

(19)



Евразийское
патентное
ведомство

(21) 202393499 (13) A1

(12) ОПИСАНИЕ ИЗОБРЕТЕНИЯ К ЕВРАЗИЙСКОЙ ЗАЯВКЕ

(43) Дата публикации заявки
2024.02.13

(51) Int. Cl. C07D 471/04 (2006.01)
C07D 487/04 (2006.01)
A01N 43/50 (2006.01)
A01N 43/56 (2006.01)

(22) Дата подачи заявки
2022.05.31

(54) ПЕСТИЦИДНО АКТИВНЫЕ ГЕТЕРОЦИКЛИЧЕСКИЕ ПРОИЗВОДНЫЕ С
СУЛЬФОКСИМИНСОДЕРЖАЩИМИ ЗАМЕСТИТЕЛЯМИ

(31) 202111024601

(72) Изобретатель:

(32) 2021.06.02

Мюлебах Мишель, Рендлер Зебастиан,
Эдмунде Эндрю, Буххольц Анке,
Эмери Даниэль (CH), Сен Индира,
Равал Гириш (IN), Штоллер Андре,
Уильямс Саймон, Шмитц Хелмарс
(CH), Комас-Барсело Хулия, Сикервар
Викас (GB)

(33) IN

(86) PCT/EP2022/064778

(87) WO 2022/253841 2022.12.08

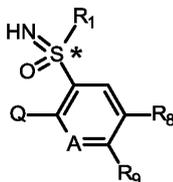
(71) Заявитель:

СИНГЕНТА КРОП ПРОТЕКШН АГ
(CH)

(74) Представитель:

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

(57) Раскрыты соединения формулы (I)



где заместители определены в п. 1. Кроме того, настоящее изобретение относится к агрохимическим композициям, которые содержат соединения формулы (I), получению этих композиций и применению соединений или композиций в сельском хозяйстве или садоводстве для борьбы, предупреждения или осуществления контроля животных-вредителей, в том числе членистоногих, и, в частности, насекомых или представителей отряда Acarina.

A1

202393499

202393499

A1

ПЕСТИЦИДНО АКТИВНЫЕ ГЕТЕРОЦИКЛИЧЕСКИЕ ПРОИЗВОДНЫЕ С
СУЛЬФОКСИМИНСОДЕРЖАЩИМИ ЗАМЕСТИТЕЛЯМИ

5

Настоящее изобретение относится к пестицидно активным, в частности к инсектицидно активным, гетероциклическим производным, содержащим сульфоксиминовые заместители, к способам их получения, к композициям, содержащим такие соединения, а также к их применению для контроля животных-вредителей, включая членистоногих, и в частности насекомых или представителей отряда *Acarina*.

10

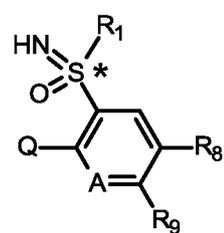
Пестицидно активные гетероциклические сульфоксиминовые производные были ранее описаны в литературе, например, в WO 2015/071180, WO 2016/039441, WO 2018/206348, WO 2019/219689, WO 2019/229089, WO 2019/234158, WO 2020/084075 и WO2020/141136.

15

На данный момент неожиданно было обнаружено, что определенные новые сульфоксиминосодержащие фенильные и пиридинные производные со стереогенным атомом серы и цианоизопропокси-, цианоизопропильной или цианоциклопропильной группой характеризуются благоприятными свойствами в качестве пестицидов и являются получаемыми стереоспецифическим способом с помощью методик стереоселективного окисления с последующей реакцией стереоспецифического иминирования.

20

25 Таким образом, в настоящем изобретении предусмотрены соединения формулы I,



(I),

где

A представляет собой CH или N;

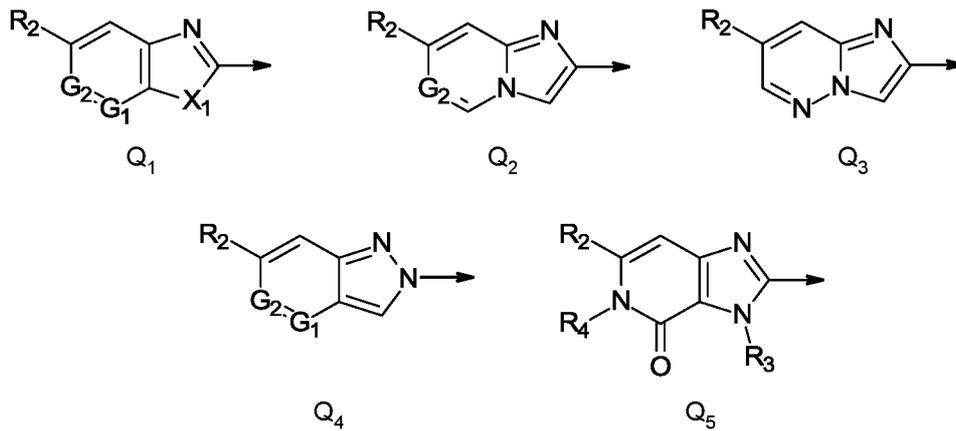
R₁ представляет собой C₁-C₄алкил;

S* представляет собой стереогенный атом серы, который находится в R- или S-конфигурации;

R₈ представляет собой цианоизопропокси, цианоизопропил или цианоциклопропил;

R₉ представляет собой водород или C₁-C₄алкил;

5 Q представляет собой радикал, выбранный из группы, состоящей из формул Q₁ -Q₅,



где стрелка обозначает точку присоединения к кольцу, содержащему радикал A;

и где

X₁ представляет собой O, S или NR₃;

10 R₃ представляет собой C₁-C₄алкил;

R₂ представляет собой галоген, C₁-C₆галогеналкил, C₁-C₄галогеналкилсульфанил, C₁-C₄галогеналкилсульфинил, C₁-C₄галогеналкилсульфонил или C₁-C₆галогеналкокси;

G₁ и G₂ независимо друг от друга представляют собой N или CH;

R₄ представляет собой C₁-C₄алкил, C₁-C₄галогеналкил, C₃-C₆циклоалкил или C₁-

15 C₄алкокси; или

агротехнически приемлемая соль, стереоизомер, энантиомер, таутомер или N-оксид соединения формулы I.

20 Соединения формулы I, которые содержат по меньшей мере один основной центр, могут образовывать, например, соли присоединения кислоты, например, с сильными неорганическими кислотами, такими как минеральные кислоты, например, хлорная кислота, серная кислота, азотная кислота, азотистая кислота, фосфорная кислота или галогенводородная кислота, с сильными органическими карбоновыми кислотами, такими как C₁-C₄алканкарбоновые кислоты, которые являются незамещенными или
25 замещенными, например галогеном, например, уксусная кислота, такими как насыщенные или ненасыщенные дикарбоновые кислоты, например, щавелевая кислота,

малоновая кислота, янтарная кислота, малеиновая кислота, фумаровая кислота или фталевая кислота, такими как гидроксикарбоновые кислоты, например, аскорбиновая кислота, молочная кислота, яблочная кислота, винная кислота или лимонная кислота, или такими как бензойная кислота, или с органическими сульфоновыми кислотами, такими как C_1 - C_4 алкан- или арилсульфоновые кислоты, которые являются незамещенными или замещенными, например галогеном, например, метан- или п-толуолсульфоновая кислота. Соединения формулы I, которые содержат по меньшей мере одну кислотную группу, могут образовывать, например, соли с основаниями, например минеральные соли, такие как соли щелочных металлов или щелочноземельных металлов, например соли натрия, калия или магния, или соли с аммиаком или органическим амином, таким как морфолин, пиперидин, пирролидин, низший моно-, ди- или триалкиламин, например этил-, диэтил-, триэтил- или диметилпропиламин, либо низший моно-, ди- или тригидроксиалкиламин, например моно-, ди- или триэтаноламин.

Алкильные группы, которые встречаются в определениях заместителей, могут быть с прямой цепью или разветвленными и представлять собой, например, метил, этил, н-пропил, изопропил, н-бутил, втор-бутил, изобутил, трет-бутил, пентил, гексил и их разветвленные изомеры. Галогеналкилсульфаниловые, галогеналкилсульфинильные, галогеналкилсульфонильные и алкоксирадикалы получают из указанных алкильных радикалов.

Применяемый в данном документе термин "цианоизопропил" относится к изопропильной группе (указанной выше), при этом один из атомов водорода в этом радикале может быть заменен на цианогруппу. Цианоизопропил представляет собой, например, 1-циано-1-метилэтил или 2-циано-1-метилэтил.

Галоген, как правило, представляет собой фтор, хлор, бром или йод. Это также применимо, соответственно, к галогену в комбинации с другими значениями, такими как галогеналкил.

Галогеналкильные группы относятся к насыщенному C_1 - C_n алкильному радикалу с прямой или разветвленной цепью, который содержит от 1 до n атомов углерода,

предпочтительно характеризуется длиной цепи от 1 до 6 атомов углерода (как указано выше), где некоторые или все из атомов водорода в этих радикалах могут быть заменены на фтор, хлор, бром и/или йод. Галогеналкил представляет собой, например, фторметил, дифторметил, трифторметил, хлорметил, дихлорметил, трихлорметил, 2,2,2-трифторэтил, 2-фторэтил, 2-хлорэтил, пентафторэтил, 1,1-дифтор-2,2,2-трихлорэтил, 2,2,3,3-тетрафторэтил и 2,2,2-трихлорэтил; предпочтительно трихлорметил, дифторхлорметил, дифторметил, трифторметил и дихлорфторметил.

Алкоксигруппы предпочтительно характеризуются предпочтительной длиной цепи от 1 до 6 атомов углерода. Алкокси представляет собой, например, метокси, этокси, пропокси, изопропокси, н-бутокси, изобутокси, втор-бутокси и трет-бутокси, а также изомер пентилокси и гексилокси, предпочтительно метокси и этокси.

Применяемый в данном документе термин "цианоизопропокси" относится к изопропоксигруппе (как указано выше), где один из атомов водорода в этом радикале может быть заменен на цианогруппу. Цианоизопропокси представляет собой, например, 1-циано-1-метилэтокси или 2-циано-1-метилэтокси.

Применяемый в данном документе термин " C_1 - C_n галогеналкокси" относится к насыщенному C_1 - C_n галогеналкильному радикалу с прямой или разветвленной цепью, содержащему от 1 до n атомов углерода (как указано выше), который присоединен с помощью атома кислорода, аналогично C_1 - C_n алкокси.

Алкилсульфанил представляет собой, например, метилсульфанил, этилсульфанил, пропилсульфанил, изопропилсульфанил, бутилсульфанил, пентилсульфанил и гексилсульфанил.

Алкилсульфинил представляет собой, например, метилсульфинил, этилсульфинил, пропилсульфинил, изопропилсульфинил, бутилсульфинил, пентилсульфинил и гексилсульфинил.

Алкилсульфонил представляет собой, например, метилсульфонил, этилсульфонил, пропилсульфонил, изопропилсульфонил, бутилсульфонил, пентилсульфонил и гексилсульфонил.

