.7); 7.0545 (2.3); 7.0300 (1.0); 6.9602 (1.8); 6.9530 (1.8); 6.9454 (1.8); 6.9381 (1.8); 6.9330 (1.6); 6.9258 (1.5); 6.9181 (1.4); 6.9110 (1.3); 6.8891 (1.4); 6.8837 (1.3); 6.8636 (2.4); 6.8409 (1.2); 6.1421 (2.1); 6.0033 (0.4); 5.9822 (1.4); 5.9605 (1.4); 5.9388 (0.5); 5.8448 (0.4); 5.8238 (1.4); 5.8022 (1.4); 5.7798 (0.5); 4.2172 (1.7); 4.2072 (2.2); 4.1814 (2.5); 4.1716 (2.8); 4.0671 (0.8); 4.0564 (1.2); 4.0406 (1.4); 4.0271 (1.4); 4.0182 (0.9); 4.0106 (1.0); 3.9945 (2.7); 3.9788 (1.3); 3.9593 (1.7); 3.9442 (1.2); 3.2194 (1.4); 3.2029 (1.4); 3.1747 (2.2); 3.1581 (2.0); 3.0254 (1.4); 3.0177 (1.5); 2.9956 (1.3); 2.9877 (1.5); 2.9811 (1.1); 2.9729 (1.0); 2.9507 (0.9); 2.9428 (1.0); 2.1656 (0.4); 2.1481 (0.9); 2.1371 (1.1); 2.1197 (1.9); 2.1025 (1.1); 2.0916 (1.1); 2.0826 (0.7); 2.0743 (0.5); 1.8330 (4.4); 1.8265 (4.8); 1.8112 (4.6); 1.8047 (4.8); 1.7518 (4.6); 1.7453 (5.0); 1.7300 (4.4); 1.7235 (4.7); 1.5957 (16.0); 1.3431 (0.4); 1.3199 (0.7); 1.3030 (2.2); 1.2967 (2.1); 1.2727 (0.3); 1.1042 (0.9); 1.1005 (0.9); 1.0897 (3.2); 1.0829 (3.8); 1.0723 (2.1); 1.0682 (1.7); 1.0610 (3.4); 1.0546 (3.4); 1.0438 (1.2); 1.0403 (1.2); 0.9405 (0.8); 0.9186 (2.5); 0.8952 (1.0); 0.8386 (1.9); 0.8318 (1.8); 0.8234 (3.8); 0.8159 (3.7); 0.8068 (4.2); 0.7995 (2.5); 0.7898 (1.4); 0.1066 (0.5); 0.0473 (0.8); 0.0365 (24.0); 0.0274 (0.8); 0.0257 (0.9)

I-019: ^1H -ЯМР(300.2 MHz, CDCl_3):

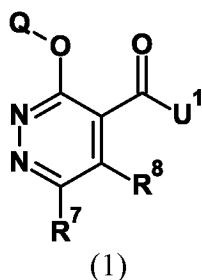
δ = 8.4010 (11.4); 8.3889 (0.5); 8.0479 (0.7); 7.7378 (0.5); 7.7151 (0.5); 7.7097 (0.5); 7.6978 (0.4); 7.6751 (0.5); 7.6701 (0.4); 7.5656 (0.3); 7.5288 (0.4); 7.5187 (0.6); 7.5087 (0.4); 7.5037 (0.5); 7.4988 (0.5); 7.4940 (0.6); 7.3739 (2.5); 7.3621 (5.6); 7.3551 (5.9); 7.3477 (5.6); 7.3212 (3.2); 7.2990 (13.3); 7.1757 (0.4); 7.1573 (4.4); 7.1300 (5.6); 7.0314 (2.9); 7.0052 (2.6); 6.9176 (3.4); 6.9105 (3.4); 6.8898 (4.7); 6.8839 (3.8); 6.8673 (1.9); 6.8621 (2.4); 6.8595 (2.3); 6.8308 (3.4); 6.8246 (4.4); 6.8180 (2.6); 6.2438 (2.4); 6.2366 (2.4); 5.5780 (5.2); 5.5703 (5.6); 4.4379 (4.6); 4.4302 (4.9); 4.2154 (0.4); 4.1941 (2.0); 4.1850 (2.2); 4.1692 (1.6); 4.1594 (2.6); 4.1497 (2.8); 4.1217 (0.5); 4.0383 (2.4); 4.0296 (1.4); 4.0152 (7.9); 3.9918 (8.2); 3.9632 (4.2); 3.9470 (1.6); 3.9274 (2.4); 3.9117 (1.8); 3.1948 (1.6); 3.1785 (1.6); 3.1502 (2.5); 3.1333 (2.3); 2.9913 (7.6); 2.9647 (2.2); 2.9491 (1.7); 2.9180 (6.5); 2.8025 (0.4); 2.6902 (0.8); 2.0817 (5.8); 1.9966 (0.5); 1.9796 (1.1); 1.9683 (1.2); 1.9517 (2.3); 1.9349 (1.4); 1.9239 (1.3); 1.9070 (0.7); 1.6816 (0.5); 1.6569 (0.5); 1.6232 (3.2); 1.4924 (7.7); 1.4692 (16.0); 1.4459 (7.5); 1.4313 (0.9); 1.4070 (0.8); 1.3820 (0.7); 1.3590 (1.2); 1.3397 (0.8); 1.3318 (0.9); 1.3196 (1.7); 1.3058 (0.8); 1.2958 (3.4); 1.2721 (1.6); 1.0614 (1.4); 1.0458 (3.7); 1.0394 (4.2); 1.0244 (2.3); 1.0176 (4.2); 1.0111 (4.0); 0.9966 (2.0); 0.9833 (1.6); 0.9732 (0.6); 0.9590 (2.6); 0.9469 (0.5); 0.9348 (1.2); 0.7756 (1.9); 0.7601 (4.9); 0.7543 (4.6); 0.7439 (4.3); 0.7379 (5.3); 0.7220 (1.7); 0.0475 (0.5); 0.0366 (16.5); 0.0259 (0.8)

I-020: ^1H-ЯМР(300.2 MHz, CDCl_3): δ= 8.4018 (0.9); 8.3947 (11.7); 8.3848 (0.6); 7.3665 (5.1); 7.3595 (5.3); 7.2985 (18.4); 7.1968 (4.3); 7.1694 (5.4); 7.1379 (2.9); 7.1095 (2.8); 7.0932 (2.0); 7.0866 (2.4); 7.0697 (2.0); 7.0643 (2.5); 7.0430 (1.1); 7.0372 (1.0); 6.9436 (3.1); 6.9364 (3.1); 6.9163 (2.6); 6.9092 (2.5); 6.8770 (1.4); 6.8707 (1.4); 6.8533 (2.2); 6.8290 (1.2); 6.8235 (1.2); 6.1253 (2.2); 6.1184 (2.2); 5.5850 (5.1); 5.5772 (5.4); 4.4469 (4.4); 4.4390 (4.7); 4.2149 (1.6); 4.2051 (2.2); 4.1793 (2.4); 4.1699 (2.5); 4.0775 (0.4); 4.0620 (0.8); 4.0513 (1.3); 4.0406 (2.9); 4.0173 (7.4); 4.0058 (1.6); 3.9943 (9.0); 3.9817 (1.8); 3.9707 (2.5); 3.9614 (2.3); 3.9461 (1.6); 3.9239 (0.4); 3.9004 (0.4); 3.2167 (1.5); 3.2006 (1.6); 3.1722 (2.4); 3.1555 (2.2); 3.0225 (2.2); 2.9930 (2.1); 2.9779 (1.6); 2.9479 (1.5); 2.1564 (0.4); 2.1387 (0.9); 2.1278 (1.0); 2.1106 (1.8); 2.0937 (1.1); 2.0824 (1.1); 2.0651 (0.5); 1.6824 (0.4); 1.6579 (0.3); 1.5950 (11.2); 1.4938 (7.5); 1.4706 (16.0); 1.4473 (7.4); 1.4208 (0.5); 1.4077 (0.5); 1.3818 (0.6); 1.3590 (1.0); 1.3413 (0.4); 1.3328 (0.8); 1.3055 (1.3); 1.0942 (0.8); 1.0904 (0.9); 1.0795 (3.0); 1.0727 (3.6); 1.0622 (2.0); 1.0580 (1.6); 1.0507 (3.3); 1.0444 (3.4); 1.0339 (1.2); 1.0300 (1.2); 1.0126 (0.4); 0.9841 (1.0); 0.9598 (1.8); 0.9357 (1.0); 0.9189 (1.2); 0.8959 (0.4); 0.8312 (1.9); 0.8244 (1.7); 0.8158 (3.6); 0.8082 (3.5); 0.7992 (4.1); 0.7921 (2.6); 0.7822 (1.4); 0.1072 (1.3); 0.0478 (0.8); 0.0369 (22.7); 0.0260 (0.9)
I-021: ^1H-ЯМР(400.1 MHz, CDCl_3): δ= 8.5842 (6.2); 7.2588 (7.3); 7.1087 (1.1); 7.0890 (2.4); 7.0690 (1.6); 6.9860 (2.9); 6.9677 (4.2); 6.9521 (2.5); 6.9320 (1.4); 6.9103 (6.6); 6.8716 (4.0); 6.8521 (1.5); 6.8334 (2.3); 6.8163 (1.2); 6.6725 (2.1); 6.6535 (1.8); 6.1647 (2.5); 4.2914 (1.4); 4.2847 (1.6); 4.2654 (1.7); 4.2590 (1.6); 3.8842 (1.1); 3.8727 (1.2); 3.8487 (2.7); 3.8334 (1.0); 3.8226 (1.8); 3.8072 (1.1); 3.0189 (1.1); 3.0075 (1.2); 2.9855 (1.5); 2.9731 (1.4); 2.7527 (1.4); 2.7293 (1.4); 2.7190 (1.3); 2.6953 (1.1); 2.2783 (16.0); 2.1385 (15.2); 2.1147 (1.2); 2.1055 (1.2); 2.0930 (1.7); 2.0803 (1.2); 2.0718 (1.1); 2.0588 (0.6); 1.5629 (6.1); 1.0509 (2.7); 1.0425 (2.4); 1.0332 (2.6); 1.0299 (2.7); 0.9991 (0.3); 0.9755 (0.3); 0.7923 (3.1); 0.7883 (3.2); 0.7806 (3.4); -0.0002 (7.8)
I-022: ^1H-ЯМР(400.1 MHz, CDCl_3): δ= 7.9169 (5.4); 7.4051 (1.1); 7.3855 (2.7); 7.3658 (2.0); 7.3237 (4.0); 7.3187 (3.9); 7.2641 (1.8); 7.2159 (3.2); 7.1214 (2.5); 7.1010 (3.0); 6.9585 (1.7); 6.9326 (3.0); 6.9278 (2.2); 6.9115 (1.7); 6.9070 (1.6); 6.2062 (2.0); 5.2956 (3.1); 4.1222 (1.2); 4.1148 (1.4); 4.0951 (1.6); 4.0877 (1.7); 3.9725 (1.0); 3.9611 (1.1); 3.9519 (1.1); 3.8991 (1.7); 3.8873 (1.3); 3.8720 (1.4); 3.8602 (1.1); 3.1348 (1.0); 3.1221 (1.1); 3.1011 (1.5); 3.0883 (1.4); 2.9517 (1.4); 2.9293 (1.4); 2.9181 (1.1); 2.8955 (1.0); 2.6369 (16.0); 1.6624 (1.1); 1.5109 (1.3); 1.4926 (5.0); 1.4785 (2.0); 1.3527 (1.8); 1.3389 (4.9); 1.3204 (1.3); 1.2558 (0.6); -0.0002 (2.1)
I-023: ^1H-ЯМР(300.2 MHz, CDCl_3): δ= 8.1446 (7.9); 7.3652 (3.8); 7.3582 (3.9); 7.2982 (13.6); 7.1937 (3.1); 7.1805 (0.9); 7.1766 (1.0); 7.1664 (4.0); 7.1538 (2.2); 7.1505 (2.1); 7.1271 (1.7); 7.1242 (1.7); 7.0840 (1.4); 7.0781 (1.5); 7.0600 (1.6); 7.0551 (1.8); 7.0335 (0.9); 7.0279 (0.8); 6.9506 (2.0); 6.9438 (2.0); 6.9234 (1.6); 6.9165 (1.6); 6.8957 (1.0); 6.8902 (1.1); 6.8690 (1.8); 6.8474 (0.9); 6.8423 (0.8); 6.1697 (1.7); 5.3366 (4.7); 5.1447 (0.4); 5.1232 (1.2); 5.1026 (1.4); 5.0844 (1.2); 5.0627 (0.4); 4.2142 (1.2); 4.2041 (1.5); 4.1784 (1.8); 4.1685 (2.0); 4.0642 (0.5); 4.0533 (0.9); 4.0378 (1.0); 4.0241 (0.9); 4.0163 (0.6); 4.0073 (0.6); 3.9978 (0.5); 3.9873 (2.2); 3.9719 (1.2); 3.9516 (1.4); 3.9360 (1.0); 3.5720 (2.0); 3.5665 (2.4); 3.5552 (2.1); 3.5498 (2.3); 3.2174 (1.2); 3.2010 (1.2); 3.1727 (1.8); 3.1559 (1.6); 3.0170 (1.6); 2.9870 (1.6); 2.9721 (1.1); 2.9419 (1.0); 2.1526 (0.7); 2.1415 (0.8); 2.1244 (1.4); 2.1073 (0.8); 2.0961 (0.8); 2.0814 (0.5); 1.6104 (16.0); 1.5935 (7.1); 1.5901 (7.5); 1.1074 (0.6); 1.1038 (0.6); 1.0927 (2.3); 1.0859 (2.7); 1.0757 (1.4); 1.0712 (1.2); 1.0641 (2.4); 1.0577 (2.4); 1.0475 (0.8); 1.0433 (0.8); 0.8420 (1.4); 0.8269 (2.7); 0.8194 (2.7); 0.8103 (3.0); 0.8029 (1.7); 0.7935 (1.0); 0.1061 (1.2); 0.0468 (0.6); 0.0360 (14.1); 0.0267 (0.5); 0.0252 (0.5)

I-025: ^1H -ЯМР(499.9 MHz, CDCl_3):

δ = 8.3209 (1.3); 7.7464 (1.5); 7.3443 (1.0); 7.2617 (3.1); 7.1937 (0.7); 7.1774 (0.8); 7.0963 (0.7); 7.0805 (0.5); 7.0194 (0.4); 7.0053 (0.6); 6.8515 (0.7); 6.8382 (1.0); 6.8247 (0.6); 5.0475 (0.5); 4.3749 (0.6); 4.3519 (0.6); 3.9664 (0.5); 3.9436 (0.4); 3.1471 (1.5); 3.1322 (1.4); 2.0860 (0.4); 2.0762 (0.5); 2.0665 (0.3); 2.0032 (16.0); 1.5598 (2.3); 1.0359 (0.4); 1.0320 (0.4); 1.0260 (1.4); 1.0221 (1.5); 1.0157 (0.6); 1.0089 (1.4); 1.0052 (1.4); 0.9993 (0.3); 0.7794 (0.5); 0.7699 (1.5); 0.7668 (1.5); 0.7600 (1.5); 0.7569 (1.3); -0.0002 (3.7)

Таблица 3: Соединения согласно формуле (1)



Прим. №	R ⁷	R ⁸	Q	U ¹	LogP
1-01	CH ₃	H	3-хлорфенил	гидроксид	1.26 ^[a]
1-02	CH ₃	H	2-фтор-3-метилфенил	гидроксид	1.32 ^[a]
1-03	CH ₃	H	3-хлор-2-фторфенил	гидроксид	1.46 ^[a]
1-04	CH ₃	H	3-хлор-2-фторфенил	изопропилокси	3.44 ^[a]
1-05	CH ₃	H	3-(1-фторциклопропил)фенил	гидроксид	0.68 ^[a]
1-06	CH ₃	H	3-(1-фторциклопропил)фенил	изопропилокси	4.73 ^[a]

Таблица 4: ^1H -ЯМР соединений формулы (1)

1-01: ^1H -ЯМР(300.2 MHz, d_6 -DMSO):

δ = 14.1043 (0.4); 14.0508 (0.4); 8.7541 (0.6); 8.5620 (0.6); 8.2596 (0.4); 7.9848 (16.0); 7.5438 (0.4); 7.5176 (3.6); 7.5091 (1.0); 7.4972 (1.3); 7.4897 (7.7); 7.4778 (1.0); 7.4740 (1.1); 7.4617 (6.0); 7.4239 (0.4); 7.3988 (0.4); 7.3547 (10.2); 7.3480 (8.6); 7.3410 (4.9); 7.3345 (3.9); 7.3313 (3.8); 7.2031 (3.6); 7.1995 (3.9); 7.1960 (3.6); 7.1925 (3.1); 7.1758 (3.2); 7.1727 (3.0); 7.1683 (3.1); 7.1652 (2.6); 5.7796 (2.9); 4.0604 (0.4); 4.0367 (0.4); 3.3924 (0.8); 2.6431 (42.4); 2.5769 (0.4); 2.5342 (8.6); 2.5283 (17.5); 2.5223 (23.4); 2.5163 (16.6); 2.5106 (7.6); 2.0093 (1.8); 1.9291 (3.0); 1.2535 (0.6); 1.2179 (0.6); 1.1941 (1.1); 1.1704 (0.5); 0.0680 (0.8); 0.0302 (0.9); 0.0195 (20.5); 0.0085 (0.7); -0.0443 (2.0)

1-02: ^1H -ЯМР(500.1 MHz, d_6 -DMSO):

δ = 8.2519 (0.3); 7.9589 (0.7); 7.5092 (7.7); 7.4116 (1.5); 7.1690 (1.0); 7.1563 (2.2); 7.1445 (1.9); 7.1337 (2.5); 7.1179 (4.9); 7.1028 (4.5); 7.0977 (2.2); 7.0863 (2.3); 7.0717 (1.0); 3.1743 (4.7); 2.8938 (4.0); 2.7356 (3.6); 2.5133 (28.0); 2.2704 (16.0)

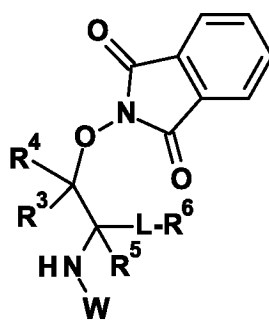
1-03: ^1H -ЯМР(300.2 MHz, d_6 -DMSO):

δ = 8.0097 (16.0); 7.9655 (0.4); 7.5896 (2.0); 7.5839 (2.2); 7.5674 (2.2); 7.5622 (4.0); 7.5570 (2.9); 7.5410 (2.5); 7.5349 (2.6); 7.4546 (1.7); 7.4489 (1.8); 7.4316 (1.8); 7.4268 (4.3); 7.4214 (2.9); 7.4042 (3.6); 7.3981 (2.8); 7.3687 (3.9); 7.3642 (3.6); 7.3419 (4.2); 7.3370 (4.5); 7.3147 (1.6); 7.3096 (1.7); 3.3531 (2.9); 2.6342 (42.4); 2.5345 (5.6); 2.5285 (12.2); 2.5224 (16.9); 2.5163 (12.2); 2.5103 (5.7); 2.2979 (0.5); 2.2918 (0.5); 2.0090 (1.3); 1.2179 (0.4); 1.1942 (0.7); 1.1704 (0.3); 0.0191 (8.3)

1-04: ^1H -ЯМР(499.9 MHz, CDCl_3):

δ = 7.7348 (5.0); 7.3033 (0.7); 7.3005 (0.8); 7.2873 (1.5); 7.2843 (1.2); 7.2743 (0.9); 7.2714 (1.0); 7.2638 (2.0); 7.2379 (0.7); 7.2350 (0.8); 7.2214 (1.6); 7.2189 (1.2); 7.2080 (0.9); 7.2051 (1.0); 7.1317 (1.0); 7.1286 (1.1); 7.1153 (1.5); 7.1122 (1.7); 7.0989 (0.6); 7.0958 (0.7); 5.3387 (0.4); 5.3263 (1.1); 5.3137 (1.5); 5.3012 (1.2); 5.2887 (0.5); 2.7076 (15.4); 1.6075 (3.7); 1.4053 (16.0); 1.3927 (16.0); -0.0002 (1.9)

Таблица 5: Соединения согласно формуле (2)



(2)

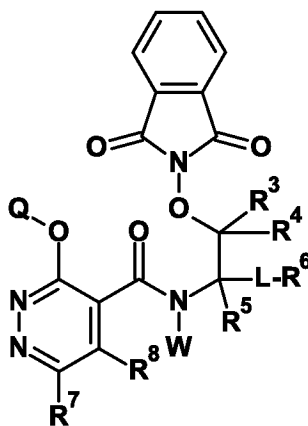
Прим. №	W	R ³	R ⁴	R ⁵	L-R ⁶	LogP	Salt
2-01	H	H	H	H	(2,4-диметилфенил)метил	1.55[a]	TFA

Таблица 6: ^1H -ЯМР соединений формулы (2)

2-01: ^1H -ЯМР(300.1 MHz, d_6 -DMSO):

δ = 8.4567 (2.3); 7.8866 (16.0); 7.1956 (1.5); 7.1703 (1.8); 6.9824 (2.5); 6.9715 (1.6); 6.9447 (1.0); 4.3276 (0.5); 4.3060 (0.6); 4.2909 (1.0); 4.2697 (1.0); 4.2311 (1.0); 4.2196 (1.1); 4.1945 (0.6); 4.1830 (0.5); 3.7230 (0.6); 3.7140 (0.6); 3.0236 (0.4); 2.9970 (1.1); 2.9786 (1.7); 2.9487 (0.9); 2.9341 (0.3); 2.5156 (1.9); 2.5101 (2.4); 2.5047 (1.8); 2.3112 (0.3); 2.2747 (8.8); 2.2526 (0.6); 2.2218 (8.4)

Таблица 7: Соединения согласно формуле (3)



(3)

Прим. №	R ⁷	R ₈	Q	W	R ₃	R ₄	R ₅	L-R ⁶	LogP
3-01	CH ₃	H	3-хлорфенил	H	H	H	H	(2,4-диметилфенил)метил	4.47 ^[a] ₁
3-02	Cl	H	3-циклопропил-2-фторфенил	H	H	H	H	(2,4-дихлорфенил)метил	5.27 ^[a] ₁

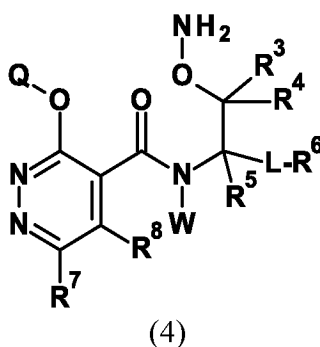
Таблица 8: ¹H-ЯМР соединений формулы (3)

3-01: ¹H-ЯМР(500.1 MHz, CDCl₃):
 δ = 8.3674 (1.2); 8.3519 (1.2); 8.0357 (5.7); 7.7981 (2.3); 7.7918 (2.8); 7.7868 (2.8); 7.7809 (4.4); 7.7728 (0.8); 7.7569 (0.8); 7.7488 (4.4); 7.7424 (2.8); 7.7380 (2.8); 7.7316 (2.3); 7.3786 (1.3); 7.3624 (3.1); 7.3462 (2.0); 7.3315 (1.7); 7.3275 (3.1); 7.3235 (1.9); 7.2596 (12.1); 7.2475 (1.4); 7.2457 (1.3); 7.2118 (2.6); 7.2089 (2.1); 7.2039 (1.8); 7.1966 (2.8); 7.1923 (1.6); 7.1877 (1.3); 6.9640 (2.9); 6.9095 (1.6); 6.8942 (1.4); 4.6363 (0.3); 4.6276 (0.5); 4.6204 (0.8); 4.6131 (0.8); 4.6056 (0.8); 4.5984 (0.5); 4.5901 (0.3); 4.4433 (1.2); 4.4363 (1.2); 4.4238 (1.6); 4.4168 (1.4); 4.2871 (1.5); 4.2800 (1.5); 4.2676 (1.2); 4.2605 (1.2); 3.2264 (0.6); 3.2124 (0.6); 3.1986 (1.5); 3.1846 (1.4); 3.1645 (1.5); 3.1477 (1.5); 3.1366 (0.7); 3.1198 (0.6); 2.9547 (0.5); 2.8829 (0.5); 2.8029 (4.3); 2.6905 (16.0); 2.6805 (0.5); 2.4032 (13.8); 2.2661 (13.1); 2.0433 (1.0); 1.5631 (10.9); 1.2728 (0.4); 1.2586 (0.7); 0.0700 (0.9); -0.0002 (13.6)

3-02: ^1H -ЯМР(300.2 MHz, CDCl_3):

δ = 8.2882 (0.6); 8.2649 (0.6); 8.1812 (3.9); 8.0476 (2.0); 7.8425 (0.8); 7.8332 (0.7); 7.8289 (1.0); 7.8269 (1.0); 7.8209 (1.4); 7.8125 (3.0); 7.8010 (1.6); 7.7965 (3.0); 7.7885 (1.2); 7.7826 (1.1); 7.7803 (1.0); 7.7762 (0.8); 7.7668 (0.9); 7.4359 (1.3); 7.4084 (1.6); 7.3620 (1.6); 7.3550 (2.0); 7.2988 (4.0); 7.2537 (0.4); 7.2319 (0.8); 7.2270 (0.6); 7.2094 (0.6); 7.2035 (0.6); 7.1831 (1.0); 7.1759 (1.0); 7.1712 (0.8); 7.1557 (0.9); 7.1481 (1.1); 7.1455 (1.1); 7.1416 (1.0); 7.1181 (0.4); 7.1147 (0.4); 6.8993 (0.4); 6.8941 (0.4); 6.8724 (0.7); 6.8515 (0.4); 6.8461 (0.3); 4.8259 (0.4); 4.8135 (0.4); 4.8006 (0.4); 4.5072 (0.5); 4.4945 (0.5); 4.4735 (0.9); 4.4608 (0.8); 4.3952 (0.8); 4.3819 (0.8); 4.3614 (0.6); 4.3481 (0.5); 4.1627 (0.4); 4.1389 (0.4); 3.3866 (1.1); 3.3813 (1.2); 3.3586 (1.5); 3.2112 (0.4); 3.1977 (0.5); 3.1861 (0.4); 3.1774 (0.4); 2.9930 (16.0); 2.9323 (2.8); 2.9124 (13.7); 2.8318 (9.5); 2.1349 (0.6); 2.1178 (0.3); 2.0755 (1.6); 1.5209 (1.1); 1.4953 (4.5); 1.4714 (4.2); 1.4566 (3.4); 1.4345 (3.2); 1.3132 (0.4); 1.2894 (0.9); 1.2656 (0.4); 1.0916 (0.4); 1.0771 (1.0); 1.0704 (1.1); 1.0564 (0.6); 1.0485 (1.0); 1.0420 (1.0); 1.0281 (0.5); 0.8334 (0.5); 0.8192 (1.1); 0.8154 (1.2); 0.8121 (1.0); 0.8021 (1.1); 0.7980 (1.1); 0.7811 (0.4); 0.0297 (4.3)

Таблица 9: Соединения согласно формуле (4)



Прим. №	R ⁷	R ₈	Q	W	R ₃	R ₄	R ₅	L-R ⁶	LogP
4-01	CH ₃	H	3-хлорфенил	H	H	H	H	(2,4-диметилфенил)метил	2.64 ^[a]
4-02	Cl	H	3-циклопропил-2-фторфенил	H	H	H	H	(2,4-дихлорфенил)метил	3.70 ^[a]

Таблица 10: ^1H -ЯМР соединений формулы (4):