Применяемый в данном документе термин " C_1 - C_n галогеналкилсульфанил" относится к алкилсульфаниловому радикалу, указанному выше, который частично или полностью замещен фтором, хлором, бромом и/или йодом. Галогеналкилсульфаниловые группы предпочтительно характеризуются длиной цепи от 1 до 4 атомов углерода, например, представляют собой любой из фторметилтио, дифторметилтио, трифторметилтио, хлордифторметилтио, бромдифторметилтио, 2-фторэтилтио, 2-хлорэтилтио, 2-бромэтилтио, 2-иодэтилтио, 2,2-дифторэтилтио, 2,2,2-трифторэтилтио, 2,2,2-трихлорэтилтио, 2-хлор-2-фторэтилтио, 2-хлор-2,2-дифторэтилтио, 2,2-дихлор-2-фторэтилтио, пентафторэтилтио, 2-фторпропилтио, 3-фторпропилтио, 2-хлорпропилтио, 3-хлорпропилтио, 2-бромпропилтио, 3-бромпропилтио, 2,2-дифторпропилтио, 2,3-дифторпропилтио, 2,3-дихлорпропилтио, 3,3,3-трифторпропилтио, 3,3,3-трихлорпропилтио, 2,2,3,3,3-пентафторпропилтио, гептафторпропилтио, 1-(фторметил)-2-фторэтилтио, 1-(хлорметил)-2-хлорэтилтио, 1-(бромметил)-2-бромэтилтио, 4-фторбутилтио, 4-хлорбутилтио или 4-бромбутилтио.

Подобные принципы применимы к терминам " C_1 - C_n галогеналкилсульфинил" и " C_1 - C_n галогеналкилсульфонил", которые относятся к C_1 - C_n галогеналкилсульфанилу (как указано выше), но с атомом серы, находящимся в разных степенях окисления, например, сульфоксид- $S(O)C_1$ - C_n галогеналкилу или сульфону- $S(O)_2C_1$ - C_n галогеналкилу соответственно. Соответственно, например, группы, такие как трифторметилсульфинил, трифторметилсульфонил или 2,2,2-трифторэтилсульфонил.

Циклоалкильные группы предпочтительно содержат от 3 до 6 атомов углерода в кольце, например, циклопропил, циклобутил, циклопентил и циклогексил.

Применяемый в данном документе термин "цианоциклопропил" относится к циклопропилу (как указано выше), где один из атомов водорода в этом радикале может быть заменен на цианогруппу. Цианоциклопропил представляет собой, например, 1-цианоциклопропил или 2-цианоциклопропил.

Соединения формулы I согласно настоящему изобретению также включают гидраты, которые могут образовываться в ходе солеобразования.

Наличие стереогенного центра, который представляет собой атом серы (S^*), в соединениях формулы (I) означает, что соединения могут встречаться в формах оптических изомеров, т. е. энантиомерных или диастереоизомерных формах.

Предпочтительно и при отсутствии дополнительного асимметричного атома углерода или серы данное изобретение относится к обоим энантиомерам, которые образуются вследствие наличия хирального атома серы S*, т. е. данное изобретение охватывает соединения формулы (I) или в (R)-, или в (S)-конфигурации при указанном стереогенном атоме серы и их смеси (такие как чистые энантиомеры или смеси энантиомеров, т. е. отдельные энантиомеры, характеризующиеся энантиомерным избытком). Данное изобретение также относится к отдельным энантиомерам, получаемым или после разделения рацемической смеси с применением известных способов разделения или получаемым с помощью методик стереоселективного синтеза.

5 Например, энантиомеры, которые элюируются первым и вторым, получают с помощью хроматографического разделения с применением хиральной неподвижной фазы (такой как колонки на основе амилозы или целлюлозы CHIRALPAK®); или энантиомеры, которые получаемы стереоспецифическим способом путем осуществления иминирования стереогенных сульфинильных производных, что получают путем

15 осуществления стереоселективного окисления соответствующих сульфаниловых соединений, также являются объектом данного изобретения.

Предусмотренные определенные варианты осуществления в соответствии с настоящим изобретением изложены ниже.

20 В варианте осуществления 1 предусмотрены соединения формулы I или их агрохимически приемлемая соль, стереоизомер, энантиомер, таутомер или N-оксид, определенные выше.

25 В варианте осуществления 2 предусмотрены соединения или их агрохимически приемлемая соль, стереоизомер, энантиомер, таутомер или N-оксид в соответствии с вариантом осуществления 1, где

A представляет собой CH или N;

R₁ представляет собой этил, пропил или изопропил;

30 R₈ представляет собой цианоизопропоксид, цианоизопропил или цианоциклопропил; и

R₉ представляет собой водород, метил или этил.

В варианте осуществления 3a предусмотрены соединения или их агрохимически приемлемая соль, стереоизомер, энантиомер, таутомер или N-оксид в соответствии с вариантом осуществления 1, где

A представляет собой CH или N;

5 R₁ представляет собой этил;

R₈ представляет собой цианоизопропокси, цианоизопропил или цианоциклопропил; и

R₉ представляет собой водород или метил.

10 В варианте осуществления 3b предусмотрены соединения или их агрохимически приемлемая соль, стереоизомер, энантиомер, таутомер или N-оксид в соответствии с вариантом осуществления 1, где

A представляет собой N;

R₁ представляет собой этил;

15 R₈ представляет собой 1-циано-1-метилэтокси, 1-циано-1-метилэтил или 1-цианоциклопропил; и

R₉ представляет собой водород или метил.

20 В варианте осуществления 3c предусмотрены соединения или их агрохимически приемлемая соль, стереоизомер, энантиомер, таутомер или N-оксид в соответствии с вариантом осуществления 1, где

A представляет собой CH;

R₁ представляет собой этил;

25 R₈ представляет собой 1-циано-1-метилэтокси, 1-циано-1-метилэтил или 1-цианоциклопропил; и

R₉ представляет собой водород или метил.

В варианте осуществления 4a предусмотрены соединения или их агрохимически приемлемая соль, стереоизомер, энантиомер, таутомер или N-оксид в соответствии с вариантом осуществления 1, где

30 A представляет собой CH или N;

R₁ представляет собой этил;

R₈ представляет собой 1-циано-1-метилэтокси, 1-циано-1-метилэтил или 1-цианоциклопропил; и

R₉ представляет собой водород.

В варианте осуществления 4b предусмотрены соединения или их агрохимически приемлемая соль, стереоизомер, энантиомер, таутомер или N-оксид в соответствии с вариантом осуществления 1, где

A представляет собой N;

R₁ представляет собой этил;

R₈ представляет собой 1-циано-1-метилэтокси, 1-циано-1-метилэтил или 1-цианоциклопропил; и

10 R₉ представляет собой водород.

В варианте осуществления 4с предусмотрены соединения или их агрохимически приемлемая соль, стереоизомер, энантиомер, таутомер или N-оксид в соответствии с вариантом осуществления 1, где

15 A представляет собой CH;

R₁ представляет собой этил;

R₈ представляет собой 1-циано-1-метилэтокси, 1-циано-1-метилэтил или 1-цианоциклопропил; и

R₉ представляет собой водород.

20

В варианте осуществления 5a предусмотрены соединения или их агрохимически приемлемая соль, стереоизомер, энантиомер, таутомер или N-оксид в соответствии с вариантом осуществления 1, где

A представляет собой CH или N;

25 R₁ представляет собой этил;

R₈ представляет собой 1-циано-1-метилэтокси, 1-циано-1-метилэтил или 1-цианоциклопропил; и

R₉ представляет собой метил.

30 В варианте осуществления 5b предусмотрены соединения или их агрохимически приемлемая соль, стереоизомер, энантиомер, таутомер или N-оксид в соответствии с вариантом осуществления 1, где

A представляет собой N;

R₁ представляет собой этил;

R₈ представляет собой 1-циано-1-метилэтокси, 1-циано-1-метилэтил или 1-цианоциклопропил; и

R₉ представляет собой метил.

5

В варианте осуществления 5с предусмотрены соединения или их агрохимически приемлемая соль, стереоизомер, энантиомер, таутомер или N-оксид в соответствии с вариантом осуществления 1, где

A представляет собой CH;

10 R₁ представляет собой этил;

R₈ представляет собой 1-циано-1-метилэтокси, 1-циано-1-метилэтил или 1-цианоциклопропил; и

R₉ представляет собой метил.

15 В варианте осуществления 6а предусмотрены соединения или их агрохимически приемлемая соль, стереоизомер, энантиомер, таутомер или N-оксид в соответствии с вариантом осуществления 1, где

Q представляет собой радикал, выбранный из группы, состоящей из формул Q₁ - Q₅, где стрелка обозначает точку присоединения к кольцу, содержащему радикал A;

20 и где

R₂ представляет собой C₁-C₂галогеналкил, C₁-C₂галогеналкилсульфанил, C₁-C₂галогеналкилсульфинил или C₁-C₂галогеналкилсульфонил;

X₁ представляет собой кислород или NCH₃;

R₃ представляет собой C₁-C₂алкил;

25 R₄ представляет собой C₁-C₂алкил, C₁-C₂галогеналкил, C₁-C₂алкокси или циклопропил; и

G₁ и G₂ независимо друг от друга представляют собой N или CH.

30 В варианте осуществления 6b предусмотрены соединения или их агрохимически приемлемая соль, стереоизомер, энантиомер, таутомер или N-оксид в соответствии с вариантом осуществления 1, где

Q представляет собой радикал, выбранный из группы, состоящей из формул Q₁ - Q₅, где стрелка обозначает точку присоединения к кольцу, содержащему радикал A;

и где

R_2 представляет собой C_1 - C_2 галогеналкил или C_1 - C_2 галогеналкилсульфанил;

X_1 представляет собой NCH_3 ;

R_3 представляет собой C_1 - C_2 алкил;

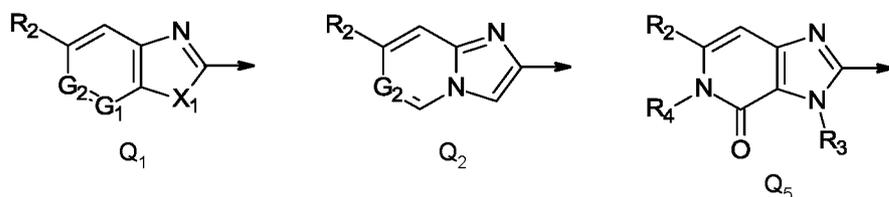
5 R_4 представляет собой C_1 - C_2 алкил, C_1 - C_2 алкокси или циклопропил; и

G_1 и G_2 независимо друг от друга представляют собой N или CH.

В варианте осуществления 7 предусмотрены соединения или их агрохимически приемлемая соль, стереоизомер, энантиомер, таутомер или N-оксид в соответствии с вариантом осуществления 1, где

10

Q представляет собой радикал, выбранный из Q_1 , Q_2 и Q_5 ,



где стрелка обозначает точку присоединения к кольцу, содержащему радикал A;

и где

15 R_2 представляет собой C_1 - C_2 фторалкил, трифторметилсульфанил, трифторметилсульфинил, трифторметилсульфонил, дифторметилсульфанил, дифторметилсульфинил или дифторметилсульфонил;

X_1 представляет собой NCH_3 ;

R_3 представляет собой метил;

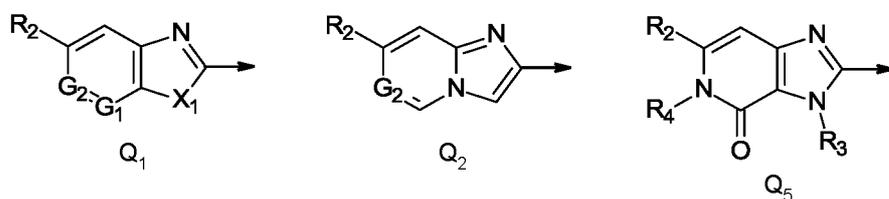
20 R_4 представляет собой метил, этил, метокси или циклопропил; и

G_1 и G_2 независимо друг от друга представляют собой N или CH.

В варианте осуществления 8a предусмотрены соединения или их агрохимически приемлемая соль, стереоизомер, энантиомер, таутомер или N-оксид в соответствии с вариантом осуществления 1, где

25

Q представляет собой радикал, выбранный из Q_1 , Q_2 и Q_5 ,



где стрелка обозначает точку присоединения к кольцу, содержащему радикал А;

и где

R_2 представляет собой трифторметил, пентафторэтил, трифторметилсульфанил, трифторметилсульфинил или трифторметилсульфонил;

5 X_1 представляет собой NCH_3 ;

R_3 представляет собой метил;

R_4 представляет собой этил, метокси или циклопропил;

если Q представляет собой Q_1 , то G_1 представляет собой N, и G_2 представляет собой CH, или G_1 представляет собой CH, и G_2 представляет собой N, или одновременно G_1 и

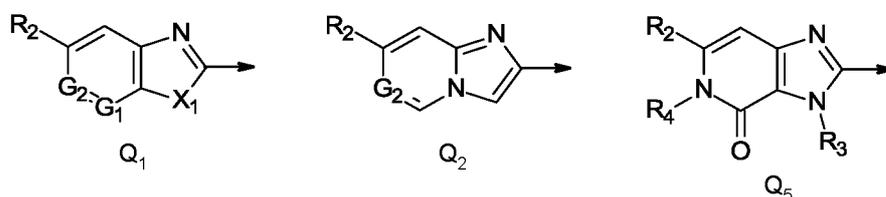
10 G_2 представляют собой N; и

если Q представляет собой Q_2 , то G_2 представляет собой CH или N.

В варианте осуществления 8b предусмотрены соединения или их агрохимически приемлемая соль, стереоизомер, энантиомер, таутомер или N-оксид в соответствии с

15 вариантом осуществления 1, где

Q представляет собой радикал, выбранный из Q_1 , Q_2 и Q_5 ,



где стрелка обозначает точку присоединения к кольцу, содержащему радикал А;

и где

20 R_2 представляет собой трифторметил, пентафторэтил или трифторметилсульфанил;

X_1 представляет собой NCH_3 ;

R_3 представляет собой метил;

R_4 представляет собой этил, метокси или циклопропил;

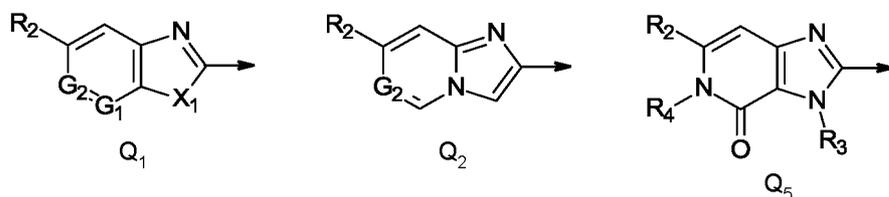
если Q представляет собой Q_1 , то G_1 представляет собой N, и G_2 представляет собой CH, или G_1 представляет собой CH, и G_2 представляет собой N, или одновременно G_1 и

25 G_2 представляют собой N; и

если Q представляет собой Q_2 , то G_2 представляет собой CH или N.

В варианте осуществления 8с предусмотрены соединения или их агрохимически приемлемая соль, стереоизомер, энантиомер, таутомер или N-оксид в соответствии с вариантом осуществления 1, где

Q представляет собой радикал, выбранный из Q₁, Q₂ и Q₅,



5 где стрелка обозначает точку присоединения к кольцу, содержащему радикал A;

и где

R₂ представляет собой трифторметил или трифторметилсульфанил;

X₁ представляет собой NCH₃;

10 R₃ представляет собой метил;

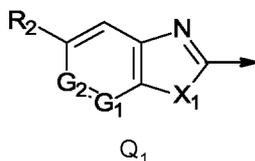
R₄ представляет собой этил, метокси или циклопропил;

если Q представляет собой Q₁, то G₁ представляет собой N, и G₂ представляет собой CH, или G₁ представляет собой CH, и G₂ представляет собой N, или одновременно G₁ и G₂ представляют собой N; и

15 если Q представляет собой Q₂, то G₂ представляет собой CH или N.

В варианте осуществления 9а предусмотрены соединения или их агрохимически приемлемая соль, стереоизомер, энантиомер, таутомер или N-оксид в соответствии с вариантом осуществления 1, где

20 Q представляет собой радикал Q₁,



где стрелка обозначает точку присоединения к кольцу, содержащему радикал A;

и где

R₂ представляет собой трифторметил, пентафторэтил, трифторметилсульфанил, трифторметилсульфинил или трифторметилсульфонил;

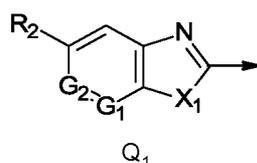
25

X₁ представляет собой NCH₃; и

G_1 представляет собой N, и G_2 представляет собой CH, или G_1 представляет собой CH, и G_2 представляет собой N, или одновременно G_1 и G_2 представляют собой N.

5 В варианте осуществления 9b предусмотрены соединения или их агрохимически приемлемая соль, стереоизомер, энантиомер, таутомер или N-оксид в соответствии с вариантом осуществления 1, где

Q представляет собой радикал Q_1 ,



где стрелка обозначает точку присоединения к кольцу, содержащему радикал A;

10 и где

R_2 представляет собой трифторметил, пентафторэтил или трифторметилсульфанил;

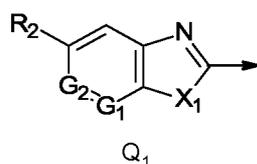
X_1 представляет собой NCH_3 ; и

G_1 представляет собой N, и G_2 представляет собой CH, или G_1 представляет собой CH, и G_2 представляет собой N, или одновременно G_1 и G_2 представляют собой N.

15

В варианте осуществления 9c предусмотрены соединения или их агрохимически приемлемая соль, стереоизомер, энантиомер, таутомер или N-оксид в соответствии с вариантом осуществления 1, где

Q представляет собой радикал Q_1 ,



20

где стрелка обозначает точку присоединения к кольцу, содержащему радикал A;

и где

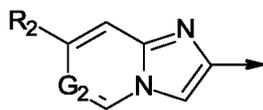
R_2 представляет собой трифторметил;

X_1 представляет собой NCH_3 ; и

25 G_1 представляет собой N, и G_2 представляет собой CH, или G_1 представляет собой CH, и G_2 представляет собой N, или одновременно G_1 и G_2 представляют собой N.

В варианте осуществления 10a предусмотрены соединения или их агрохимически приемлемая соль, стереоизомер, энантиомер, таутомер или N-оксид в соответствии с вариантом осуществления 1, где

Q представляет собой радикал Q₂,



5

Q₂

где стрелка обозначает точку присоединения к кольцу, содержащему радикал A;

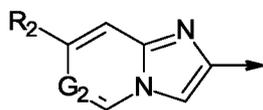
и где

R₂ представляет собой трифторметил, пентафторэтил, трифторметилсульфанил, трифторметилсульфинил или трифторметилсульфонил; и

10 G₂ представляет собой СН или N.

В варианте осуществления 10b предусмотрены соединения или их агрохимически приемлемая соль, стереоизомер, энантиомер, таутомер или N-оксид в соответствии с вариантом осуществления 1, где

15 Q представляет собой радикал Q₂,

Q₂

где стрелка обозначает точку присоединения к кольцу, содержащему радикал A;

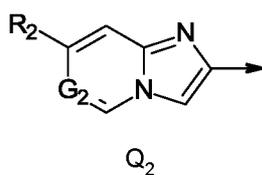
и где

R₂ представляет собой трифторметил, пентафторэтил или трифторметилсульфанил; и

20 G₂ представляет собой СН или N.

В варианте осуществления 10c предусмотрены соединения или их агрохимически приемлемая соль, стереоизомер, энантиомер, таутомер или N-оксид в соответствии с вариантом осуществления 1, где

25 Q представляет собой радикал Q₂,



где стрелка обозначает точку присоединения к кольцу, содержащему радикал A;

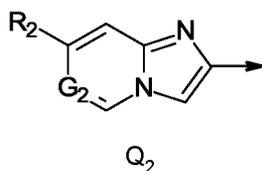
и где

R₂ представляет собой трифторметил или трифторметилсульфанил; и

5 G₂ представляет собой СН или N.

В варианте осуществления 10d предусмотрены соединения или их агрохимически приемлемая соль, стереоизомер, энантиомер, таутомер или N-оксид в соответствии с вариантом осуществления 1, где

10 Q представляет собой радикал Q₂,



где стрелка обозначает точку присоединения к кольцу, содержащему радикал A;

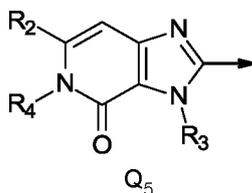
и где

R₂ представляет собой трифторметил; и

15 G₂ представляет собой СН или N.

В варианте осуществления 11a предусмотрены соединения или их агрохимически приемлемая соль, стереоизомер, энантиомер, таутомер или N-оксид в соответствии с вариантом осуществления 1, где

20 Q представляет собой радикал Q₅,



где стрелка обозначает точку присоединения к кольцу, содержащему радикал A;

и где

R₂ представляет собой трифторметил, пентафторэтил, трифторметилсульфанил, трифторметилсульфинил или трифторметилсульфонил;

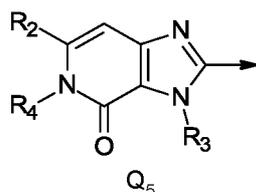
25

R₃ представляет собой метил; и

R₄ представляет собой этил, метокси или циклопропил.

5 В варианте осуществления 11b предусмотрены соединения или их агрохимически приемлемая соль, стереоизомер, энантиомер, таутомер или N-оксид в соответствии с вариантом осуществления 1, где

Q представляет собой радикал Q₅,



где стрелка обозначает точку присоединения к кольцу, содержащему радикал A;

10 и где

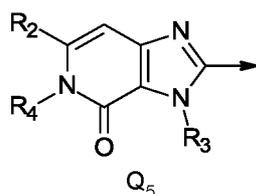
R₂ представляет собой трифторметил, пентафторэтил или трифторметилсульфанил;

R₃ представляет собой метил; и

R₄ представляет собой этил, метокси или циклопропил.

15 В варианте осуществления 11c предусмотрены соединения или их агрохимически приемлемая соль, стереоизомер, энантиомер, таутомер или N-оксид в соответствии с вариантом осуществления 1, где

Q представляет собой радикал Q₅,



20 где стрелка обозначает точку присоединения к кольцу, содержащему радикал A;

и где

R₂ представляет собой трифторметил;

R₃ представляет собой метил; и

R₄ представляет собой этил, метокси или циклопропил.

25

В варианте осуществления 12 предусмотрены соединения или их агрохимически приемлемая соль, стереоизомер, энантиомер, таутомер или N-оксид в соответствии с вариантом осуществления 1, где

A представляет собой СН или N;

5 R₁ представляет собой этил, пропил или изопропил;

R₈ представляет собой цианоизопропокс, цианоизопропил или цианоциклопропил;

R₉ представляет собой водород, метил или этил;

Q представляет собой радикал, выбранный из группы, состоящей из формул Q₁ - Q₅, где стрелка обозначает точку присоединения к кольцу, содержащему радикал A;

10 и где

R₂ представляет собой C₁-C₂галогеналкил, C₁-C₂галогеналкилсульфанил, C₁-C₂галогеналкилсульфинил или C₁-C₂галогеналкилсульфонил;

X₁ представляет собой кислород или NCH₃;

R₃ представляет собой C₁-C₂алкил;

15 R₄ представляет собой C₁-C₂алкил, C₁-C₂галогеналкил, C₁-C₂алкокси или циклопропил;

и

G₁ и G₂ независимо друг от друга представляют собой N или СН.