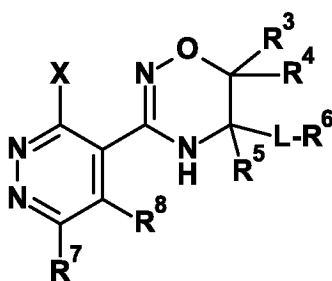
4-01: ^1H -ЯМР(500.1 MHz, CDCl_3):

δ = 8.3399 (0.8); 8.3240 (0.8); 8.1040 (5.4); 7.3949 (1.2); 7.3787 (2.9); 7.3624 (1.9); 7.2932 (1.4); 7.2913 (1.5); 7.2770 (1.0); 7.2752 (1.1); 7.2597 (7.5); 7.1926 (1.6); 7.1884 (2.8); 7.1843 (1.6); 7.1026 (1.3); 7.0995 (1.2); 7.0863 (1.1); 7.0832 (1.1); 7.0288 (2.0); 7.0134 (2.3); 6.9369 (2.5); 6.8537 (1.4); 6.8385 (1.1); 5.5311 (1.5); 4.6180 (0.4); 4.6114 (0.5); 4.6075 (0.6); 4.6017 (0.7); 4.5960 (0.6); 4.5921 (0.5); 4.5855 (0.5); 4.1425 (0.4); 4.1282 (1.0); 4.1139 (1.1); 4.0996 (0.4); 3.8140 (1.0); 3.8072 (1.0); 3.7914 (1.6); 3.7846 (1.5); 3.7200 (1.5); 3.7090 (1.5); 3.6974 (1.0); 3.6864 (1.0); 2.9461 (3.8); 2.9315 (3.6); 2.8026 (0.7); 2.7038 (16.0); 2.3597 (12.6); 2.2491 (12.0); 2.0430 (4.6); 2.0031 (2.2); 1.5836 (0.8); 1.2726 (1.2); 1.2583 (2.5); 1.2440 (1.2); 0.0700 (4.1); -0.0002 (8.7); -0.0067 (0.4)

4-02: ^1H -ЯМР(300.2 MHz, CDCl_3):

δ = 8.3607 (0.6); 8.3339 (0.6); 8.2413 (4.7); 7.3657 (2.0); 7.3587 (2.1); 7.2985 (9.4); 7.2711 (1.5); 7.2436 (2.4); 7.1883 (0.4); 7.1592 (2.5); 7.1518 (1.7); 7.1468 (1.3); 7.1374 (3.1); 7.1316 (1.4); 7.1247 (1.7); 7.1186 (1.2); 7.0981 (0.4); 6.9112 (0.5); 6.9009 (0.5); 6.8891 (0.9); 6.8815 (0.8); 6.8641 (0.5); 6.8574 (0.4); 5.5942 (1.7); 5.3371 (1.6); 4.8163 (0.3); 4.8091 (0.4); 4.7986 (0.5); 4.7874 (0.4); 4.7817 (0.3); 4.2616 (0.4); 4.2379 (0.4); 4.1704 (0.4); 4.1466 (0.4); 3.9275 (0.7); 3.9160 (0.7); 3.8893 (1.3); 3.8778 (1.2); 3.8004 (1.2); 3.7816 (1.1); 3.7622 (0.7); 3.7434 (0.7); 3.1370 (2.8); 3.1125 (2.4); 2.9937 (1.2); 2.9208 (1.0); 2.8401 (16.0); 2.1734 (0.4); 2.1626 (0.4); 2.1455 (0.8); 2.1281 (0.5); 2.1171 (0.4); 2.0825 (1.6); 1.3419 (0.5); 1.3184 (1.2); 1.2959 (1.2); 1.2726 (0.4); 1.1190 (0.5); 1.1041 (1.3); 1.0972 (1.5); 1.0826 (0.9); 1.0755 (1.4); 1.0690 (1.5); 1.0544 (0.7); 0.8485 (0.7); 0.8335 (1.7); 0.8277 (1.6); 0.8166 (1.6); 0.8110 (1.8); 0.7948 (0.6); 0.1063 (0.8); 0.0473 (0.5); 0.0365 (11.8); 0.0256 (0.6)

Таблица 11: Соединения согласно формуле (7)



(7)

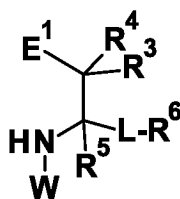
Прим. №	R ⁷	R ⁸	X	R ⁹	R ₃	R ₄	R ⁵	L-R ⁶	LogP
7-01	Cl	H	C 1	H	H	H	H	(2,4- дихлорфенил)метил	3.17[a]

Таблица 12: ^1H -ЯМР соединений формулы (7):

7-01: ^1H -ЯМР(300.1 MHz, d_6 -DMSO):

δ = 8.2197 (16.0); 7.6184 (6.6); 7.6119 (7.2); 7.5499 (3.6); 7.5392 (3.7); 7.4737 (3.0); 7.4462 (8.5); 7.4229 (6.0); 7.4162 (5.5); 7.3954 (2.2); 7.3887 (2.2); 5.7586 (1.1); 3.8657 (3.5); 3.8339 (5.2); 3.8233 (3.3); 3.8069 (3.5); 3.7936 (3.4); 3.7680 (1.6); 3.7551 (0.8); 3.4504 (0.3); 3.4426 (0.3); 3.0545 (0.7); 3.0309 (0.7); 3.0099 (3.4); 2.9929 (4.5); 2.9860 (4.2); 2.9733 (3.6); 2.9491 (0.7); 2.9271 (0.5); 2.5127 (5.5); 2.5070 (6.9); 2.5014 (5.0); 1.9933 (0.8); 1.2849 (0.5); 1.2299 (0.5); 1.1782 (0.5); 0.9138 (0.5); 0.8885 (0.3); 0.8776 (0.6); 0.8621 (0.5); 0.8544 (0.6); 0.8323 (0.4); -0.0004 (0.9)

Таблица 13: Соединения согласно формуле (13)



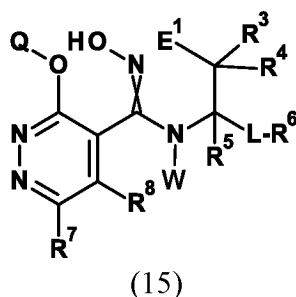
(13)

Прим. №	W	E ¹	R ³	R ⁴	R ⁵	L-R ⁶	LogP	Sal t
13-01	H	Cl	H	H	H	(2-бром-4-метилфенил)метил	1.23[a]	HC l
13-02	H	Cl	H	H	H	(3,5-диметилфенил)метил	1.32[a]	HC l
13-03	H	Cl	H	H	H	(2,5-диметилфенил)метил	1.13[a]	HC l
13-04	H	Cl	H	H	H	(2,4-диметилфенил)метил	1.24[a]	HC l

Таблица 14: ¹H-ЯМР соединений формулы (13):

13-01: ¹ H-ЯМР(300.2 MHz, CDCl ₃): δ = 8.9628 (1.0); 7.4374 (1.8); 7.3198 (1.3); 7.2993 (6.0); 7.2946 (2.1); 7.1333 (1.0); 7.1104 (0.8); 4.0085 (0.4); 3.9705 (0.7); 3.9301 (0.8); 3.9194 (0.6); 3.7796 (0.7); 3.7622 (0.8); 3.7563 (0.5); 3.7548 (0.5); 3.7534 (0.5); 3.7518 (0.5); 3.7427 (16.0); 3.7307 (0.3); 3.7219 (0.5); 3.5169 (0.4); 3.4989 (0.4); 3.4709 (0.6); 3.4532 (0.5); 3.3356 (0.6); 3.3039 (0.6); 3.2899 (0.4); 3.2582 (0.4); 2.3388 (7.4); 1.7299 (1.1); 0.1070 (2.0); 0.0483 (0.3); 0.0375 (8.3)
13-03: ¹ H-ЯМР(500.1 MHz, CDCl ₃): δ = 7.2586 (11.8); 7.0631 (2.1); 7.0477 (3.1); 6.9834 (2.3); 6.9678 (1.7); 6.9473 (3.5); 5.2303 (0.4); 5.2218 (0.4); 5.2158 (1.0); 5.2073 (1.0); 5.2016 (1.0); 5.1931 (1.0); 5.1877 (0.5); 5.1791 (0.4); 3.8822 (0.6); 3.8724 (0.8); 3.8617 (0.7); 3.8000 (4.4); 3.7884 (9.8); 3.7766 (6.8); 3.7631 (1.7); 3.7553 (0.9); 3.7134 (0.4); 3.7026 (1.4); 3.6972 (1.6); 3.6886 (2.2); 3.6752 (2.8); 3.6666 (3.0); 3.6554 (6.6); 3.6438 (10.7); 3.6323 (5.1); 3.6036 (2.2); 3.5893 (2.2); 3.5814 (1.5); 3.5671 (1.4); 3.0912 (1.4); 3.0783 (1.4); 3.0638 (1.7); 3.0509 (1.7); 2.8551 (1.7); 2.8394 (1.7); 2.8278 (1.4); 2.8120 (1.4); 2.3652 (0.5); 2.3260 (16.0); 2.2951 (15.3); 2.2788 (1.1); 2.2619 (0.6); 2.2528 (0.7); 2.1532 (0.3); 1.2549 (0.9); 1.2440 (0.3); -0.0002 (15.5)
13-04: ¹ H-ЯМР(300.2 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 8.4858 (2.3); 7.1257 (1.9); 7.1002 (3.0); 7.0402 (2.9); 7.0136 (1.9); 6.9880 (1.2); 3.8728 (0.9); 3.8632 (1.1); 3.8332 (1.3); 3.8236 (1.4); 3.7154 (0.6); 3.6507 (1.7); 3.6368 (1.2); 3.6109 (1.2); 3.5969 (1.0); 3.5869 (1.9); 3.3748 (16.0); 3.0446 (0.6); 3.0272 (0.6); 2.9985 (1.2); 2.9810 (1.1); 2.9216 (1.3); 2.8901 (1.2); 2.8757 (0.7); 2.8435 (0.7); 2.5338 (2.8); 2.5279 (5.8); 2.5219 (7.9); 2.5159 (5.7); 2.5101 (2.7); 2.2971 (14.1); 2.2643 (12.9); 0.0190 (8.6); 0.0082 (0.3)

Таблица 15: Соединения согласно формуле (15)



Прим. №	R ⁷	R ₈	Q	W	E ₁	R ₃	R ₄	R ₅	L-R ⁶	LogP
15-01	CH ₃	H	3-хлорфенил	H	Cl	H	H	H	(2-бром-4-метилфенил)метил	3.84 ^{la} _l
15-02	CH ₃	H	2-фтор-3-метилфенил	H	Cl	H	H	H	(2-хлор-4-метилфенил)метил	3.75 ^{la} _l
15-03	CH ₃	H	3-хлорфенил	H	Cl	H	H	H	(2-хлор-4-метилфенил)метил	3.78 ^{la} _l
15-04	CH ₃	H	3-хлор-2-фторфенил	H	Cl	H	H	H	(3,5-диметилфенил)-метил	3.98 ^{la} _l
15-05	CH ₃	H	3-хлор-2-фторфенил	H	Cl	H	H	H	(2,5-диметилфенил)-метил	3.84 ^{la} _l
15-06	CH ₃	H	2-фтор-3-метилфенил	H	Cl	H	H	H	(2,5-диметилфенил)-метил	3.74 ^{la} _l
15-07	CH ₃	H	3-хлорфенил	H	Cl	H	H	H	(2,5-диметилфенил)-метил	3.74 ^{la} _l
15-08	CHCl ₂	H	3-циклопропил-2-фторфенил	H	Cl	H	H	H	(2,4-диметилфенил)-метил	
15-09	Cl	H	3-хлорфенил	H	Cl	H	H	H	(2-хлор-4-метилфенил)метил	

Таблица 16: ¹H-ЯМР соединений формулы (15):

15-01: ¹H-ЯМР(500.1 MHz, CDCl₃): δ= 8.0597 (0.4); 7.3971 (0.5); 7.3864 (0.9); 7.3782 (0.4); 7.3758 (0.4); 7.3619 (0.4); 7.3475 (0.3); 7.3309 (0.4); 7.3238 (1.5); 7.3076 (3.2); 7.2914 (2.1); 7.2598 (12.9); 7.2492 (2.9); 7.2382 (0.4); 7.2345 (0.4); 7.2302 (0.4); 7.2094 (1.4); 7.2076 (1.5); 7.2056 (1.6); 7.2042 (1.4); 7.1934 (1.1); 7.1897 (1.6); 7.1793 (2.2); 7.1751 (3.1); 7.1710 (1.6); 7.1509 (0.5); 7.1358 (0.8); 7.1245 (1.7); 7.1090 (3.7); 7.0909 (2.2); 7.0757 (1.1); 7.0646 (1.8); 7.0630 (1.7); 7.0600 (1.5); 7.0482 (1.6); 7.0436 (1.2); 7.0421 (1.0); 6.4126 (1.3); 5.7535 (1.0); 5.7319 (1.0); 4.5949 (0.8); 4.1435 (0.3); 4.1292 (1.1); 4.1150 (1.1); 4.1007 (0.4); 3.7828 (0.3); 3.7739 (0.4); 3.7562 (1.4); 3.7520 (1.4); 3.7426 (0.7); 3.7354 (2.3); 3.7268 (1.2); 3.6890 (1.0); 3.6834 (1.5); 3.6681 (1.1); 3.6614 (0.6); 3.6437 (0.4); 3.6368 (0.4); 3.0887 (0.8); 3.0804 (0.9); 3.0615 (1.1); 3.0528 (1.1); 2.8598 (0.9); 2.8419 (1.0); 2.8326 (1.0); 2.8143 (0.8); 2.7016 (1.3); 2.5296 (16.0); 2.5208 (0.6); 2.5120 (0.6); 2.3636 (0.3); 2.3544 (0.9); 2.3446 (12.0); 2.3180 (0.7); 2.3031 (2.4); 2.2929 (0.5); 2.2788 (0.4); 2.2673 (1.1); 2.2416 (0.4); 2.0441 (4.7); 1.8769 (0.6); 1.2728 (1.3); 1.2586 (2.7); 1.2443 (1.5); 0.0696 (2.4); 0.0064 (0.6); -0.0002 (15.5); -0.0069 (0.6); -0.0090 (0.4)
15-02: ¹H-ЯМР(500.1 MHz, CDCl₃): δ= 7.2594 (13.7); 7.1125 (2.1); 7.0971 (3.0); 7.0761 (0.4); 7.0702 (0.6); 7.0578 (3.9); 7.0478 (2.3); 7.0325 (4.8); 7.0241 (1.7); 7.0186 (3.7); 7.0114 (1.2); 7.0069 (0.9); 6.9966 (0.4); 6.3482 (1.6); 5.7968 (1.0); 5.7750 (1.0); 4.1435 (0.5); 4.1292 (1.5); 4.1149 (1.6); 4.1006 (0.5); 3.8762 (0.7); 3.8691 (1.4); 3.8518 (1.8); 3.8486 (1.8); 3.8385 (0.5); 3.8333 (0.4); 3.8247 (0.4); 3.7480 (0.8); 3.7426 (1.4); 3.7262 (1.1); 3.0555 (0.8); 3.0472 (0.8); 3.0280 (1.1); 3.0201 (1.0); 2.9107 (1.0); 2.8924 (1.0); 2.8835 (0.7); 2.8652 (0.6); 2.4991 (16.0); 2.3531 (12.3); 2.2933 (7.8); 2.2897 (8.0); 2.1724 (0.4); 2.0441 (6.7); 1.5794 (0.5); 1.2730 (1.8); 1.2587 (3.6); 1.2444 (1.7); 0.0061 (0.7); -0.0002 (18.2); -0.0064 (0.9)