В варианте осуществления 13 предусмотрены соединения или их агрохимически приемлемая соль, стереоизомер, энантиомер, таутомер или N-оксид в соответствии с

20 вариантом осуществления 1, где

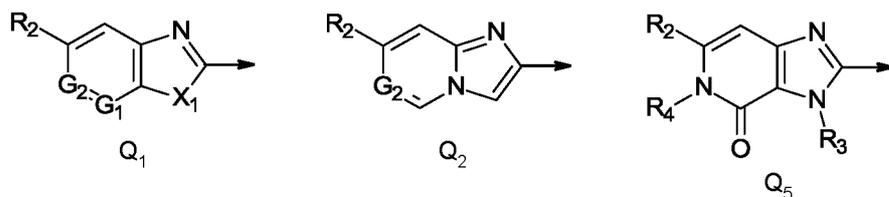
A представляет собой СН или N;

R₁ представляет собой этил;

R₈ представляет собой цианоизопропокс, цианоизопропил или цианоциклопропил;

25 R₉ представляет собой водород или метил;

Q представляет собой радикал, выбранный из Q₁, Q₂ и Q₅,



где стрелка обозначает точку присоединения к кольцу, содержащему радикал A;

и где

R_2 представляет собой C_1 - C_2 фторалкил, трифторметилсульфанил, трифторметилсульфинил, трифторметилсульфонил, дифторметилсульфанил, дифторметилсульфинил или дифторметилсульфонил;

X_1 представляет собой NCH_3 ;

5 R_3 представляет собой метил;

R_4 представляет собой метил, этил, метокси или циклопропил; и

G_1 и G_2 независимо друг от друга представляют собой N или CH.

10 В варианте осуществления 14 предусмотрены соединения или их агрохимически приемлемая соль, стереоизомер, энантиомер, таутомер или N-оксид в соответствии с вариантом осуществления 1, где

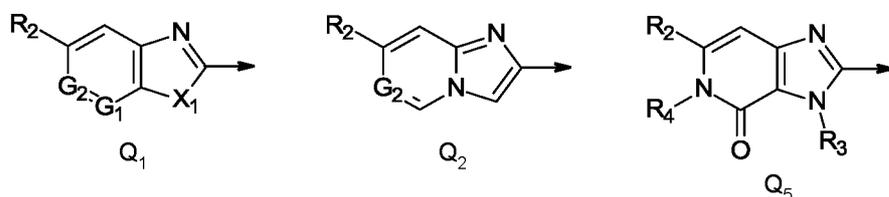
A представляет собой CH или N;

R_1 представляет собой этил;

15 R_8 представляет собой 1-циано-1-метилэтокси, 1-циано-1-метилэтил или 1-цианоциклопропил;

R_9 представляет собой водород или метил;

Q представляет собой радикал, выбранный из Q_1 , Q_2 и Q_5 ,



где стрелка обозначает точку присоединения к кольцу, содержащему радикал A;

20 и где

R_2 представляет собой C_1 - C_2 фторалкил, трифторметилсульфанил, трифторметилсульфинил, трифторметилсульфонил, дифторметилсульфанил, дифторметилсульфинил или дифторметилсульфонил;

X_1 представляет собой NCH_3 ;

25 R_3 представляет собой метил;

R_4 представляет собой метил, этил, метокси или циклопропил; и

G_1 и G_2 независимо друг от друга представляют собой N или CH.

В варианте осуществления 15a предусмотрены соединения или их агрохимически приемлемая соль, стереоизомер, энантиомер, таутомер или N-оксид в соответствии с вариантом осуществления 1, где

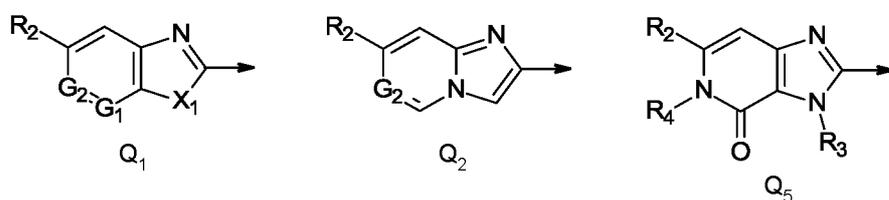
A представляет собой N;

5 R₁ представляет собой этил;

R₈ представляет собой 1-циано-1-метилэтокси, 1-циано-1-метилэтил или 1-цианоциклопропил;

R₉ представляет собой водород или метил;

Q представляет собой радикал, выбранный из Q₁, Q₂ и Q₅,



10

где стрелка обозначает точку присоединения к кольцу, содержащему радикал A;

и где

R₂ представляет собой трифторметил, пентафторэтил, трифторметилсульфанил, трифторметилсульфинил или трифторметилсульфонил;

15 X₁ представляет собой NCH₃;

R₃ представляет собой метил;

R₄ представляет собой этил, метокси или циклопропил;

если Q представляет собой Q₁, то G₁ представляет собой N, и G₂ представляет собой CH, или G₁ представляет собой CH, и G₂ представляет собой N, или одновременно G₁ и

20 G₂ представляют собой N; и

если Q представляет собой Q₂, то G₂ представляет собой CH или N.

В варианте осуществления 15b предусмотрены соединения или их агрохимически приемлемая соль, стереоизомер, энантиомер, таутомер или N-оксид в соответствии с вариантом осуществления 1, где

25

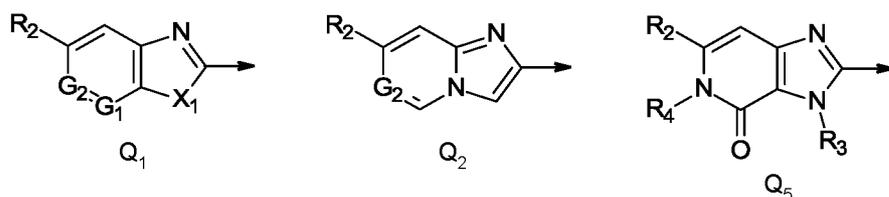
A представляет собой CH;

R₁ представляет собой этил;

R₈ представляет собой 1-циано-1-метилэтокси, 1-циано-1-метилэтил или 1-цианоциклопропил;

30 R₉ представляет собой водород или метил;

Q представляет собой радикал, выбранный из Q₁, Q₂ и Q₅,



где стрелка обозначает точку присоединения к кольцу, содержащему радикал А;

и где

- 5 R₂ представляет собой трифторметил, пентафторэтил, трифторметилсульфанил, трифторметилсульфинил или трифторметилсульфонил;
 X₁ представляет собой NCH₃;
 R₃ представляет собой метил;
 R₄ представляет собой этил, метокси или циклопропил;
- 10 если Q представляет собой Q₁, то G₁ представляет собой N, и G₂ представляет собой СН, или G₁ представляет собой СН, и G₂ представляет собой N, или одновременно G₁ и G₂ представляют собой N; и
 если Q представляет собой Q₂, то G₂ представляет собой СН или N.

- 15 В варианте осуществления 16а предусмотрены соединения или их агрохимически приемлемая соль, стереоизомер, энантиомер, таутомер или N-оксид в соответствии с вариантом осуществления 1, где

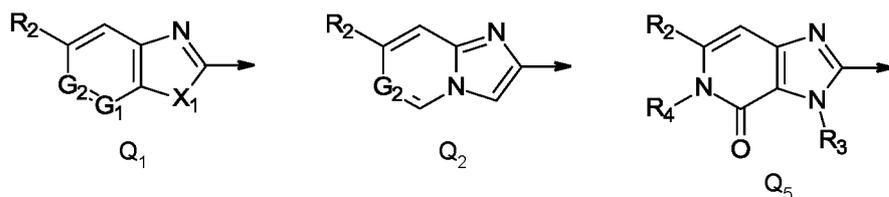
А представляет собой N;

R₁ представляет собой этил;

- 20 R₈ представляет собой 1-циано-1-метилэтокси, 1-циано-1-метилэтил или 1-цианоциклопропил;

R₉ представляет собой водород или метил;

Q представляет собой радикал, выбранный из Q₁, Q₂ и Q₅,



- 25 где стрелка обозначает точку присоединения к кольцу, содержащему радикал А;

и где

R₂ представляет собой трифторметил, пентафторэтил или трифторметилсульфанил;

X_1 представляет собой NCH_3 ;

R_3 представляет собой метил;

R_4 представляет собой этил, метокси или циклопропил;

- если Q представляет собой Q_1 , то G_1 представляет собой N , и G_2 представляет собой CH , или G_1 представляет собой CH , и G_2 представляет собой N , или одновременно G_1 и G_2 представляют собой N ; и
 если Q представляет собой Q_2 , то G_2 представляет собой CH или N .

В варианте осуществления 16b предусмотрены соединения или их агрохимически приемлемая соль, стереоизомер, энантиомер, таутомер или N -оксид в соответствии с вариантом осуществления 1, где

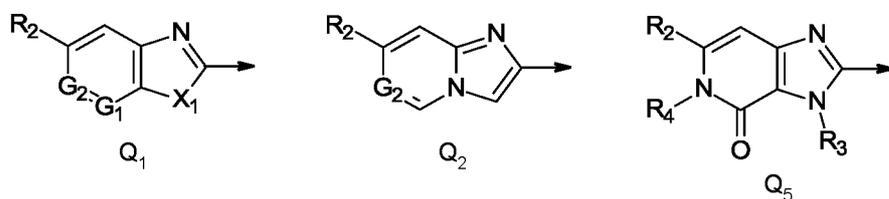
A представляет собой CH ;

R_1 представляет собой этил;

R_8 представляет собой 1-циано-1-метилэтокси, 1-циано-1-метилэтил или 1-цианоциклопропил;

R_9 представляет собой водород или метил;

Q представляет собой радикал, выбранный из Q_1 , Q_2 и Q_5 ,



где стрелка обозначает точку присоединения к кольцу, содержащему радикал A ;

и где

R_2 представляет собой трифторметил, пентафторэтил или трифторметилсульфанил;

X_1 представляет собой NCH_3 ;

R_3 представляет собой метил;

R_4 представляет собой этил, метокси или циклопропил;

- если Q представляет собой Q_1 , то G_1 представляет собой N , и G_2 представляет собой CH , или G_1 представляет собой CH , и G_2 представляет собой N , или одновременно G_1 и G_2 представляют собой N ; и
 если Q представляет собой Q_2 , то G_2 представляет собой CH или N .

В варианте осуществления 17a предусмотрены соединения или их агрохимически приемлемая соль, стереоизомер, энантиомер, таутомер или N-оксид в соответствии с вариантом осуществления 1, где

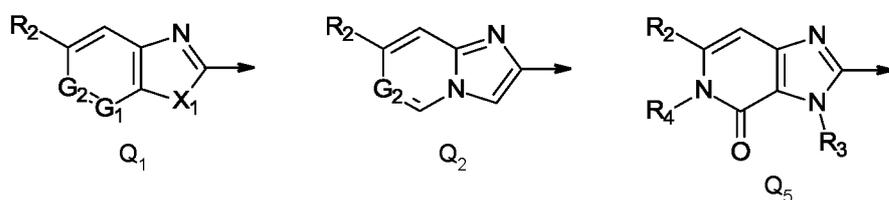
A представляет собой N;

5 R₁ представляет собой этил;

R₈ представляет собой 1-циано-1-метилэтокси, 1-циано-1-метилэтил или 1-цианоциклопропил;

R₉ представляет собой водород;

Q представляет собой радикал, выбранный из Q₁, Q₂ и Q₅,



10

где стрелка обозначает точку присоединения к кольцу, содержащему радикал A, и где

R₂ представляет собой трифторметил или трифторметилсульфанил;

X₁ представляет собой NCH₃;

15 R₃ представляет собой метил;

R₄ представляет собой этил, метокси или циклопропил;

если Q представляет собой Q₁, то G₁ представляет собой N, и G₂ представляет собой CH, или G₁ представляет собой CH, и G₂ представляет собой N, или одновременно G₁ и G₂ представляют собой N; и

20 если Q представляет собой Q₂, то G₂ представляет собой CH или N.

В варианте осуществления 17b предусмотрены соединения или их агрохимически приемлемая соль, стереоизомер, энантиомер, таутомер или N-оксид в соответствии с вариантом осуществления 1, где

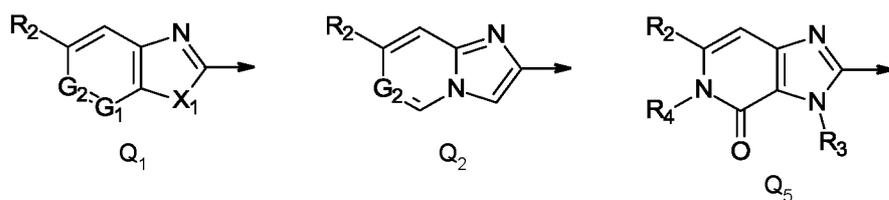
25 A представляет собой CH;

R₁ представляет собой этил;

R₈ представляет собой 1-циано-1-метилэтокси, 1-циано-1-метилэтил или 1-цианоциклопропил;

R₉ представляет собой водород;

30 Q представляет собой радикал, выбранный из Q₁, Q₂ и Q₅,



где стрелка обозначает точку присоединения к кольцу, содержащему радикал А;

и где

R_2 представляет собой трифторметил или трифторметилсульфанил;

5 X_1 представляет собой NCH_3 ;

R_3 представляет собой метил;

R_4 представляет собой этил, метокси или циклопропил;

если Q представляет собой Q_1 , то G_1 представляет собой N, и G_2 представляет собой CH, или G_1 представляет собой CH, и G_2 представляет собой N, или одновременно G_1 и

10 G_2 представляют собой N; и

если Q представляет собой Q_2 , то G_2 представляет собой CH или N.

В варианте осуществления 18а предусмотрены соединения или их агрохимически приемлемая соль, стереоизомер, энантиомер, таутомер или N-оксид в соответствии с

15 вариантом осуществления 1, где

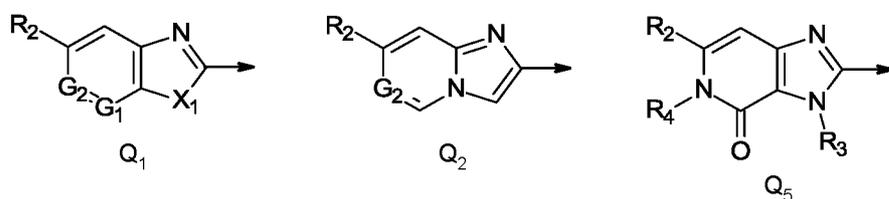
A представляет собой N;

R_1 представляет собой этил;

R_8 представляет собой 1-циано-1-метилэтокси, 1-циано-1-метилэтил или 1-цианоциклопропил;

20 R_9 представляет собой метил;

Q представляет собой радикал, выбранный из Q_1 , Q_2 и Q_5 ,



где стрелка обозначает точку присоединения к кольцу, содержащему радикал А;

и где

25 R_2 представляет собой трифторметил или трифторметилсульфанил;

X_1 представляет собой NCH_3 ;

R_3 представляет собой метил;

R_4 представляет собой этил, метокси или циклопропил;

если Q представляет собой Q_1 , то G_1 представляет собой N, и G_2 представляет собой CH, или G_1 представляет собой CH, и G_2 представляет собой N, или одновременно G_1 и G_2 представляют собой N; и

5 если Q представляет собой Q_2 , то G_2 представляет собой CH или N.

В варианте осуществления 18b предусмотрены соединения или их агрохимически приемлемая соль, стереоизомер, энантиомер, таутомер или N-оксид в соответствии с вариантом осуществления 1, где

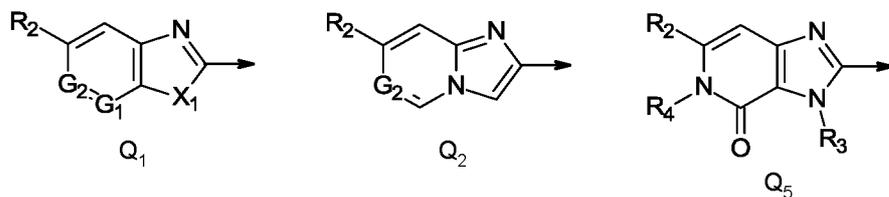
10 A представляет собой CH;

R_1 представляет собой этил;

R_8 представляет собой 1-циано-1-метилэтокси, 1-циано-1-метилэтил или 1-цианоциклопропил;

R_9 представляет собой метил;

15 Q представляет собой радикал, выбранный из Q_1 , Q_2 и Q_5 ,



где стрелка обозначает точку присоединения к кольцу, содержащему радикал A;

и где

R_2 представляет собой трифторметил или трифторметилсульфанил;

20 X_1 представляет собой NCH_3 ;

R_3 представляет собой метил;

R_4 представляет собой этил, метокси или циклопропил;

если Q представляет собой Q_1 , то G_1 представляет собой N, и G_2 представляет собой CH, или G_1 представляет собой CH, и G_2 представляет собой N, или одновременно G_1 и

25 G_2 представляют собой N; и

если Q представляет собой Q_2 , то G_2 представляет собой CH или N.

В варианте осуществления 19a предусмотрены соединения или их агрохимически приемлемая соль, стереоизомер, энантиомер, таутомер или N-оксид в соответствии с

30 вариантом осуществления 1, где

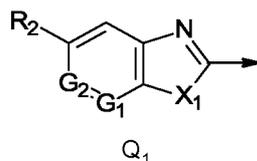
A представляет собой N или CH;

R₁ представляет собой этил;

R₈ представляет собой 1-циано-1-метилэтокси, 1-циано-1-метилэтил или 1-цианоциклопропил;

5 R₉ представляет собой водород или метил;

Q представляет собой радикал Q₁,



где стрелка обозначает точку присоединения к кольцу, содержащему радикал A;

и где

10 R₂ представляет собой трифторметил;

X₁ представляет собой NCH₃; и

G₁ представляет собой N, и G₂ представляет собой CH, или G₁ представляет собой CH, и G₂ представляет собой N, или одновременно G₁ и G₂ представляют собой N.

15 В варианте осуществления 19b предусмотрены соединения или их агрохимически приемлемая соль, стереоизомер, энантиомер, таутомер или N-оксид в соответствии с вариантом осуществления 1, где

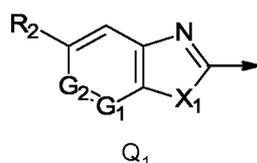
A представляет собой N или CH;

R₁ представляет собой этил;

20 R₈ представляет собой 1-циано-1-метилэтокси, 1-циано-1-метилэтил или 1-цианоциклопропил;

R₉ представляет собой водород или метил;

Q представляет собой радикал Q₁,



25 где стрелка обозначает точку присоединения к кольцу, содержащему радикал A;

и где

R₂ представляет собой трифторметил;

X₁ представляет собой NCH₃; и

G_1 представляет собой N, и G_2 представляет собой CH, или G_1 представляет собой CH, и G_2 представляет собой N.

5 В варианте осуществления 19с предусмотрены соединения или их агрохимически приемлемая соль, стереоизомер, энантиомер, таутомер или N-оксид в соответствии с вариантом осуществления 1, где

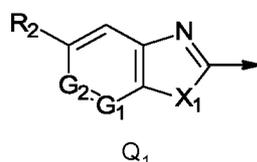
A представляет собой N или CH;

R_1 представляет собой этил;

R_8 представляет собой 1-циано-1-метилэтокси или 1-цианоциклопропил;

10 R_9 представляет собой водород или метил;

Q представляет собой радикал Q_1 ,



где стрелка обозначает точку присоединения к кольцу, содержащему радикал A; и где

15 R_2 представляет собой трифторметил;

X_1 представляет собой NCH_3 ; и

G_1 представляет собой N, и G_2 представляет собой CH, или G_1 представляет собой CH, и G_2 представляет собой N, или одновременно G_1 и G_2 представляют собой N.

20 В варианте осуществления 20а предусмотрены соединения или их агрохимически приемлемая соль, стереоизомер, энантиомер, таутомер или N-оксид в соответствии с вариантом осуществления 1, где

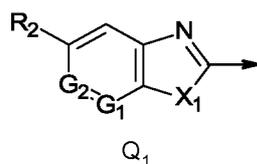
A представляет собой N;

R_1 представляет собой этил;

25 R_8 представляет собой 1-циано-1-метилэтокси, 1-циано-1-метилэтил или 1-цианоциклопропил;

R_9 представляет собой водород;

Q представляет собой радикал Q_1 ,



где стрелка обозначает точку присоединения к кольцу, содержащему радикал А;

и где

R₂ представляет собой трифторметил;

5 X₁ представляет собой NCH₃; и

G₁ представляет собой N, и G₂ представляет собой СН, или G₁ представляет собой СН, и G₂ представляет собой N, или одновременно G₁ и G₂ представляют собой N.

В варианте осуществления 20b предусмотрены соединения или их агрохимически приемлемая соль, стереоизомер, энантиомер, таутомер или N-оксид в соответствии с вариантом осуществления 1, где

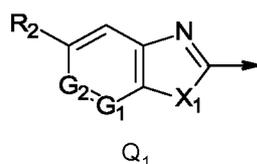
А представляет собой N;

R₁ представляет собой этил;

15 R₈ представляет собой 1-циано-1-метилэтокси, 1-циано-1-метилэтил или 1-цианоциклопропил;

R₉ представляет собой водород;

Q представляет собой радикал Q₁,



где стрелка обозначает точку присоединения к кольцу, содержащему радикал А;

20 и где

R₂ представляет собой трифторметил;

X₁ представляет собой NCH₃; и

G₁ представляет собой N, и G₂ представляет собой СН, или G₁ представляет собой СН, и G₂ представляет собой N.

25

В варианте осуществления 20с предусмотрены соединения или их агрохимически приемлемая соль, стереоизомер, энантиомер, таутомер или N-оксид в соответствии с вариантом осуществления 1, где

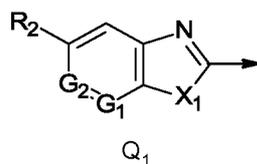
A представляет собой N;

R₁ представляет собой этил;

R₈ представляет собой 1-циано-1-метилэтокси или 1-цианоциклопропил;

R₉ представляет собой водород;

5 Q представляет собой радикал Q₁,



где стрелка обозначает точку присоединения к кольцу, содержащему радикал A;

и где

R₂ представляет собой трифторметил;

10 X₁ представляет собой NCH₃; и

G₁ представляет собой N, и G₂ представляет собой CH, или G₁ представляет собой CH,

и G₂ представляет собой N, или одновременно G₁ и G₂ представляют собой N.

В варианте осуществления 21a предусмотрены соединения или их агрохимически приемлемая соль, стереоизомер, энантиомер, таутомер или N-оксид в соответствии с вариантом осуществления 1, где

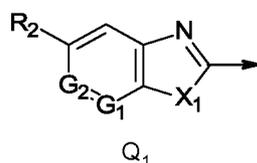
15 A представляет собой N;

R₁ представляет собой этил;

20 R₈ представляет собой 1-циано-1-метилэтокси, 1-циано-1-метилэтил или 1-цианоциклопропил;

R₉ представляет собой метил;

Q представляет собой радикал Q₁,



где стрелка обозначает точку присоединения к кольцу, содержащему радикал A;

25 и где

R₂ представляет собой трифторметил;

X₁ представляет собой NCH₃; и

G_1 представляет собой N, и G_2 представляет собой CH, или G_1 представляет собой CH, и G_2 представляет собой N, или одновременно G_1 и G_2 представляют собой N.