15-03: ^1H -ЯМР(500.1 MHz, CDCl_3):

δ = 7.3239 (1.4); 7.3077 (3.2); 7.2915 (2.1); 7.2596 (8.4); 7.2065 (1.6); 7.1905 (1.3); 7.1718 (1.9); 7.1676 (3.0); 7.1635 (1.6); 7.1038 (2.0); 7.0885 (3.1); 7.0566 (4.2); 7.0362 (2.9); 7.0211 (1.2); 6.4795 (1.3); 5.7385 (1.0); 5.7173 (1.0); 5.2976 (10.5); 4.1293 (0.3); 4.1150 (0.4); 3.7396 (0.6); 3.7313 (1.4); 3.7254 (0.5); 3.7197 (1.0); 3.7121 (2.2); 3.6982 (0.6); 3.6903 (0.5); 3.6814 (0.5); 3.6712 (1.1); 3.6658 (1.2); 3.6510 (1.0); 3.0933 (0.8); 3.0845 (0.8); 3.0659 (1.1); 3.0572 (1.0); 2.8563 (0.9); 2.8389 (0.9); 2.8290 (0.8); 2.8118 (0.7); 2.5375 (16.0); 2.3419 (12.3); 2.3194 (0.3); 2.0442 (1.5); 1.2728 (0.6); 1.2653 (0.5); 1.2586 (1.1); 1.2545 (0.5); 1.2443 (0.5); 1.2404 (0.5); 0.8955 (0.4); 0.8820 (0.9); 0.8677 (0.4); -0.0002 (10.6); -0.0068 (0.5)

15-04: ^1H -ЯМР(500.1 MHz, CDCl_3):

δ = 7.3153 (0.4); 7.3114 (0.4); 7.3000 (0.6); 7.2961 (0.8); 7.2888 (0.4); 7.2828 (0.5); 7.2596 (10.1); 7.1650 (0.4); 7.1551 (0.8); 7.1487 (0.5); 7.1445 (0.4); 7.1413 (0.5); 7.1321 (0.9); 7.1282 (0.8); 7.1206 (2.0); 7.1158 (0.8); 7.1053 (1.0); 7.0883 (0.3); 6.8983 (1.4); 6.8759 (1.2); 6.7141 (0.8); 6.6754 (2.8); 6.6473 (0.4); 6.4919 (0.4); 5.7184 (0.7); 5.7045 (0.4); 5.6963 (0.7); 4.5949 (0.5); 3.7634 (0.4); 3.7156 (0.5); 3.7066 (0.6); 3.6833 (1.4); 3.6773 (0.7); 3.6619 (0.4); 3.6555 (0.6); 3.6474 (0.5); 3.6443 (0.4); 3.6357 (0.6); 3.5725 (0.3); 3.5568 (0.3); 3.5494 (0.4); 3.5432 (0.4); 3.5351 (0.4); 3.5266 (0.3); 2.8528 (0.6); 2.8395 (0.7); 2.8280 (0.4); 2.8117 (1.2); 2.8082 (1.2); 2.8018 (1.0); 2.7918 (0.9); 2.5065 (7.1); 2.3111 (0.7); 2.2921 (0.4); 2.2780 (0.3); 2.2517 (16.0); 2.2372 (1.5); 2.2260 (0.7); 2.2179 (0.6); 2.1191 (1.0); 2.0900 (0.9); 2.0449 (0.9); 1.9770 (3.2); 1.8593 (5.1); 1.2587 (0.7); 1.2548 (0.6); 1.2447 (0.3); 0.0695 (2.6); -0.0002 (11.9); -0.0060 (0.9)

15-05: ^1H -ЯМР(500.1 MHz, CDCl_3):

δ = 7.4130 (0.4); 7.3996 (0.8); 7.3865 (1.5); 7.3761 (1.0); 7.3623 (1.6); 7.3500 (0.9); 7.3468 (1.0); 7.3376 (0.7); 7.3328 (0.7); 7.3250 (0.6); 7.3192 (0.7); 7.3140 (1.0); 7.3086 (1.1); 7.3003 (1.5); 7.2915 (1.4); 7.2813 (1.2); 7.2717 (0.7); 7.2592 (23.9); 7.2207 (0.5); 7.2027 (0.4); 7.1942 (0.9); 7.1860 (0.7); 7.1796 (1.1); 7.1726 (0.5); 7.1628 (0.7); 7.1551 (0.7); 7.1482 (1.3); 7.1408 (0.8); 7.1351 (1.1); 7.1299 (0.9); 7.1136 (3.8); 7.1027 (3.9); 7.0857 (0.8); 7.0014 (1.3); 6.9859 (2.5); 6.9782 (1.0); 6.9531 (3.1); 6.9376 (1.8); 6.9295 (0.9); 6.8426 (2.9); 6.8315 (0.4); 6.8228 (0.4); 6.8163 (0.4); 6.7607 (0.5); 6.7428 (0.6); 6.7145 (0.4); 6.2061 (1.5); 5.7549 (1.4); 5.7330 (1.5); 5.7128 (0.3); 4.5950 (3.1); 4.5654 (0.5); 4.1295 (0.7); 4.1152 (0.7); 4.0892 (0.3); 3.9876 (0.3); 3.9414 (0.4); 3.8368 (0.6); 3.8278 (0.7); 3.8150 (1.6); 3.8061 (1.7); 3.7894 (2.1); 3.7835 (1.9); 3.7771 (0.8); 3.7680 (1.0); 3.7627 (1.2); 3.7509 (0.6); 3.7415 (0.6); 3.7140 (0.9); 3.7072 (0.7); 3.6917 (0.5); 3.6832 (0.9); 3.6556 (0.5); 3.6438 (0.7); 3.6354 (0.9); 3.6282 (0.5); 3.6230 (0.6); 3.6140 (0.8); 3.6069 (0.8); 3.5933 (0.6); 3.5860 (0.5); 2.9178 (0.8); 2.9107 (0.9); 2.8903 (1.6); 2.8831 (1.5); 2.8360 (1.6); 2.8161 (1.5); 2.8086 (0.9); 2.7888 (1.1); 2.7715 (0.4); 2.4719 (16.0); 2.3551 (0.3); 2.3413 (0.4); 2.3109 (0.9); 2.2984 (0.6); 2.2837 (2.7); 2.2663 (1.2); 2.2525 (12.5); 2.2421 (1.2); 2.1153 (1.7); 2.0444 (3.3); 2.0356 (1.8); 2.0192 (1.9); 1.9950 (12.8); 1.9857 (5.5); 1.9638 (3.0); 1.8592 (8.7); 1.2731 (0.9); 1.2586 (2.3); 1.2445 (1.0); 0.0695 (2.1); 0.0062 (0.5); -0.0002 (29.3)

15-06: ^1H -ЯМР(500.1 MHz, CDCl_3):

δ = 7.3993 (0.6); 7.3843 (1.0); 7.3756 (0.6); 7.3619 (1.0); 7.3466 (0.5); 7.3325 (0.4); 7.3187 (0.4); 7.2689 (0.4); 7.2584 (14.3); 7.2384 (0.4); 7.2119 (0.6); 7.1810 (0.7); 7.1673 (0.5); 7.1552 (0.5); 7.1186 (0.4); 7.1047 (0.6); 7.0939 (0.6); 7.0854 (0.9); 7.0804 (0.8); 7.0753 (0.8); 7.0692 (1.2); 7.0615 (1.4); 7.0513 (2.7); 7.0360 (3.5); 7.0217 (2.7); 7.0090 (1.4); 7.0027 (1.5); 6.9966 (1.4); 6.9830 (2.0); 6.9766 (1.2); 6.9608 (0.5); 6.9478 (2.8); 6.9323 (2.2); 6.8467 (2.5); 6.8432 (2.8); 6.7138 (0.4); 6.2018 (1.4); 5.7486 (1.2); 5.7263 (1.3); 5.7097 (0.4); 4.5943 (2.7); 4.1435 (0.6); 4.1292 (2.0); 4.1150 (2.0); 4.1007 (0.7); 3.8503 (0.7); 3.8413 (0.8); 3.8285 (1.4); 3.8195 (1.5); 3.7996 (0.5); 3.7846 (1.6); 3.7783 (1.8); 3.7627 (1.2); 3.7573 (1.2); 3.7106 (0.4); 3.7044 (0.4); 3.6824 (1.1); 3.6653 (0.8); 3.6553 (1.0); 3.6436 (1.2); 3.6354 (0.7); 3.6321 (0.6); 2.9973 (0.3); 2.9196 (0.8); 2.9123 (0.9); 2.8921 (1.4); 2.8848 (1.4); 2.8324 (1.4); 2.8125 (1.3); 2.8049 (0.9); 2.7853 (1.0); 2.7693 (0.4); 2.4634 (16.0); 2.3546 (2.0); 2.3335 (0.5); 2.3108 (1.4); 2.2992 (9.1); 2.2954 (8.8); 2.2838 (3.3); 2.2669 (1.5); 2.2521 (11.9); 2.2422 (1.0); 2.2224 (0.4); 2.0441 (8.6); 2.0196 (0.3); 2.0129 (0.4); 2.0027 (0.4); 1.9882 (11.8); 1.9720 (1.0); 1.9528 (3.0); 1.8847 (0.4); 1.8703 (0.3); 1.2728 (2.2); 1.2585 (4.8); 1.2442 (2.3); 0.0698 (1.9); 0.0061 (0.4); -0.0002 (17.6); -0.0065 (0.9)

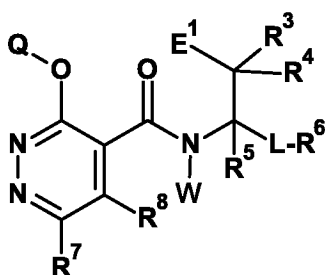
15-07: ^1H -ЯМР(500.1 MHz, CDCl_3):

δ = 7.3994 (0.5); 7.3845 (0.7); 7.3780 (0.5); 7.3627 (0.9); 7.3483 (0.9); 7.3325 (0.8); 7.3248 (1.5); 7.3193 (0.5); 7.3086 (3.3); 7.2923 (2.1); 7.2792 (0.4); 7.2589 (12.6); 7.2221 (0.3); 7.2176 (0.4); 7.2085 (1.8); 7.2071 (1.8); 7.1907 (1.7); 7.1859 (0.9); 7.1817 (0.6); 7.1740 (0.3); 7.1623 (2.0); 7.1581 (3.3); 7.1541 (1.9); 7.1149 (0.4); 7.0987 (0.4); 7.0856 (0.4); 7.0818 (0.4); 7.0698 (0.4); 7.0653 (0.4); 7.0536 (0.5); 7.0433 (1.7); 7.0389 (1.6); 7.0269 (1.5); 7.0226 (1.4); 7.0075 (1.0); 6.9950 (2.9); 6.9743 (3.4); 6.9588 (1.5); 6.9140 (0.6); 6.8693 (1.3); 6.8272 (3.0); 6.2632 (1.2); 5.6531 (1.4); 5.6307 (1.5); 4.5946 (1.6); 4.1438 (0.3); 4.1295 (1.0); 4.1153 (1.0); 4.1010 (0.4); 3.7884 (0.7); 3.7764 (0.6); 3.7629 (0.5); 3.7512 (0.4); 3.7464 (0.5); 3.7324 (2.0); 3.7255 (3.5); 3.7156 (2.3); 3.7049 (0.6); 3.6940 (0.6); 3.6834 (1.4); 3.6748 (0.9); 3.6554 (0.6); 3.6438 (0.8); 3.6348 (0.5); 3.4683 (0.3); 3.4583 (0.5); 3.4476 (0.7); 3.4392 (0.8); 3.4282 (0.6); 3.4177 (0.5); 3.0020 (1.1); 2.9943 (1.1); 2.9744 (1.4); 2.9668 (1.3); 2.7661 (1.2); 2.7466 (1.2); 2.7386 (1.3); 2.7194 (1.5); 2.4941 (16.0); 2.3558 (0.4); 2.3106 (0.4); 2.2776 (2.5); 2.2619 (1.2); 2.2486 (12.7); 2.0445 (4.6); 2.0241 (12.6); 2.0065 (3.1); 1.9782 (1.0); 1.8694 (1.3); 1.2729 (1.3); 1.2585 (2.9); 1.2444 (1.5); 0.0699 (1.6); -0.0002 (15.1)