В варианте осуществления 21b предусмотрены соединения или их агрохимически приемлемая соль, стереоизомер, энантиомер, таутомер или N-оксид в соответствии с вариантом осуществления 1, где

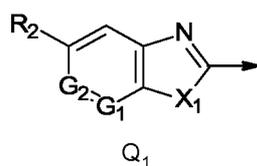
A представляет собой N;

R_1 представляет собой этил;

R_8 представляет собой 1-циано-1-метилэтокси, 1-циано-1-метилэтил или 1-цианоциклопропил;

R_9 представляет собой метил;

Q представляет собой радикал Q_1 ,



где стрелка обозначает точку присоединения к кольцу, содержащему радикал A;

и где

R_2 представляет собой трифторметил;

X_1 представляет собой NCH_3 ; и

G_1 представляет собой N, и G_2 представляет собой CH, или G_1 представляет собой CH, и G_2 представляет собой N.

20

В варианте осуществления 21c предусмотрены соединения или их агрохимически приемлемая соль, стереоизомер, энантиомер, таутомер или N-оксид в соответствии с вариантом осуществления 1, где

A представляет собой N;

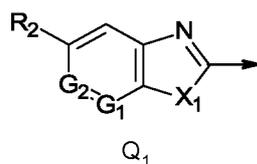
R_1 представляет собой этил;

R_8 представляет собой 1-циано-1-метилэтокси;

R_9 представляет собой метил;

Q представляет собой радикал Q_1 ,

25



где стрелка обозначает точку присоединения к кольцу, содержащему радикал А;

и где

R₂ представляет собой трифторметил;

5 X₁ представляет собой NCH₃; и

G₁ представляет собой N, и G₂ представляет собой СН, или G₁ представляет собой СН,
и G₂ представляет собой N.

В варианте осуществления 22а предусмотрены соединения или их агрохимически
10 приемлемая соль, стереоизомер, энантиомер, таутомер или N-оксид в соответствии с
вариантом осуществления 1, где

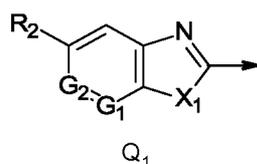
А представляет собой СН;

R₁ представляет собой этил;

15 R₈ представляет собой 1-циано-1-метилэтокси, 1-циано-1-метилэтил или 1-
цианоциклопропил;

R₉ представляет собой водород;

Q представляет собой радикал Q₁,



где стрелка обозначает точку присоединения к кольцу, содержащему радикал А;

20 и где

R₂ представляет собой трифторметил;

X₁ представляет собой NCH₃; и

G₁ представляет собой N, и G₂ представляет собой СН, или G₁ представляет собой СН,
и G₂ представляет собой N, или одновременно G₁ и G₂ представляют собой N.

25

В варианте осуществления 22b предусмотрены соединения или их агрохимически
приемлемая соль, стереоизомер, энантиомер, таутомер или N-оксид в соответствии с
вариантом осуществления 1, где

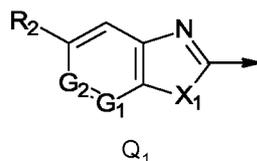
A представляет собой CH;

R₁ представляет собой этил;

R₈ представляет собой 1-циано-1-метилэтокси, 1-циано-1-метилэтил или 1-цианоциклопропил;

5 R₉ представляет собой водород;

Q представляет собой радикал Q₁,



где стрелка обозначает точку присоединения к кольцу, содержащему радикал A;

и где

10 R₂ представляет собой трифторметил;

X₁ представляет собой NCH₃; и

G₁ представляет собой N, и G₂ представляет собой CH, или G₁ представляет собой CH, и G₂ представляет собой N.

15 В варианте осуществления 22с предусмотрены соединения или их агрохимически приемлемая соль, стереоизомер, энантиомер, таутомер или N-оксид в соответствии с вариантом осуществления 1, где

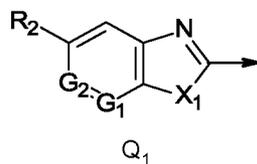
A представляет собой CH;

R₁ представляет собой этил;

20 R₈ представляет собой 1-цианоциклопропил;

R₉ представляет собой водород;

Q представляет собой радикал Q₁,



где стрелка обозначает точку присоединения к кольцу, содержащему радикал A;

25 и где

R₂ представляет собой трифторметил;

X₁ представляет собой NCH₃; и

G_1 представляет собой N, и G_2 представляет собой СН, или G_1 представляет собой СН, и G_2 представляет собой N.

5 В варианте осуществления 23а предусмотрены соединения или их агрохимически приемлемая соль, стереоизомер, энантиомер, таутомер или N-оксид в соответствии с вариантом осуществления 1, где

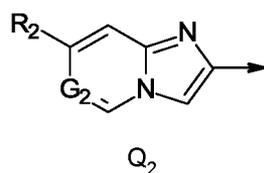
A представляет собой N;

R_1 представляет собой этил;

10 R_8 представляет собой 1-циано-1-метилэтокси, 1-циано-1-метилэтил или 1-цианоциклопропил;

R_9 представляет собой водород;

Q представляет собой радикал Q_2 ,



где стрелка обозначает точку присоединения к кольцу, содержащему радикал A;

15 и где

R_2 представляет собой трифторметил, пентафторэтил, трифторметилсульфанил, трифторметилсульфинил или трифторметилсульфонил; и

G_2 представляет собой СН или N.

20 В варианте осуществления 23b предусмотрены соединения или их агрохимически приемлемая соль, стереоизомер, энантиомер, таутомер или N-оксид в соответствии с вариантом осуществления 1, где

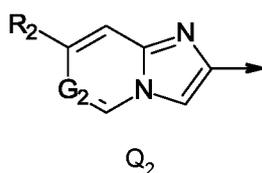
A представляет собой N;

R_1 представляет собой этил;

25 R_8 представляет собой 1-циано-1-метилэтокси, 1-циано-1-метилэтил или 1-цианоциклопропил;

R_9 представляет собой водород;

Q представляет собой радикал Q_2 ,



где стрелка обозначает точку присоединения к кольцу, содержащему радикал А;

и где

R_2 представляет собой трифторметил, пентафторэтил или трифторметилсульфанил; и

5 G_2 представляет собой СН или N.

В варианте осуществления 23с предусмотрены соединения или их агрохимически приемлемая соль, стереоизомер, энантиомер, таутомер или N-оксид в соответствии с вариантом осуществления 1, где

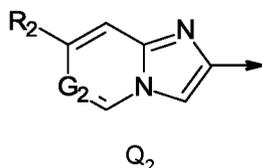
10 А представляет собой N;

R_1 представляет собой этил;

R_8 представляет собой 1-циано-1-метилэтокси, 1-циано-1-метилэтил или 1-цианоциклопропил;

R_9 представляет собой водород;

15 Q представляет собой радикал Q_2 ,



где стрелка обозначает точку присоединения к кольцу, содержащему радикал А;

и где

R_2 представляет собой трифторметил или трифторметилсульфанил; и

20 G_2 представляет собой СН или N.

В варианте осуществления 23d предусмотрены соединения или их агрохимически приемлемая соль, стереоизомер, энантиомер, таутомер или N-оксид в соответствии с вариантом осуществления 1, где

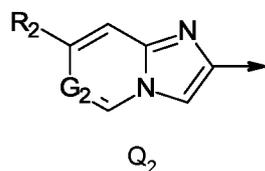
25 А представляет собой N;

R_1 представляет собой этил;

R_8 представляет собой 1-циано-1-метилэтокси, 1-циано-1-метилэтил или 1-цианоциклопропил;

R_9 представляет собой водород;

Q представляет собой радикал Q_2 ,



где стрелка обозначает точку присоединения к кольцу, содержащему радикал A;

5 и где

R_2 представляет собой трифторметил; и

G_2 представляет собой CH или N.

В варианте осуществления 23е предусмотрены соединения или их агрохимически приемлемая соль, стереоизомер, энантиомер, таутомер или N-оксид в соответствии с вариантом осуществления 1, где

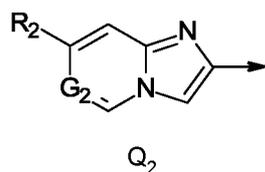
A представляет собой N;

R_1 представляет собой этил;

R_8 представляет собой 1-циано-1-метилэтокс;

15 R_9 представляет собой водород;

Q представляет собой радикал Q_2 ,



где стрелка обозначает точку присоединения к кольцу, содержащему радикал A;

и где

20 R_2 представляет собой трифторметил; и

G_2 представляет собой CH или N.

В варианте осуществления 24а предусмотрены соединения или их агрохимически приемлемая соль, стереоизомер, энантиомер, таутомер или N-оксид в соответствии с вариантом осуществления 1, где

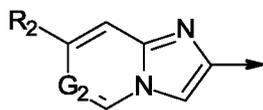
A представляет собой CH;

R_1 представляет собой этил;

R₈ представляет собой 1-циано-1-метилэтокси, 1-циано-1-метилэтил или 1-цианоциклопропил;

R₉ представляет собой водород;

Q представляет собой радикал Q₂,



5 где стрелка обозначает точку присоединения к кольцу, содержащему радикал А;
и где

R₂ представляет собой трифторметил или трифторметилсульфанил; и

G₂ представляет собой СН или N.

10 В варианте осуществления 24b предусмотрены соединения или их агрохимически приемлемая соль, стереоизомер, энантиомер, таутомер или N-оксид в соответствии с вариантом осуществления 1, где

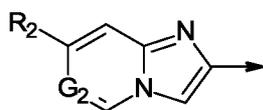
А представляет собой СН;

15 R₁ представляет собой этил;

R₈ представляет собой 1-циано-1-метилэтокси, 1-циано-1-метилэтил или 1-цианоциклопропил;

R₉ представляет собой водород;

Q представляет собой радикал Q₂,



20 где стрелка обозначает точку присоединения к кольцу, содержащему радикал А;
и где

R₂ представляет собой трифторметил; и

G₂ представляет собой СН или N.

25 В варианте осуществления 24c предусмотрены соединения или их агрохимически приемлемая соль, стереоизомер, энантиомер, таутомер или N-оксид в соответствии с вариантом осуществления 1, где

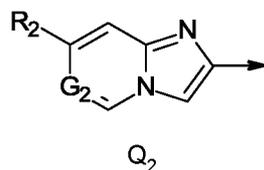
A представляет собой CH;

R₁ представляет собой этил;

R₈ представляет собой 1-циано-1-метилэтокси;

R₉ представляет собой водород;

5 Q представляет собой радикал Q₂,



где стрелка обозначает точку присоединения к кольцу, содержащему радикал A;

и где

R₂ представляет собой трифторметил; и

10 G₂ представляет собой CH или N.

В варианте осуществления 25a предусмотрены соединения или их агрохимически приемлемая соль, стереоизомер, энантиомер, таутомер или N-оксид в соответствии с вариантом осуществления 1, где

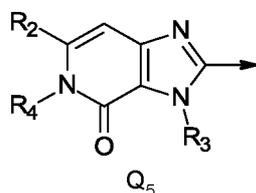
15 A представляет собой N;

R₁ представляет собой этил;

R₈ представляет собой 1-циано-1-метилэтокси, 1-циано-1-метилэтил или 1-цианоциклопропил;

R₉ представляет собой водород;

20 Q представляет собой радикал Q₅,



где стрелка обозначает точку присоединения к кольцу, содержащему радикал A;

и где

R₂ представляет собой трифторметил;

25 R₃ представляет собой метил; и

R₄ представляет собой этил, метокси или циклопропил.