15-08: ^1H -ЯМР(500.1 MHz, CDCl_3):

δ = 7.9509 (0.5); 7.2558 (5.7); 7.1914 (1.8); 7.0655 (0.9); 7.0497 (2.4); 7.0338 (1.8); 7.0026 (1.4); 6.9989 (2.2); 6.9826 (6.4); 6.9768 (3.3); 6.9738 (3.5); 6.9586 (0.8); 6.9264 (3.4); 6.8663 (10.8); 6.7989 (1.0); 6.7957 (1.0); 6.7830 (1.8); 6.7698 (1.0); 6.7668 (0.9); 5.7301 (1.7); 5.7076 (1.8); 4.1303 (0.4); 4.1160 (0.4); 3.7753 (0.9); 3.7660 (1.0); 3.7534 (1.7); 3.7441 (1.8); 3.7068 (1.8); 3.7008 (1.8); 3.6852 (0.9); 3.6788 (1.0); 3.6038 (0.4); 3.5954 (0.6); 3.5856 (0.7); 3.5802 (0.7); 3.5748 (0.7); 3.5654 (0.5); 3.5568 (0.4); 3.0216 (1.2); 3.0117 (1.3); 2.9938 (1.5); 2.9840 (1.4); 2.8008 (1.4); 2.7828 (1.4); 2.7730 (1.2); 2.7550 (1.1); 2.3251 (16.0); 2.2914 (0.5); 2.0934 (0.4); 2.0830 (0.8); 2.0764 (0.8); 2.0661 (1.5); 2.0592 (0.6); 2.0558 (0.9); 2.0491 (0.8); 2.0450 (1.8); 2.0387 (0.4); 1.9853 (15.8); 1.3019 (0.6); 1.2889 (0.8); 1.2776 (0.9); 1.2724 (1.4); 1.2653 (2.5); 1.2582 (2.0); 1.2439 (0.8); 1.0219 (1.2); 1.0126 (3.0); 1.0088 (3.1); 1.0050 (1.7); 0.9998 (1.6); 0.9956 (3.0); 0.9918 (3.0); 0.9829 (1.3); 0.8955 (1.9); 0.8817 (5.3); 0.8675 (2.4); 0.7654 (1.4); 0.7562 (3.5); 0.7528 (3.4); 0.7461 (3.1); 0.7426 (3.7); 0.7331 (1.2); -0.0002 (4.1)

Таблица 17: Соединения согласно формуле (14)



(14)

Прим. №	R ⁷	R ⁸	Q	W	E ¹	R ³	R ⁴	R ⁵	L-R ⁶	LogP
14-01	CH ₃	H	3-хлорфенил	H	Cl	H	H	H	(2-бром-4-метилфенил)метил	4.51 ^[a]
14-02	CH ₃	H	2-фтор-3-метилфенил	H	Cl	H	H	H	(2-хлор-4-метилфенил)метил	4.43 ^[a]
14-03	CH ₃	H	3-хлорфенил	H	Cl	H	H	H	(2-хлор-4-метилфенил)метил	4.43 ^[a]
14-04	CH ₃	H	2-фтор-3-метилфенил	H	Cl	H	H	H	(3,5-диметилфенил)метил	4.47 ^[a]
14-05	CH ₃	H	3-хлорфенил	H	Cl	H	H	H	(3,5-диметилфенил)метил	4.51 ^[a]
14-06	CH ₃	H	3-хлор-2-фторфенил	H	Cl	H	H	H	(3,5-диметилфенил)метил	4.59 ^[a]
14-07	CH ₃	H	3-хлор-2-фторфенил	H	Cl	H	H	H	(2,5-диметилфенил)метил	4.42 ^[a]
14-08	CH ₃	H	2-фтор-3-метилфенил	H	Cl	H	H	H	(2,5-диметилфенил)метил	4.37 ^[a]
14-09	CH ₃	H	3-хлорфенил	H	Cl	H	H	H	(2,5-диметилфенил)метил	4.37 ^[a]
14-10	CH ₃	H	3-(1-фторциклопропил)фенил	H	Cl	H	H	H	(2,4-диметилфенил)метил	4.58 ^[a]
14-11	CH ₃	H	3-циклопропил-2-фторфенил	H	Cl	H	H	H	(2,4-диметилфенил)метил	4.74 ^[a]
14-12	Cl	H	3-хлорфенил	H	Cl	H	H	H	(2-хлор-4-метилфенил)метил	4.97 ^[a]

Таблица 18: ^1H -ЯМР соединений формулы (14):

14-01: ^1H-ЯМР(500.1 MHz, CDCl_3): δ= 8.0570 (5.3); 8.0165 (0.8); 8.0010 (0.9); 7.4132 (1.2); 7.3969 (3.2); 7.3808 (2.0); 7.3292 (2.8); 7.3107 (1.6); 7.3089 (1.6); 7.2945 (1.1); 7.2928 (1.2); 7.2599 (10.0); 7.2342 (1.7); 7.2301 (2.9); 7.2261 (1.7); 7.1483 (2.0); 7.1434 (1.5); 7.1417 (1.5); 7.1363 (3.0); 7.1269 (1.4); 7.1250 (1.6); 7.1215 (2.9); 7.0731 (1.1); 7.0576 (0.8); 6.9718 (1.5); 6.9563 (1.3); 4.8742 (0.5); 4.8673 (0.7); 4.8596 (0.8); 4.8518 (0.7); 4.8449 (0.5); 3.8900 (1.2); 3.8817 (1.2); 3.8674 (1.5); 3.8590 (1.4); 3.7190 (1.6); 3.7128 (1.6); 3.6964 (1.2); 3.6902 (1.2); 3.6512 (0.8); 3.6440 (0.8); 3.6297 (1.0); 3.6225 (1.0); 3.4967 (0.8); 3.4843 (1.1); 3.4751 (0.6); 3.4628 (0.9); 3.4150 (0.5); 3.4079 (0.5); 3.4003 (0.5); 3.3931 (0.5); 3.2161 (0.7); 3.2001 (0.7); 3.1882 (1.5); 3.1723 (1.4); 3.1434 (1.5); 3.1296 (1.5); 3.1155 (0.7); 3.1017 (0.7); 2.9674 (0.6); 2.9548 (0.6); 2.9402 (0.8); 2.9278 (0.8); 2.8098 (0.8); 2.7948 (0.8); 2.7826 (0.6); 2.7677 (0.6); 2.7164 (0.6); 2.7020 (16.0); 2.6907 (0.4); 2.3063 (8.4); 2.2877 (0.6); 2.2677 (12.4); 1.6148 (0.9); 1.2648 (0.6); 0.8819 (0.7); 0.8676 (0.3); 0.0697 (0.9); 0.0060 (0.5); -0.0002 (12.5); -0.0066 (0.6)
14-02: ^1H-ЯМР(500.1 MHz, CDCl_3): δ= 9.3190 (0.4); 8.0727 (0.7); 8.0568 (0.7); 8.0409 (5.4); 7.2596 (10.0); 7.1957 (0.9); 7.1730 (0.7); 7.1655 (1.0); 7.1546 (3.0); 7.1500 (1.6); 7.1432 (2.6); 7.1389 (3.1); 7.1313 (3.2); 7.1257 (4.4); 7.1100 (1.8); 7.0949 (0.5); 7.0284 (0.4); 7.0268 (0.4); 7.0113 (0.4); 6.9119 (1.3); 6.8981 (1.1); 6.8965 (1.1); 4.8482 (0.5); 4.8409 (0.7); 4.8334 (0.7); 4.8255 (0.7); 4.8183 (0.5); 3.8779 (1.2); 3.8693 (1.2); 3.8553 (1.5); 3.8468 (1.4); 3.7074 (1.6); 3.7009 (1.5); 3.6848 (1.3); 3.6784 (1.3); 3.6749 (0.5); 3.6599 (0.5); 3.6534 (0.4); 3.5204 (0.4); 3.5082 (0.6); 3.4870 (0.7); 3.1920 (0.4); 3.1765 (0.4); 3.1643 (1.7); 3.1498 (2.2); 3.1377 (1.8); 3.1238 (0.4); 3.1099 (0.4); 2.9749 (0.4); 2.9623 (0.4); 2.9014 (0.3); 2.8872 (0.3); 2.6873 (16.0); 2.3720 (0.5); 2.3415 (6.6); 2.3377 (6.8); 2.3077 (3.9); 2.2995 (0.6); 2.2829 (0.6); 2.2571 (11.3); 2.2440 (0.9); 1.9525 (0.3); 1.2651 (0.4); 0.8819 (0.6); 0.0062 (0.5); -0.0002 (13.3); -0.0066 (0.6)
14-03: ^1H-ЯМР(500.1 MHz, CDCl_3): δ= 8.0571 (5.8); 8.0175 (0.8); 8.0018 (0.8); 7.4129 (1.4); 7.3967 (3.3); 7.3805 (2.2); 7.3121 (1.4); 7.3106 (1.6); 7.3087 (1.6); 7.3072 (1.4); 7.2962 (1.0); 7.2944 (1.1); 7.2926 (1.2); 7.2598 (7.3); 7.2278 (1.7); 7.2236 (3.0); 7.2195 (1.7); 7.1381 (3.8); 7.1261 (3.7); 7.1234 (4.1); 6.9311 (1.5); 6.9156 (1.3); 4.8446 (0.6); 4.8376 (0.8); 4.8299 (0.8); 4.8220 (0.8); 4.8151 (0.6); 3.8802 (1.3); 3.8718 (1.3); 3.8576 (1.7); 3.8492 (1.6); 3.7137 (1.7); 3.7074 (1.8); 3.6911 (1.4); 3.6848 (1.3); 3.2137 (0.9); 3.1978 (0.8); 3.1859 (1.5); 3.1700 (1.5); 3.1259 (1.5); 3.1122 (1.5); 3.0981 (0.9); 3.0844 (0.8); 2.7019 (16.0); 2.6895 (0.3); 2.2702 (13.5); 2.0432 (0.3); 1.5642 (3.8); 1.3025 (0.5); 1.2889 (0.6); 1.2653 (1.9); 1.2449 (0.4); 0.8955 (1.3); 0.8818 (3.2); 0.8676 (1.5); 0.0062 (0.4); -0.0002 (9.7); -0.0067 (0.4)
14-04: ^1H-ЯМР(500.1 MHz, CDCl_3): δ= 8.0986 (3.5); 8.0414 (0.5); 8.0260 (0.5); 7.4010 (0.8); 7.3848 (2.0); 7.3686 (1.3); 7.3033 (0.8); 7.3016 (0.9); 7.2997 (1.0); 7.2979 (0.9); 7.2872 (0.6); 7.2854 (0.6); 7.2836 (0.7); 7.2818 (0.7); 7.2592 (6.4); 7.2273 (1.0); 7.2231 (1.8); 7.2190 (1.0); 7.1323 (0.8); 7.1309 (0.8); 7.1279 (0.8); 7.1264 (0.7); 7.1160 (0.7); 7.1145 (0.7); 7.1116 (0.7); 7.1101 (0.6); 6.8559 (4.4); 4.6743 (0.3); 4.6678 (0.4); 4.6595 (0.4); 4.6522 (0.4); 4.6457 (0.3); 3.7938 (0.7); 3.7850 (0.8); 3.7713 (1.1); 3.7626 (1.4); 3.7507 (0.4); 3.6820 (0.8); 3.6779 (1.2); 3.6716 (1.1); 3.6553 (0.8); 3.6490 (0.9); 3.6350 (0.6); 3.0137 (0.3); 3.0005 (0.4); 2.9862 (1.0); 2.9731 (0.9); 2.9610 (1.0); 2.9450 (1.0); 2.9337 (0.4); 2.9175 (0.4); 2.7226 (9.4); 2.2858 (0.4); 2.2284 (16.0); 1.5587 (2.8); 1.2651 (0.6); 1.2557 (0.7); 0.8955 (0.4); 0.8819 (1.0); 0.8676 (0.4); 0.0697 (0.5); -0.0002 (7.8); -0.0067 (0.3)

14-05: ^1H -ЯМР(500.1 MHz, CDCl_3):

δ = 8.0837 (4.0); 7.3117 (1.7); 7.3075 (1.7); 7.2595 (14.2); 7.1528 (0.6); 7.1402 (0.6); 7.1377 (0.6); 7.1260 (1.6); 7.1133 (1.4); 7.1096 (1.8); 7.0978 (0.6); 7.0638 (0.5); 7.0608 (0.5); 7.0478 (0.7); 6.8873 (0.9); 6.8831 (0.9); 6.8710 (0.8); 6.8668 (0.8); 6.0822 (0.7); 4.1595 (0.7); 4.1531 (0.7); 4.1376 (0.8); 4.1313 (0.8); 4.0006 (0.4); 3.9914 (0.4); 3.9827 (0.4); 3.9301 (0.9); 3.9207 (0.7); 3.9082 (0.7); 3.8988 (0.6); 3.1528 (0.6); 3.1426 (0.6); 3.1258 (0.8); 3.1155 (0.7); 2.9562 (0.8); 2.9378 (0.7); 2.9292 (0.6); 2.9108 (0.6); 2.3234 (4.1); 2.3198 (4.2); 2.3081 (0.4); 2.0435 (0.6); 1.5388 (16.0); 1.2729 (0.5); 1.2650 (0.8); 1.2587 (1.0); 1.2445 (0.3); 0.8955 (0.5); 0.8820 (1.3); 0.8677 (0.6); 0.0690 (1.0); 0.0062 (0.6); -0.0002 (18.0); -0.0067 (0.7)

14-06: ^1H -ЯМР(500.1 MHz, CDCl_3):