В варианте осуществления 25b предусмотрены соединения или их агрохимически приемлемая соль, стереоизомер, энантиомер, таутомер или N-оксид в соответствии с вариантом осуществления 1, где

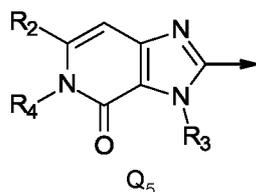
A представляет собой N;

5 R₁ представляет собой этил;

R₈ представляет собой 1-циано-1-метилэтокси или 1-цианоциклопропил;

R₉ представляет собой водород;

Q представляет собой радикал Q₅,



10 где стрелка обозначает точку присоединения к кольцу, содержащему радикал A;
и где

R₂ представляет собой трифторметил;

R₃ представляет собой метил; и

R₄ представляет собой этил, метокси или циклопропил.

15

В варианте осуществления 25c предусмотрены соединения или их агрохимически приемлемая соль, стереоизомер, энантиомер, таутомер или N-оксид в соответствии с вариантом осуществления 1, где

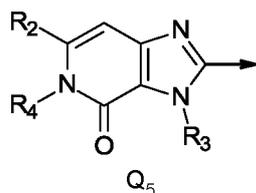
A представляет собой N;

20 R₁ представляет собой этил;

R₈ представляет собой 1-циано-1-метилэтокси;

R₉ представляет собой водород;

Q представляет собой радикал Q₅,



25 где стрелка обозначает точку присоединения к кольцу, содержащему радикал A;
и где

R₂ представляет собой трифторметил;

R_3 представляет собой метил; и

R_4 представляет собой этил или циклопропил.

В варианте осуществления 25d предусмотрены соединения или их агрохимически приемлемая соль, стереоизомер, энантиомер, таутомер или N-оксид в соответствии с вариантом осуществления 1, где

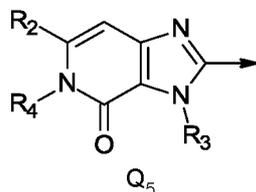
A представляет собой N;

R_1 представляет собой этил;

R_8 представляет собой 1-цианоциклопропил;

10 R_9 представляет собой водород;

Q представляет собой радикал Q_5 ,



где стрелка обозначает точку присоединения к кольцу, содержащему радикал A;

и где

15 R_2 представляет собой трифторметил;

R_3 представляет собой метил; и

R_4 представляет собой этил или метокси.

В варианте осуществления 26a предусмотрены соединения или их агрохимически приемлемая соль, стереоизомер, энантиомер, таутомер или N-оксид в соответствии с вариантом осуществления 1, где

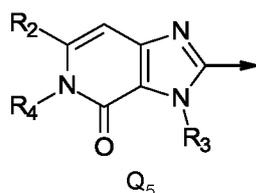
A представляет собой CH;

R_1 представляет собой этил;

25 R_8 представляет собой 1-циано-1-метилэтокси, 1-циано-1-метилэтил или 1-цианоциклопропил;

R_9 представляет собой водород;

Q представляет собой радикал Q_5 ,



где стрелка обозначает точку присоединения к кольцу, содержащему радикал А;

и где

R₂ представляет собой трифторметил;

5 R₃ представляет собой метил; и

R₄ представляет собой этил, метокси или циклопропил.

В варианте осуществления 26b предусмотрены соединения или их агрохимически приемлемая соль, стереоизомер, энантиомер, таутомер или N-оксид в соответствии с

10 вариантом осуществления 1, где

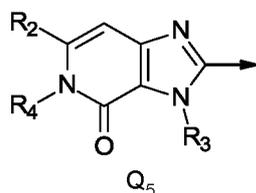
А представляет собой СН;

R₁ представляет собой этил;

R₈ представляет собой 1-циано-1-метилэтокси или 1-цианоциклопропил;

R₉ представляет собой водород;

15 Q представляет собой радикал Q₅,



где стрелка обозначает точку присоединения к кольцу, содержащему радикал А;

и где

R₂ представляет собой трифторметил;

20 R₃ представляет собой метил; и

R₄ представляет собой этил, метокси или циклопропил.

В варианте осуществления 27 предусмотрены соединения или их агрохимически приемлемая соль, стереоизомер, энантиомер, таутомер или N-оксид в соответствии с

25 любым из предыдущих вариантов осуществления 1-26b, где S* находится в R-конфигурации.

В варианте осуществления 28 предусмотрены соединения или их агрохимически приемлемая соль, стереоизомер, энантиомер, таутомер или N-оксид в соответствии с вариантом осуществления 27, в которых указанный S*-центр находится или в энантиомерно чистой, или в энантиомерно обогащенной форме, которая энантиомерно обогащена R-энантиомерным избытком (э. и.) (S*), составляющим по меньшей мере 40%, например, по меньшей мере 50%, 60%, 70% или 80%, предпочтительно по меньшей мере 90%, более предпочтительно по меньшей мере 95%, еще более предпочтительно по меньшей мере 98% и наиболее предпочтительно по меньшей мере 99%.

10

В варианте осуществления 29 предусмотрены соединения или их агрохимически приемлемая соль, стереоизомер, энантиомер, таутомер или N-оксид в соответствии с любым из предыдущих вариантов осуществления 1-26b, где S* находится в S-конфигурации.

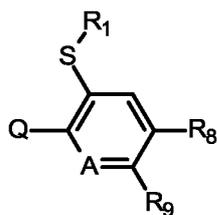
15

В варианте осуществления 30 предусмотрены соединения или их агрохимически приемлемая соль, стереоизомер, энантиомер, таутомер или N-оксид в соответствии с вариантом осуществления 29, в которых указанный S*-центр находится или в энантиомерно чистой, или в энантиомерно обогащенной форме, которая энантиомерно обогащена S-энантиомерным избытком (э. и.) (S*), составляющим по меньшей мере 40%, например, по меньшей мере 50%, 60%, 70% или 80%, предпочтительно по меньшей мере 90%, более предпочтительно по меньшей мере 95%, еще более предпочтительно по меньшей мере 98% и наиболее предпочтительно по меньшей мере 99%.

25

В варианте осуществления 31 предусмотрены соединения или их агрохимически приемлемая соль, стереоизомер, энантиомер, таутомер или N-оксид в соответствии с любым из предыдущих вариантов осуществления 1-30, или полученные, или получаемые с помощью способа, включающего: (A) осуществление стереоселективного окисления сульфанилового соединения формулы (II),

30



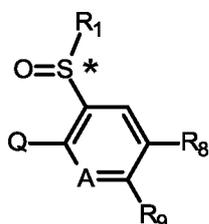
(II),

где Q, R₁, R₂, G₁, G₂, X₁, R₃, R₄, R₈, R₉ и A определены для формулы (I),

в присутствии окислителя, в присутствии металлического катализатора, в присутствии хирального лиганда, необязательно в присутствии подходящей добавки, в подходящем растворителе (или разбавителе)

5

с получением сульфинильного соединения формулы (III),



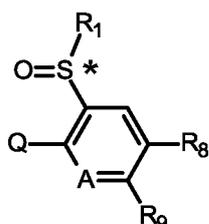
(III),

где Q, R₁, R₂, G₁, G₂, X₁, R₃, R₄, R₈, R₉ и A определены для формулы (I), и

где S* представляет собой стереогенный атом серы в R- или S-конфигурации, в которой указанный S*-центр находится или в энантимерно чистой или в энантимерно обогащенной форме; и

10

(B) осуществление реакции сульфинильного соединения формулы (III),



(III),

где Q, R₁, R₂, G₁, G₂, X₁, R₃, R₄, R₈, R₉ и A определены для формулы (I), и

где S* представляет собой стереогенный атом серы в R- или S-конфигурации, при этом указанный S*-центр находится или в энантимерно чистой, или в энантимерно обогащенной форме;

15

с иминирующим реагентом в присутствии катализатора, необязательно в присутствии подходящей добавки, в подходящем растворителе (или разбавителе)

20

с получением сульфоксиминового соединения формулы (I) стереоспецифическим способом. Предпочтительные определения и предпочтительные варианты

осуществления, связанные со способом получения соединений формулы (I), включающим стадии (A) и (B), условия реакций и соединения формулы (II) и (III), дополнительно описанные ниже, также применимы для данного варианта осуществления 31.

5

В варианте осуществления 31a предусмотрены соединения или их агрохимически приемлемая соль, стереоизомер, энантиомер, таутомер или N-оксид в соответствии с любым из вариантов осуществления 1-26b, предусматривающие соединения формулы I, которые представляют собой энантиомеры, которые элюируются первыми во время хирального разделения рацемата с помощью препаративной хроматографии с применением иммобилизованных хиральных фаз на основе амилозы (CHIRALPAK® IA, CHIRALPAK® IG) или на основе целлюлозы (CHIRALPAK® IC).

10

В варианте осуществления 31b предусмотрены соединения или их агрохимически приемлемая соль, стереоизомер, энантиомер, таутомер или N-оксид в соответствии с любым из вариантов осуществления 1-26b, предусматривающие соединения формулы I, которые представляют собой энантиомеры, которые элюируются первыми во время хирального разделения рацемата с помощью препаративной SFC (сверхкритической жидкостной хроматографии) с применением иммобилизованных хиральных фаз на основе амилозы (CHIRALPAK® IA, CHIRALPAK® IG) или на основе целлюлозы (CHIRALPAK® IC).

15
20

В варианте осуществления 31c предусмотрены соединения или их агрохимически приемлемая соль, стереоизомер, энантиомер, таутомер или N-оксид в соответствии с любым из вариантов осуществления 1-26b, предусматривающие соединения формулы I, которые представляют собой энантиомеры, которые элюируются первыми во время хирального разделения рацемата с помощью препаративной SFC с применением иммобилизованных хиральных фаз на основе амилозы (CHIRALPAK® IA, CHIRALPAK® IG) или на основе целлюлозы (CHIRALPAK® IC) и с применением сверхкритического CO₂ и спиртового соразтворителя, такого как предпочтительно метанол, этанол или изопропиловый спирт, в качестве подвижной фазы.

25
30

В варианте осуществления 32 предусмотрены соединения или их агрохимически приемлемая соль, стереоизомер, энантиомер, таутомер или N-оксид в соответствии с любым из вариантов осуществления 31a-31c или в энантиомерно чистой форме, или которые характеризуются энантиомерным избытком (э. и.), энантиомера, который элюируется первым, составляющим по меньшей мере 40%, например, по меньшей мере 50%, 60%, 70% или 80%, предпочтительно по меньшей мере 90%, более предпочтительно по меньшей мере 95%, еще более предпочтительно по меньшей мере 98% и наиболее предпочтительно по меньшей мере 99%.

10 В варианте осуществления 33a предусмотрены соединения или их агрохимически приемлемая соль, стереоизомер, энантиомер, таутомер или N-оксид в соответствии с любым из вариантов осуществления 1-26b, предусматривающие соединения формулы I, которые представляют собой энантиомеры, которые элюируются вторыми во время хирального разделения рацемата с помощью препаративной хроматографии с применением иммобилизованных хиральных фаз на основе амилозы (CHIRALPAK® IA, CHIRALPAK® IG) или на основе целлюлозы (CHIRALPAK® IC).

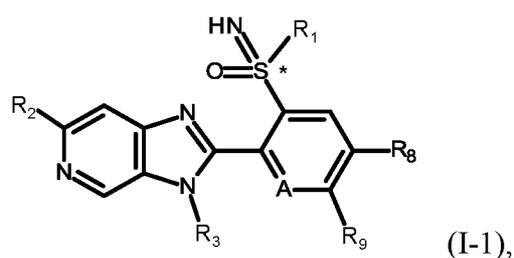
20 В варианте осуществления 33b предусмотрены соединения или их агрохимически приемлемая соль, стереоизомер, энантиомер, таутомер или N-оксид в соответствии с любым из вариантов осуществления 1-26b, предусматривающие соединения формулы I, которые представляют собой энантиомеры, которые элюируются вторыми во время хирального разделения рацемата с помощью препаративной SFC (сверхкритической жидкостной хроматографии) с применением иммобилизованных хиральных фаз на основе амилозы (CHIRALPAK® IA, CHIRALPAK® IG) или на основе целлюлозы (CHIRALPAK® IC).