δ = 9.3870 (0.7); 8.0941 (2.8); 7.9387 (0.5); 7.9233 (0.5); 7.3853 (0.4); 7.3827 (0.4); 7.3694 (0.8); 7.3563 (0.4); 7.3535 (0.4); 7.2724 (0.4); 7.2699 (0.4); 7.2592 (6.3); 7.2430 (0.6); 7.2402 (0.5); 7.1917 (0.6); 7.1890 (0.6); 7.1753 (0.8); 7.1726 (0.8); 7.1589 (0.3); 7.1561 (0.3); 6.8596 (3.4); 6.8389 (1.4); 4.6752 (0.4); 4.6676 (0.4); 4.6602 (0.4); 3.7999 (0.6); 3.7911 (0.6); 3.7857 (0.3); 3.7773 (0.9); 3.7686 (1.0); 3.7629 (0.5); 3.6806 (1.2); 3.6740 (1.0); 3.6576 (0.7); 3.6515 (0.7); 3.6477 (0.5); 3.6353 (0.5); 3.0094 (0.4); 2.9958 (1.0); 2.9826 (1.1); 2.9766 (1.0); 2.9607 (0.9); 2.7196 (8.3); 2.2181 (16.0); 1.5535 (3.0); 1.2554 (0.4); 0.0697 (0.8); -0.0002 (7.0)

14-07: ^1H -ЯМР(500.1 MHz, CDCl_3):

δ = 9.3883 (1.4); 8.0970 (5.4); 8.0416 (0.9); 8.0261 (0.9); 7.8793 (0.4); 7.8633 (0.4); 7.4348 (0.4); 7.3904 (0.8); 7.3757 (1.5); 7.3616 (0.9); 7.3186 (0.4); 7.2893 (0.8); 7.2739 (1.6); 7.2592 (12.6); 7.2398 (0.5); 7.1999 (1.2); 7.1833 (1.7); 7.1666 (0.7); 7.0222 (1.8); 7.0057 (4.3); 6.9432 (1.8); 6.9288 (1.5); 6.9173 (0.4); 4.7276 (0.3); 4.7209 (0.4); 4.7122 (0.6); 4.7049 (0.8); 4.6975 (0.8); 4.6899 (0.8); 4.6829 (0.6); 4.1428 (0.9); 4.1285 (2.5); 4.1142 (2.6); 4.0999 (0.9); 3.8230 (1.2); 3.8152 (1.1); 3.8005 (1.6); 3.7925 (1.5); 3.7738 (0.4); 3.7682 (0.4); 3.7622 (0.6); 3.7508 (0.4); 3.6961 (2.0); 3.6906 (2.0); 3.6823 (0.7); 3.6736 (1.5); 3.6680 (1.4); 3.6468 (0.5); 3.6352 (0.7); 3.6237 (0.3); 3.0564 (0.4); 3.0425 (2.7); 3.0381 (2.6); 3.0289 (2.7); 3.0216 (2.2); 2.7172 (16.0); 2.6319 (0.4); 2.3787 (0.4); 2.3637 (13.0); 2.3479 (3.3); 2.3131 (0.4); 2.2282 (12.8); 2.0433 (10.8); 1.5499 (6.1); 1.2728 (3.0); 1.2585 (6.4); 1.2443 (2.9); 0.8953 (0.4); 0.8819 (0.8); 0.8677 (0.4); 0.0697 (0.4); -0.0002 (14.8)

14-08: ^1H -ЯМР(500.1 MHz, CDCl_3):

δ = 8.1948 (0.9); 8.1791 (0.9); 8.0824 (5.4); 7.2588 (8.5); 7.1876 (0.6); 7.1724 (1.4); 7.1627 (0.8); 7.1578 (1.2); 7.1413 (1.4); 7.1303 (1.4); 7.1237 (3.0); 7.1083 (2.0); 7.0928 (0.6); 7.0255 (1.8); 7.0097 (3.0); 7.0035 (3.1); 6.9433 (1.7); 6.9281 (1.2); 4.7063 (0.6); 4.6991 (0.8); 4.6915 (0.8); 4.6838 (0.8); 4.6766 (0.6); 4.1285 (0.7); 4.1142 (0.7); 3.8142 (1.1); 3.8061 (1.1); 3.7916 (1.6); 3.7836 (1.6); 3.7736 (0.4); 3.7679 (0.4); 3.7618 (0.5); 3.7573 (0.4); 3.7506 (0.3); 3.6879 (1.7); 3.6822 (2.1); 3.6654 (1.2); 3.6597 (1.2); 3.6465 (0.4); 3.6350 (0.7); 3.0351 (4.4); 3.0202 (4.3); 2.7039 (16.0); 2.3641 (12.7); 2.3382 (8.2); 2.3354 (8.2); 2.2232 (12.2); 2.0433 (2.9); 1.5603 (0.7); 1.2728 (0.9); 1.2584 (2.0); 1.2442 (0.8); -0.0002 (10.9)

14-09: ^1H -ЯМР(500.1 MHz, CDCl_3):

δ = 8.1505 (0.9); 8.1349 (0.9); 8.1043 (5.7); 7.4101 (1.3); 7.3939 (3.1); 7.3776 (2.1); 7.3057 (1.8); 7.3042 (1.8); 7.2914 (1.2); 7.2882 (1.3); 7.2589 (13.2); 7.1600 (1.5); 7.1557 (1.4); 7.1436 (1.3); 7.1393 (1.2); 7.0388 (1.9); 7.0235 (2.8); 6.9957 (3.0); 6.9623 (1.9); 6.9471 (1.3); 5.2972 (0.4); 4.7143 (0.3); 4.6987 (0.7); 4.6914 (0.8); 4.6838 (0.7); 3.8154 (1.1); 3.8075 (1.2); 3.7928 (1.7); 3.7849 (1.8); 3.7738 (0.5); 3.7682 (0.5); 3.7619 (0.6); 3.7576 (0.5); 3.7504 (0.4); 3.6939 (1.8); 3.6883 (1.8); 3.6824 (0.7); 3.6712 (1.3); 3.6657 (1.3); 3.6467 (0.5); 3.6350 (0.8); 3.6236 (0.3); 3.0627 (0.5); 3.0496 (0.6); 3.0350 (2.0); 3.0204 (3.0); 3.0024 (2.0); 2.9918 (0.6); 2.9748 (0.6); 2.7206 (16.0); 2.7047 (0.3); 2.3595 (14.1); 2.3433 (0.4); 2.2780 (0.7); 2.2341 (13.2); 1.5521 (6.4); 1.3163 (0.6); 1.3024 (1.3); 1.2892 (1.7); 1.2653 (5.2); 0.8954 (3.4); 0.8819 (8.0); 0.8677 (3.8); 0.0697 (0.4); 0.0056 (0.5); -0.0002 (13.7); -0.0065 (0.6)

14-11: ^1H -ЯМР(499.9 MHz, CDCl_3):

δ = 8.1700 (0.4); 8.1542 (0.4); 8.0860 (1.8); 7.2606 (5.4); 7.1159 (1.2); 7.1049 (1.1); 7.0736 (0.7); 7.0583 (0.8); 6.9491 (1.0); 6.8687 (0.6); 6.8515 (0.6); 6.8353 (0.4); 6.8268 (0.4); 3.8112 (0.4); 3.8027 (0.4); 3.7887 (0.5); 3.7803 (0.5); 3.6949 (0.6); 3.6891 (0.6); 3.6724 (0.4); 3.6666 (0.4); 3.0415 (1.1); 3.0268 (1.2); 2.7054 (5.1); 2.3729 (4.5); 2.2495 (4.3); 2.1707 (16.0); 2.1148 (0.4); 1.2552 (0.4); 1.0477 (0.3); 1.0385 (0.8); 1.0351 (0.9); 1.0262 (0.5); 1.0218 (0.8); 1.0181 (0.8); 1.0094 (0.3); 0.8580 (0.4); 0.8453 (0.5); 0.8007 (0.4); 0.7890 (1.0); 0.7786 (1.0); -0.0002 (6.4)

В. БИОЛОГИЧЕСКИЕ ПРИМЕРЫ

В-1. Профилактическое испытание *in vivo* на *Botrytis cinerea* (серая плесень)

Растворитель: 5 об.% диметилсульфоксида

10 об.% ацетона

Эмульгатор: 1мкл Tween® 80 на мг активного ингредиента

Активные ингредиенты делали растворимыми и гомогенизировали в смеси диметилсульфоксида/ацетона/ Tween® 80, а затем разбавили в воде до нужной концентрации.

Молодые растения корнишонов или капусты были обработаны распылением активного ингредиента, приготовленного, как описано выше. Контрольные растения обработали только водным раствором ацетона/диметилсульфоксида/ Tween® 80.

Через 24 часа, растения были заражены путем опрыскивания листьев водной суспензией спор *Botrytis cinerea*. Зараженные растения корнишонов инкубировали в течение 4 - 5 дней при 17°C и при 90% относительной влажности. Зараженные растения капусты инкубировали в течение 4 - 5 дней при 20°C и при 100% относительной влажности.

Результаты теста оценивали через 4 - 5 дней после инокуляции. 0% означает эффективность, соответствующую эффективности контрольных растений, в то время как эффективность 100% означает, что заболевания не наблюдалось.

В этом тесте следующие соединения согласно изобретению показали эффективность 90% - 100% при концентрации активного ингредиента 500 ч./млн.: I-001; I-002; I-003; I-004; I-005; I-006; I-007; I-008; I-010; I-011; I-012; I-013; I-014; I-015; I-016; I-018; I-019; I-020; I-022; I-023; I-025

В-2. Профилактическое испытание *in vivo* на *Pyrenophora teres* (сетчатая пятнистость на ячмене)

Растворитель: 5 об.% диметилсульфоксида

10 об.% ацетона

Эмульгатор: 1мкл Tween® 80 на мг активного ингредиента

Активные ингредиенты делали растворимыми и гомогенизировали в смеси диметилсульфоксида/аcetона/Tween® 80, а затем разбавили в воде до нужной концентрации.

Молодые растения ячменя были обработаны распылением активного ингредиента, приготовленного, как описано выше. Контрольные растения обработали только водным раствором аcetона/диметилсульфоксида/ Tween® 80.

Через 24 часа, растения были заражены путем опрыскивания листьев водной суспензией спор *Pyrenophora teres*. Зараженные растения ячменя инкубировали в течение 48 часов при 20°C и при 100% относительной влажности и затем в течение 8 дней при 20°C и при 70-80% относительной влажности.

Результаты теста оценивали через 10 дней после инокуляции. 0% означает эффективность, соответствующую эффективности контрольных растений, в то время как эффективность 100% означает, что заболевания не наблюдалось.

В этом тесте следующие соединения согласно изобретению показали эффективность 80% - 89% при концентрации активного ингредиента 500 ч./млн.: I-013; I-016

В этом тесте следующие соединения согласно изобретению показали эффективность 90% - 100% при концентрации активного ингредиента 500 ч./млн.: I-001; I-002; I-003; I-004; I-005; I-006; I-007; I-008; I-010; I-011; I-012; I-014; I-015; I-018; I-019; I-020; I-022; I-023; I-025

В-3. Профилактическое испытание *in vivo* на *Sphaerotheca fuliginea* (настоящая мучнистая роса на тыквенных культурах)

Растворитель: 5 об.% диметилсульфоксида

10 об.% аcetона

Эмульгатор: 1мкл Tween® 80 на мг активного ингредиента

Активные ингредиенты делали растворимыми и гомогенизировали в смеси диметилсульфоксида/аcetона/ Tween® 80, а затем разбавили в воде до нужной концентрации.

Молодые растения корншонов были обработаны распылением активного ингредиента, приготовленного, как описано выше. Контрольные растения обработали только водным раствором аcetона/диметилсульфоксида/ Tween® 80.

Через 24 часа, растения были заражены путем опрыскивания листьев водной суспензией спор *Sphaerotheca fuliginea*. Зараженные растения корншонов инкубировали в течение 8 дней при 20°C и при 70-80% относительной влажности.

Результаты теста оценивали через 8 дней после инокуляции. 0% означает эффективность, соответствующую эффективности контрольных растений, в то время как эффективность 100% означает, что заболевания не наблюдалось.

В этом тесте следующие соединения согласно изобретению показали эффективность 90% - 100% при концентрации активного ингредиента 500 ч./млн.: I-001; I-002; I-003; I-004; I-005; I-006; I-007; I-008; I-010; I-011; I-012; I-013; I-014; I-015; I-016; I-018; I-019; I-020; I-022; I-023; I-025

В-5. Профилактическое испытание *in vivo* на *Colletotrichum lindemuthianum* (пятнистость листьев на бобах)

Растворитель: 5 об.% диметилсульфоксида

10 об.% ацетона

Эмульгатор: 1мкл Tween® 80 на мг активного ингредиента

Активные ингредиенты делали растворимыми и гомогенизировали в смеси диметилсульфоксида/ацетона/Tween® 80, а затем разбавили в воде до нужной концентрации.

Молодые растения фасоли были обработаны распылением активного ингредиента, приготовленного, как описано выше. Контрольные растения обработали только водным раствором ацетона/диметилсульфоксида/ Tween® 80.

Через 24 часа, растения были заражены путем опрыскивания листьев водной суспензией спор *Colletotrichum lindemuthianum*. Зараженные растения фасоли инкубировали в течение 24 часов при 20°C и при 100% относительной влажности и затем в течение 6 дней при 20°C и при 90% относительной влажности.

Результаты теста оценивали через 7 дней после инокуляции. 0% означает эффективность, соответствующую эффективности контрольных растений, в то время как эффективность 100% означает, что заболевания не наблюдалось.

В этом тесте следующие соединения согласно изобретению показали эффективность 90% - 100% при концентрации активного ингредиента 500 ч./млн.:

I-001; I-002; I-003; I-004; I-005; I-006; I-007; I-008; I-010; I-011; I-012; I-013; I-014; I-015; I-016; I-018; I-019; I-020; I-022; I-023; I-025

В-6. *Alternaria alternata in vitro* клеточный тест

Растворитель: ДМСО

Культуральная среда: 14.6г безводной D-глюкозы (VWR), 7.1г Микологического Пептона (Oxoid), 1.4г гранулированного Экстракта Дрожжей (Merck), QSP 1 литр

Инокулят: суспензия спор

Фунгициды солюбилизировали в ДМСО и из раствора готовили необходимый диапазон концентраций. Конечная концентрация ДМСО, использованного в анализе, составляла $\leq 1\%$.

Готовили суспензию спор *A. alternata* и разбавляли ее до желаемой плотности спор.

Фунгициды оценивали по их способности ингибировать прорастание спор и рост мицелия в рамках анализа в жидкой культуре. Соединения добавляли в культуральную среду со спорами в нужной концентрации. После 5 дней инкубации фунгицидную токсичность соединений определяли спектрометрическим измерением роста мицелия. Ингибирование роста грибов определяли путем сравнения значений оптической плотности в лунках, содержащих фунгициды, с оптической плотностью в контрольных лунках без фунгицидов.

В этом тесте следующие соединения согласно изобретению показали эффективность 90% - 100% при концентрации активного ингредиента 20 ч./млн.: I-001; I-002; I-003; I-004; I-005; I-006; I-007; I-008; I-009; I-010; I-011; I-012; I-013; I-014; I-015; I-016; I-018; I-019; I-020; I-022; I-023; I-025

В-7. *Fusarium culmorum in vitro* клеточный тест

Растворитель: ДМСО

Культуральная среда: 14.6г безводной D-глюкозы (VWR), 7.1г Микологического Пептона (Oxoid), 1.4г гранулированного Экстракта Дрожжей (Merck), QSP 1 литр

Инокулят: суспензия спор

Фунгициды растворили в ДМСО и растворе, используемом для приготовления требуемого диапазона концентраций. Конечная концентрация ДМСО, используемая в анализе, составляла $\leq 1\%$.

Приготовили суспензию спор *F. culmorum* и разбавили до желаемой плотности спор.

Фунгициды оценивали по их способности ингибировать прорастание спор и рост мицелия в анализе культур в жидкой среде. Соединения добавляли в желаемой концентрации в культуральную среду со спорами. Через 4 дня инкубации, токсичность соединений для грибов определяли спектрометрическим измерением роста мицелия. Ингибирование роста грибов определяли путем сравнения значений поглощения в лунках, содержащих фунгициды, с поглощением в контрольных лунках без фунгицидов.

В этом тесте следующие соединения согласно изобретению показали эффективность 70% - 79% при концентрации активного ингредиента 20 ч./млн.: I-011; I-019

В этом тесте следующие соединения согласно изобретению показали эффективность 80% - 89% при концентрации активного ингредиента 20 ч./млн.: I-015

В этом тесте следующие соединения согласно изобретению показали эффективность 90% - 100% при концентрации активного ингредиента 20 ч./млн.: I-001; I-002; I-003; I-004; I-005; I-006; I-007; I-009; I-010; I-012; I-014; I-018; I-023; I-025

В-8. *Pyricularia oryzae in vitro* клеточный тест

Растворитель: ДМСО

Культуральная среда: 14.6г безводной D-глюкозы (VWR), 7.1г Микологического Пептона (Oxoid), 1.4г гранулированного Экстракта Дрожжей (Merck), QSP 1 литр

Инокулят: суспензия спор

Фунгициды растворили в ДМСО и растворе, используемом для приготовления требуемого диапазона концентраций. Конечная концентрация ДМСО, используемая в анализе, составляла $\leq 1\%$.

Приготовили суспензию спор *P. oryzae* и разбавили до желаемой плотности спор.

Фунгициды оценивали по их способности ингибировать прорастание спор и рост мицелия в анализе культур в жидкой среде. Соединения добавляли в желаемой концентрации в культуральную среду со спорами. Через 5 дней инкубации, токсичность соединений для грибов определяли спектрометрическим измерением роста мицелия. Ингибирование роста грибов определяли путем сравнения значений поглощения в лунках, содержащих фунгициды, с поглощением в контрольных лунках без фунгицидов.

В этом тесте следующие соединения согласно изобретению показали эффективность 70% - 79% при концентрации активного ингредиента 20 ч./млн.: I-022

В этом тесте следующие соединения согласно изобретению показали эффективность 80% - 89% при концентрации активного ингредиента 20 ч./млн.: I-013

В этом тесте следующие соединения согласно изобретению показали эффективность 90% - 100% при концентрации активного ингредиента 20 ч./млн.: I-001; I-002; I-003; I-004; I-005; I-006; I-007; I-008; I-009; I-010; I-011; I-012; I-014; I-015; I-016; I-018; I-019; I-020; I-023; I-025

В-9. *Colletotrichum lindemuthianum* in vitro клеточный тест

Растворитель: ДМСО

Культуральная среда: 14.6г безводной D-глюкозы (VWR), 7.1г Микологического Пептона (Oxoid), 1.4г гранулированного Экстракта Дрожжей (Merck), QSP 1 литр

Инокулят: суспензия спор

Фунгициды растворили в ДМСО и растворе, используемом для приготовления требуемого диапазона концентраций. Конечная концентрация ДМСО, используемая в анализе, составляла $\leq 1\%$.

Приготовили суспензию спор *C. lindemuthianum* и разбавили до желаемой плотности спор.

Фунгициды оценивали по их способности ингибировать прорастание спор и рост мицелия в анализе культур в жидкой среде. Соединения добавляли в желаемой концентрации в культуральную среду со спорами. Через 6 дней инкубации, токсичность соединений для грибов определяли спектрометрическим измерением роста мицелия. Ингибирование роста грибов определяли путем сравнения значений поглощения в лунках, содержащих фунгициды, с поглощением в контрольных лунках без фунгицидов.

В этом тесте следующие соединения согласно изобретению показали эффективность 90% - 100% при концентрации активного ингредиента 20 ч./млн.: I-001; I-002; I-003; I-004; I-005; I-006; I-007; I-008; I-009; I-010; I-011; I-012; I-013; I-014; I-015; I-016; I-018; I-019; I-020; I-023; I-025

B-10. *Septoria tritici in vitro* клеточный тест

Растворитель: ДМСО

Культуральная среда: 1г KH_2PO_4 (VWR), 1г K_2HPO_4 (VWR), 0.5г мочевины (VWR), 3г KNO_3 (Prolabo), 10г сахарозы (VWR), 0.5г $\text{MgSO}_4 \cdot 7\text{H}_2\text{O}$ (Sigma), 0.07г $\text{CaCl}_2 \cdot 2\text{H}_2\text{O}$ (Prolabo), 0.2мг $\text{MnSO}_4 \cdot \text{H}_2\text{O}$ (Sigma), 0.6мг $\text{CuSO}_4 \cdot 5\text{H}_2\text{O}$ (Sigma), 7.9мг $\text{ZnSO}_4 \cdot 7\text{H}_2\text{O}$ (Sigma), 0.1мг H_3BO_3 (Merck), 0.14мг $\text{NaMoO}_4 \cdot 2\text{H}_2\text{O}$ (Sigma), 2мг тиамин (Sigma), 0.1мг биотин (VWR), 4мг $\text{FeSO}_4 \cdot 7\text{H}_2\text{O}$ (Sigma), QSP 1 литр

Инокулят: суспензия спор

Фунгициды растворили в ДМСО и растворе, используемом для приготовления требуемого диапазона концентраций. Конечная концентрация ДМСО, используемая в анализе, составляла $\leq 1\%$.

Приготовили суспензию спор *S. tritici* и разбавили до желаемой плотности спор.

Фунгициды оценивали по их способности ингибировать прорастание спор и рост мицелия в анализе культур в жидкой среде. Соединения добавляли в желаемой концентрации в культуральную среду со спорами. After 7 days incubation, токсичность соединений для грибов определяли спектрометрическим измерением роста мицелия. Ингибирование роста грибов определяли путем сравнения значений поглощения в лунках, содержащих фунгициды, с поглощением в контрольных лунках без фунгицидов.

В этом тесте следующие соединения согласно изобретению показали эффективность 90% - 100% при концентрации активного ингредиента 20 ч./млн.: I-001; I-002; I-003; I-004; I-005; I-006; I-007; I-008; I-009; I-010; I-011; I-012; I-013; I-014; I-016; I-018; I-020; I-025

В-10. Профилактическое испытание *in vivo* на *Alternaria brassicae* (пятнистость листьев на редьке или капусте)

Растворитель: 5 об.% диметилсульфоксида

10 об.% ацетона

Эмульгатор: 1мкл Tween® 80 на мг активного ингредиента

Активные ингредиенты делали растворимыми и гомогенизировали в смеси диметилсульфоксида/ацетона/ Tween® 80, а затем разбавили в воде до нужной концентрации.

Молодые растения редьки или капусты были обработаны распылением активного ингредиента, приготовленного, как описано выше. Контрольные растения обрабатывали только водным раствором ацетона/диметилсульфоксида/ Tween® 80.

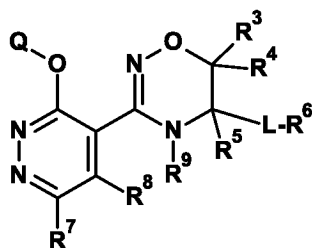
Через 24 часа, растения были заражены путем опрыскивания листьев водной суспензией спор *Alternaria brassicae*. Зараженные растения редьки или капусты инкубировали в течение 3 - 4 дней при 20°C и при 100% относительной влажности.

Результаты теста оценивали через 6 дней после инокуляции. 0% означает эффективность, соответствующую эффективности контрольных растений, в то время как эффективность 100% означает, что заболевания не наблюдалось.

В этом тесте следующие соединения согласно изобретению показали эффективность 90% - 100% при концентрации активного ингредиента 500 ч./млн.: I-001; I-002; I-003; I-004; I-005; I-006; I-007; I-008; I-010; I-011; I-012; I-013; I-014; I-015; I-016; I-018; I-019; I-020; I-022; I-023; I-025

Формула изобретения

1. Соединение формулы (I-1):



(I-1)

в которой

R³ и R⁴ означают водород,

R⁵ означает водород,

L означает метилен,

R⁶ означает фенил,

причем фенил замещен 2 заместителями, независимо выбранными из хлора, брома и метила,

R⁷ означает хлор, метил, этил или этенил,

причем метил, этил и этенил, при необходимости, замещены одним или двумя заместителями, независимо выбранными из группы, состоящей из фтора, хлора, гидроксид, метокси и этокси,

R⁸ означает водород,

R⁹ означает водород или формил,

Q означает фенил,

причем фенил замещен одним или двумя заместителями, независимо выбранными из фтора, хлора, метила, этила и циклопропила,

причем циклопропил, при необходимости, замещен одним или двумя заместителями, независимо выбранными из группы, состоящей из фтора и хлора,

а также его N-оксиды, соли, гидраты и гидраты солей и N-оксидов.

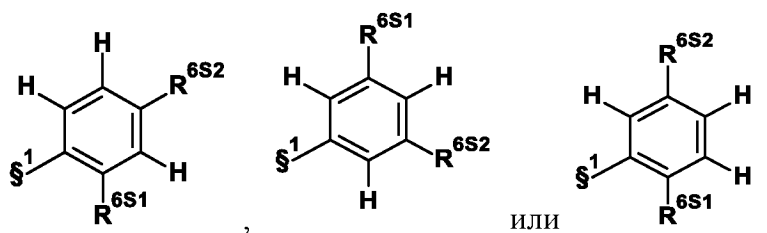
2. Соединение формулы (I-1) по п. 1, причем

R^3 и R^4 означают водород,

R^5 означает водород,

L означает метилен,

R^6 означает группу формулы



причем

$§^1$ означает присоединение к L,

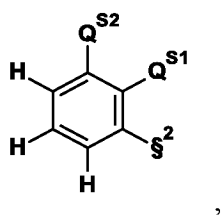
R^{6S1} означает хлор, бром или метил,

R^{6S2} означает хлор или метил, R^7 означает хлор, метил, дихлорметил, 1-фторэтил, 1-гидроксиэтил или 1-этоксиэтен-1-ил,

R^8 означает водород,

R^9 означает водород или формил,

Q означает группу формулы



в которой

$§^2$ означает присоединение к атому кислорода,

Q^{S1} означает водород или фтор,

Q^{S2} означает хлор, метил, этил, циклопропил, 1-фторциклопропил или 1-хлорциклопропил,

а также его соли, гидраты и гидраты солей.

3. Соединение формулы (I-1) по п. 1 или 2, причем соединение формулы (I-1) выбрано из группы, состоящей из

- (I-001) (5RS)-5-(2-бром-4-метилбензил)-3-[3-(3-хлорфенокси)-6-метилпиридазин-4-ил]-5,6-дигидро-4Н-1,2,4-оксадиазина,
- (I-002) (5RS)-3-[3-(3-хлорфенокси)-6-метилпиридазин-4-ил]-5-(2,4-диметилбензил)-5,6-дигидро-4Н-1,2,4-оксадиазина,
- (I-003) (5RS)-5-(2-хлор-4-метилбензил)-3-[3-(2-фтор-3-метилфенокси)-6-метилпиридазин-4-ил]-5,6-дигидро-4Н-1,2,4-оксадиазина,
- (I-004) (5RS)-5-(2-хлор-4-метилбензил)-3-[3-(3-хлорфенокси)-6-метилпиридазин-4-ил]-5,6-дигидро-4Н-1,2,4-оксадиазина,
- (I-005) (5RS)-3-[6-хлор-3-(2-фтор-3-метилфенокси)пиридазин-4-ил]-5-(2,4-дихлорбензил)-5,6-дигидро-4Н-1,2,4-оксадиазина,
- (I-006) (5RS)-5-(2-бром-4-метилбензил)-3-[3-(3-хлор-2-фторфенокси)-6-метилпиридазин-4-ил]-5,6-дигидро-4Н-1,2,4-оксадиазина,
- (I-007) (5RS)-5-(2,4-дихлорбензил)-3-[3-(2-фтор-3-метилфенокси)-6-метилпиридазин-4-ил]-5,6-дигидро-4Н-1,2,4-оксадиазина,
- (I-008) (5RS)-5-(3,5-диметилбензил)-3-[3-(2-фтор-3-метилфенокси)-6-метилпиридазин-4-ил]-5,6-дигидро-4Н-1,2,4-оксадиазина,
- (I-009) (5RS)-3-[3-(3-хлорфенокси)-6-метилпиридазин-4-ил]-5-(3,5-диметилбензил)-5,6-дигидро-4Н-1,2,4-оксадиазина,
- (I-010) (5RS)-3-[3-(3-хлор-2-фторфенокси)-6-метилпиридазин-4-ил]-5-(3,5-диметилбензил)-5,6-дигидро-4Н-1,2,4-оксадиазина,
- (I-011) (5RS)-3-[3-(3-хлорфенокси)-6-метилпиридазин-4-ил]-5-(2,5-диметилбензил)-5,6-дигидро-4Н-1,2,4-оксадиазина,
- (I-012) (5RS)-3-[3-(3-хлор-2-фторфенокси)-6-метилпиридазин-4-ил]-5-(2,5-диметилбензил)-5,6-дигидро-4Н-1,2,4-оксадиазина,
- (I-013) (5RS)-5-(2,5-диметилбензил)-3-[3-(2-фтор-3-метилфенокси)-6-метилпиридазин-4-ил]-5,6-дигидро-4Н-1,2,4-оксадиазина,
- (I-014) (5RS)-5-(2,4-диметилбензил)-3-[3-(3-этил-2-фторфенокси)-6-метилпиридазин-4-ил]-5,6-дигидро-4Н-1,2,4-оксадиазина,

(I-015) (5RS)-5-(2,4-диметилбензил)-3-{3-[3-(1-фторциклопропил)фенокси]-6-метилпиридазин-4-ил}-5,6-дигидро-4H-1,2,4-оксадиазина,

(I-016) 1-{6-(3-циклопропилфенокси)-5-[5-(2,4-диметилбензил)-5,6-дигидро-4H-1,2,4-оксадиазин-3-ил]пиридазин-3-ил}этанола,

(I-017) (5RS)-3-[6-хлор-3-(3-хлорфенокси)пиридазин-4-ил]-5-(2-хлор-4-метилбензил)-5,6-дигидро-4H-1,2,4-оксадиазина,

(I-018) (5RS)-3-{3-(3-циклопропил-2-фторфенокси)-6-[(1RS)-1-фторэтил]пиридазин-4-ил}-5-(2,4-дихлорбензил)-5,6-дигидро-4H-1,2,4-оксадиазина,

(I-019) (5RS)-3-[3-(3-циклопропилфенокси)-6-(1-этоксивинил)пиридазин-4-ил]-5-(2,4-дихлорбензил)-5,6-дигидро-4H-1,2,4-оксадиазина,

(I-020) (5RS)-3-[3-(3-циклопропил-2-фторфенокси)-6-(1-этоксивинил)пиридазин-4-ил]-5-(2,4-дихлорбензил)-5,6-дигидро-4H-1,2,4-оксадиазина,

(I-021) (5S)-3-[3-(3-циклопропил-2-фторфенокси)-6-(дихлорметил)пиридазин-4-ил]-5-(2,4-диметилбензил)-5,6-дигидро-4H-1,2,4-оксадиазина,

(I-022) (5RS)-3-{3-[3-(1-хлорциклопропил)фенокси]-6-метилпиридазин-4-ил}-5-(2,4-дихлорбензил)-5,6-дигидро-4H-1,2,4-оксадиазина,

(I-023) 1-{6-(3-циклопропил-2-фторфенокси)-5-[5-(2,4-дихлорбензил)-5,6-дигидро-4H-1,2,4-оксадиазин-3-ил]пиридазин-3-ил}этанола,

(I-024) (5RS)-3-{6-хлор-3-[3-(1-хлорциклопропил)фенокси]пиридазин-4-ил}-5-(2,4-дихлорбензил)-5,6-дигидро-4H-1,2,4-оксадиазина,

(I-025) (5RS)-3-[6-хлор-3-(3-циклопропил-2-фторфенокси)пиридазин-4-ил]-5-(2,4-дихлорбензил)-5,6-дигидро-4H-1,2,4-оксадиазин-4-карбальдегида.

4. Соединение формулы (I-1) по п. 1 или 2, причем соединение формулы (I) выбрано из группы, состоящей из

(I.001) (5RS)-5-(2-бром-4-метилбензил)-3-[3-(3-хлорфенокси)-6-метилпиридазин-4-ил]-5,6-дигидро-4H-1,2,4-оксадиазина,

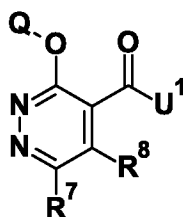
- (I.002) (5RS)-3-[3-(3-хлорфенокси)-6-метилпиридазин-4-ил]-5-(2,4-диметилбензил)-5,6-дигидро-4Н-1,2,4-оксадиазина,
- (I.003) (5RS)-5-(2-хлор-4-метилбензил)-3-[3-(2-фтор-3-метилфенокси)-6-метилпиридазин-4-ил]-5,6-дигидро-4Н-1,2,4-оксадиазина,
- (I.004) (5RS)-5-(2-хлор-4-метилбензил)-3-[3-(3-хлорфенокси)-6-метилпиридазин-4-ил]-5,6-дигидро-4Н-1,2,4-оксадиазина,
- (I.005) (5RS)-3-[6-хлор-3-(2-фтор-3-метилфенокси)пиридазин-4-ил]-5-(2,4-дихлорбензил)-5,6-дигидро-4Н-1,2,4-оксадиазина,
- (I.006) (5RS)-5-(2-бром-4-метилбензил)-3-[3-(3-хлор-2-фторфенокси)-6-метилпиридазин-4-ил]-5,6-дигидро-4Н-1,2,4-оксадиазина,
- (I.007) (5RS)-5-(2,4-дихлорбензил)-3-[3-(2-фтор-3-метилфенокси)-6-метилпиридазин-4-ил]-5,6-дигидро-4Н-1,2,4-оксадиазина,
- (I.008) (5RS)-5-(3,5-диметилбензил)-3-[3-(2-фтор-3-метилфенокси)-6-метилпиридазин-4-ил]-5,6-дигидро-4Н-1,2,4-оксадиазина,
- (I.009) (5RS)-3-[3-(3-хлорфенокси)-6-метилпиридазин-4-ил]-5-(3,5-диметилбензил)-5,6-дигидро-4Н-1,2,4-оксадиазина,
- (I.010) (5RS)-3-[3-(3-хлор-2-фторфенокси)-6-метилпиридазин-4-ил]-5-(3,5-диметилбензил)-5,6-дигидро-4Н-1,2,4-оксадиазина,
- (I.011) (5RS)-3-[3-(3-хлорфенокси)-6-метилпиридазин-4-ил]-5-(2,5-диметилбензил)-5,6-дигидро-4Н-1,2,4-оксадиазина,
- (I.012) (5RS)-3-[3-(3-хлор-2-фторфенокси)-6-метилпиридазин-4-ил]-5-(2,5-диметилбензил)-5,6-дигидро-4Н-1,2,4-оксадиазина,
- (I.013) (5RS)-5-(2,5-диметилбензил)-3-[3-(2-фтор-3-метилфенокси)-6-метилпиридазин-4-ил]-5,6-дигидро-4Н-1,2,4-оксадиазина,
- (I.014) (5RS)-5-(2,4-диметилбензил)-3-[3-(3-этил-2-фторфенокси)-6-метилпиридазин-4-ил]-5,6-дигидро-4Н-1,2,4-оксадиазина,
- (I.015) (5RS)-5-(2,4-диметилбензил)-3-{3-[3-(1-фторциклопропил)фенокси]-6-метилпиридазин-4-ил}-5,6-дигидро-4Н-1,2,4-оксадиазина.

5. Композиция для борьбы с фитопатогенными вредными грибами, содержащая, по меньшей мере, одно соединение формулы (I-1) по любому из пп. 1 - 4 и, по меньшей мере, один носитель и/или поверхностно-активное вещество.

6. Способ борьбы с вредными микроорганизмами в области защиты растений и области защиты материалов, **отличающийся тем**, что, по меньшей мере, одно соединение формулы (I-1) по любому из пп. 1 - 4 и/или композицию по п. 5 наносят на вредные микроорганизмы и/или место их обитания.

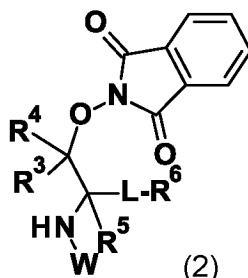
7. Применение одного или более соединений формулы (I-1) по любому из пп. 1 - 4 и/или композиции по п. 5 для борьбы с вредными микроорганизмами в области защиты растений и области защиты материалов.

8. Способ получения соединения формулы (I-a), в которой соединение формулы (1)



(1)

в которой R^7 , R^8 и Q имеют значения, как определено в любом из пп. 1 - 4, и U^1 означает гидроксид, галоген или C_1 - C_6 -алкокси, вступает в реакцию с амином формулы (2)

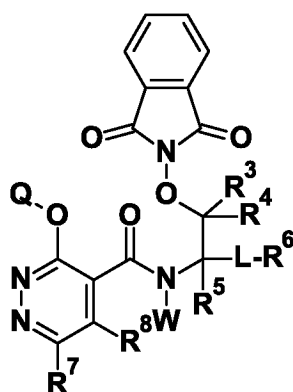


(2)

в которой R^3 , R^4 , R^5 , R^6 и L имеют значения, как определено в любом из пп. 1 - 4, и

W означает водород, трет-бутоксикарбонил, бензил, аллил или (4-метоксифенил)метил,

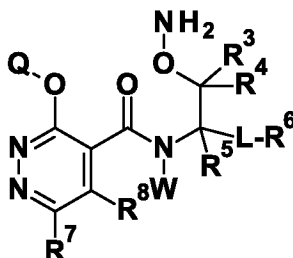
или одной из его солей, с получением соединения формулы (3)



(3)

в которой R^3 , R^4 , R^5 , R^6 , R^7 , R^8 , L , W и Q определены, как и ранее,

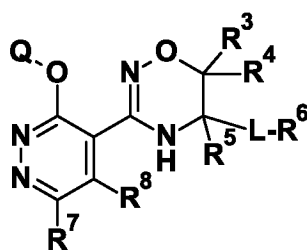
из которого удаляют фталимидную группу, с выходом соединения формулы (4)



(4)

в которой R^3 , R^4 , R^5 , R^6 , R^7 , R^8 , L , W и Q определены, как и ранее,

которое затем обрабатывают, когда W означает водород, дегидратирующим агентом, при необходимости, в присутствии основания, с получением непосредственно соединения формулы (I-a)



(I-a)

в которой R^3 , R^4 , R^5 , R^6 , R^7 , R^8 , L и Q определены, как и ранее,

или

которое затем обрабатывают, когда W означает аминозащитную группу, такую как трет-бутоксикарбонил, бензил, аллил или (4-

метоксифенил)метил, дегидратирующим агентом, при необходимости, в присутствии основания, и затем осуществляют этап удаления защитных групп, с получением соединения формулы (I-a).

9. Способ получения соединения формулы (I-a), в которой соединение формулы (5)



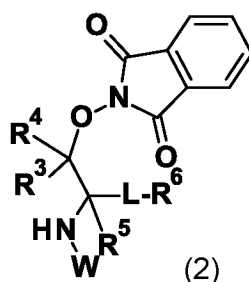
(5)

в которой R^7 и R^8 имеют значения, как определено в любом из пп. 1 - 4, и

X означает галоген,

U^1 означает гидроксигруппу, галоген или C_1 - C_6 -алкокси,

вступает в реакцию с амином формулы (2)



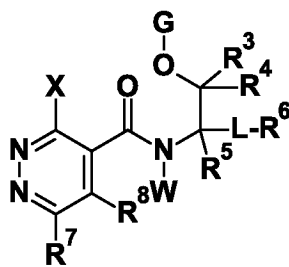
(2)

в которой R^3 , R^4 , R^5 , R^6 и L имеют значения, как определено в любом из пп.

1 - 4, и

W означает водород, трет-бутоксикарбонил, бензил, аллил или (4-метоксифенил)метил,

или одной из его солей, с получением соединения формулы (6a)

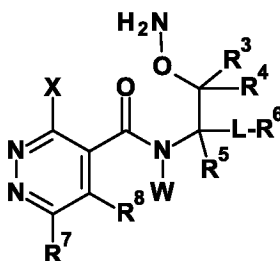


(6a),

в которой R^3 , R^4 , R^5 , R^6 , R^7 , R^8 , L, X и W определены, как и ранее, и

G означает фталимидо,

из которой удаляют фталимидную группу, с получением соединения формулы (6b)



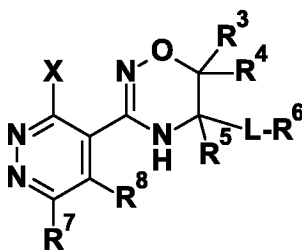
(6b),

в которой R^3 , R^4 , R^5 , R^6 , R^7 , R^8 , L, X и W определены, как и ранее,

которое затем обрабатывают, когда W означает водород, дегидратирующим агентом, при необходимости, в присутствии основания, с получением непосредственно соединения формулы (7),

или

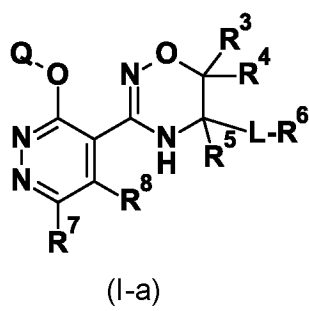
которое затем обрабатывают, когда W означает аминозащитную группу, дегидратирующим агентом, при необходимости, в присутствии основания и затем осуществляют этап удаления защитных групп, с получением соединения формулы (7)



(7)

в которой R^3 , R^4 , R^5 , R^6 , R^7 , R^8 , L и X определены, как и ранее,

которое, наконец, вступает в реакцию с соединением формулы (8), в которой Q имеет значение, как определено в любом из пп. 1 - 3, в присутствии основания (например, органического или неорганического основания) и, при необходимости, в присутствии подходящего комплекса или соли меди, с выходом соединения формулы (I-a)



в которой R^3 , R^4 , R^5 , R^6 , R^7 , R^8 , L и Q определены, как и ранее.