30 В варианте осуществления 33c предусмотрены соединения или их агрохимически приемлемая соль, стереоизомер, энантиомер, таутомер или N-оксид в соответствии с любым из вариантов осуществления 1-26b, предусматривающие соединения формулы I, которые представляют собой энантиомеры, которые элюируются вторыми во время хирального разделения рацемата с помощью препаративной SFC с применением иммобилизованных хиральных фаз на основе амилозы (CHIRALPAK® IA, CHIRALPAK® IG) или на основе целлюлозы (CHIRALPAK® IC) и с применением

сверхкритического CO₂ и спиртового соразтворителя, такого как предпочтительно метанол, этанол или изопропиловый спирт, в качестве подвижной фазы.

В варианте осуществления 34 предусмотрены соединения или их агрохимически приемлемая соль, стереоизомер, энантиомер, таутомер или N-оксид в соответствии с любым из вариантов осуществления 33a-33c или в энантиомерно чистой форме, или которые характеризуются энантиомерным избытком (э. и.) энантиомера, который элюируется вторым, составляющим по меньшей мере 40%, например, по меньшей мере 50%, 60%, 70% или 80%, предпочтительно по меньшей мере 90%, более предпочтительно по меньшей мере 95%, еще более предпочтительно по меньшей мере 98% и наиболее предпочтительно по меньшей мере 99%.

Предпочтительная группа соединений формулы I представлена соединениями формулы I-1



где R₁, R₂, R₃, R₈, R₉, S* и A определены для формулы I выше.

В одной предпочтительной группе соединений формулы I-1 A представляет собой СН или N; R₁ представляет собой этил, пропил или изопропил; R₂ представляет собой C₁-C₂галогеналкил, C₁-C₂галогеналкилсульфанил, C₁-C₂галогеналкилсульфинил или C₁-C₂галогеналкилсульфонил; R₃ представляет собой C₁-C₂алкил; R₉ представляет собой водород, метил или этил; R₈ представляет собой цианоизопропокси, цианоизопропил или цианоциклопропил.

В другой предпочтительной группе соединений формулы I-1 A представляет собой СН или N; R₁ представляет собой этил; R₂ представляет собой C₁-C₂фторалкил, трифторметилсульфанил, трифторметилсульфинил, трифторметилсульфонил, дифторметилсульфанил, дифторметилсульфинил или дифторметилсульфонил; R₃ представляет собой метил; R₉ представляет собой водород или метил, предпочтительно

R₉ представляет собой водород; R₈ представляет собой цианоизопропокси, цианоизопропил или цианоциклопропил.

В соединениях формулы I-1 и всех предпочтительных вариантах осуществления соединений формулы I-1, указанных выше, если не указано другое, R₁, R₂, R₃, R₈, R₉, S* и A определены для формулы I выше; предпочтительно A представляет собой СН или N, более предпочтительно A представляет собой N; R₁ представляет собой этил; R₂ представляет собой трифторметил, пентафторэтил или трифторметилсульфанил; предпочтительно R₂ представляет собой трифторметил; R₃ представляет собой метил; R₉ представляет собой водород; R₈ представляет собой 1-циано-1-метилэтокси, 1-циано-1-метилэтил или 1-цианоциклопропил.

Одну группу соединений в соответствии с данным вариантом осуществления составляют соединения формулы (I-1a), которые представляют собой соединения формулы (I-1) или любой из предпочтительных вариантов осуществления соединений формулы (I-1), где S* находится в R-конфигурации.

Одну группу соединений в соответствии с данным вариантом осуществления составляют соединения формулы (I-1b), которые представляют собой соединения формулы (I-1) или любой из предпочтительных вариантов осуществления соединений формулы (I-1), где S* находится в S-конфигурации.

Одну группу соединений в соответствии с данным вариантом осуществления составляют соединения формулы (I-1c), которые представляют собой соединения формулы (I-1) или любой из предпочтительных вариантов осуществления соединений формулы (I-1), которые представляют собой энантиомеры, которые элюируются первыми во время хирального разделения рацемата с помощью препаративной хроматографии с применением иммобилизованных хиральных фаз на основе амилозы (CHIRALPAK® IA, CHIRALPAK® IG) или на основе целлюлозы (CHIRALPAK® IC).

Одну группу соединений в соответствии с данным вариантом осуществления составляют соединения формулы (I-1d), которые представляют собой соединения

формулы (I-1) или любой из предпочтительных вариантов осуществления соединений формулы (I-1), которые представляют собой энантиомеры, которые элюируются первыми во время хирального разделения рацемата с помощью препаративной SFC (сверхкритической жидкостной хроматографии) с применением иммобилизованных хиральных фаз на основе амилозы (CHIRALPAK® IA, CHIRALPAK® IG) или на основе целлюлозы (CHIRALPAK® IC).

Одну группу соединений в соответствии с данным вариантом осуществления составляют соединения формулы (I-1e), которые представляют собой соединения формулы (I-1) или любой из предпочтительных вариантов осуществления соединений формулы (I-1), которые представляют собой энантиомеры, которые элюируются первыми во время хирального разделения рацемата с помощью препаративной SFC с применением иммобилизованных хиральных фаз на основе амилозы (CHIRALPAK® IA, CHIRALPAK® IG) или на основе целлюлозы (CHIRALPAK® IC) и с применением сверхкритического CO₂ и спиртового соразтворителя, такого как предпочтительно метанол, этанол или изопропиловый спирт, в качестве подвижной фазы.

Одну группу соединений в соответствии с данным вариантом осуществления составляют соединения формулы (I-1f), которые представляют собой соединения формулы (I-1) или любой из предпочтительных вариантов осуществления соединений формулы (I-1), которые представляют собой энантиомеры, которые элюируются вторыми во время хирального разделения рацемата с помощью препаративной хроматографии с применением иммобилизованных хиральных фаз на основе амилозы (CHIRALPAK® IA, CHIRALPAK® IG) или на основе целлюлозы (CHIRALPAK® IC).

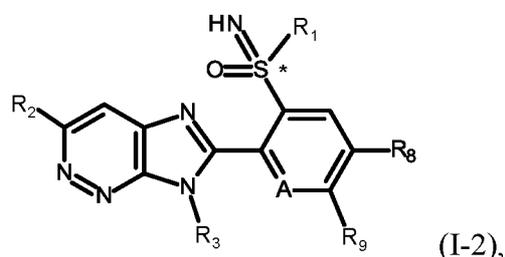
Одну группу соединений в соответствии с данным вариантом осуществления составляют соединения формулы (I-1g), которые представляют собой соединения формулы (I-1) или любой из предпочтительных вариантов осуществления соединений формулы (I-1), которые представляют собой энантиомеры, которые элюируются вторыми во время хирального разделения рацемата с помощью препаративной SFC (сверхкритической жидкостной хроматографии) с применением иммобилизованных

хиральных фаз на основе амилозы (CHIRALPAK® IA, CHIRALPAK® IG) или на основе целлюлозы (CHIRALPAK® IC).

Одну группу соединений в соответствии с данным вариантом осуществления составляют соединения формулы (I-1h), которые представляют собой соединения формулы (I-1) или любой из предпочтительных вариантов осуществления соединений формулы (I-1), которые представляют собой энантимеры, которые элюируются вторыми во время хирального разделения рацемата с помощью препаративной SFC с применением иммобилизованных хиральных фаз на основе амилозы (CHIRALPAK® IA, CHIRALPAK® IG) или на основе целлюлозы (CHIRALPAK® IC) и с применением сверхкритического CO₂ и спиртового соразтворителя, такого как предпочтительно метанол, этанол или изопропиловый спирт, в качестве подвижной фазы.

Другую группу соединений в соответствии с данным вариантом осуществления составляют соединения формулы (I-1i), которые представляют собой соединения формулы (I-1) или любой из предпочтительных вариантов осуществления соединений формулы (I-1), или полученные, или получаемые стереоспецифическим способом путем осуществления иминирования стереогенных сульфинильных производных, которые получены путем осуществления стереоселективного окисления соответствующих сульфаниловых соединений, как дополнительно изложено и описано в варианте осуществления 31.

Другая предпочтительная группа соединений формулы I представлена соединениями формулы I-2,



где R₁, R₂, R₃, R₈, R₉, S* и A определены для формулы I выше.

В одной предпочтительной группе соединений формулы I-2 A представляет собой CH или N; R₁ представляет собой этил, пропил или изопропил; R₂ представляет собой C₁-

С₂галогеналкил, С₁-С₂галогеналкилсульфанил, С₁-С₂галогеналкилсульфинил или С₁-С₂галогеналкилсульфонил; R₃ представляет собой С₁-С₂алкил; R₉ представляет собой водород, метил или этил; R₈ представляет собой цианоизопропокси, цианоизопропил или цианоциклопропил.

5

В другой предпочтительной группе соединений формулы I-2 А представляет собой СН или N; R₁ представляет собой этил; R₂ представляет собой С₁-С₂фторалкил, трифторметилсульфанил, трифторметилсульфинил, трифторметилсульфонил, дифторметилсульфанил, дифторметилсульфинил или дифторметилсульфонил; R₃ представляет собой метил; R₉ представляет собой водород или метил, предпочтительно R₉ представляет собой водород; R₈ представляет собой цианоизопропокси, цианоизопропил или цианоциклопропил.

10

В соединениях формулы I-2 и всех предпочтительных вариантах осуществления соединений формулы I-2, указанных выше, если не указано другое, R₁, R₂, R₃, R₈, R₉, S* и А определены для формулы I выше; предпочтительно А представляет собой СН или N, более предпочтительно А представляет собой N; R₁ представляет собой этил; R₂ представляет собой трифторметил, пентафторэтил или трифторметилсульфанил; предпочтительно R₂ представляет собой трифторметил; R₃ представляет собой метил; R₉ представляет собой водород; R₈ представляет собой 1-циано-1-метилэтокси, 1-циано-1-метилэтил или 1-цианоциклопропил.

15

20

Одну группу соединений в соответствии с данным вариантом осуществления составляют соединения формулы (I-2a), которые представляют собой соединения формулы (I-2) или любой из предпочтительных вариантов осуществления соединений формулы (I-2), где S* находится в R-конфигурации.

25

Одну группу соединений в соответствии с данным вариантом осуществления составляют соединения формулы (I-2b), которые представляют собой соединения формулы (I-2) или любой из предпочтительных вариантов осуществления соединений формулы (I-2), где S* находится в S-конфигурации.

30

Одну группу соединений в соответствии с данным вариантом осуществления составляют соединения формулы (I-2c), которые представляют собой соединения формулы (I-2) или любой из предпочтительных вариантов осуществления соединений формулы (I-2), которые представляют собой энантиомеры, которые элюируются первыми во время хирального разделения рацемата с помощью препаративной хроматографии с применением иммобилизованных хиральных фаз на основе амилозы (CHIRALPAK® IA, CHIRALPAK® IG) или на основе целлюлозы (CHIRALPAK® IC).

Одну группу соединений согласно данному варианту осуществления составляют соединения формулы (I-2d), которые представляют собой соединения формулы (I-2) или любой из предпочтительных вариантов осуществления соединений формулы (I-2), которые представляют собой энантиомеры, которые элюируются первыми во время хирального разделения рацемата с помощью препаративной SFC (сверхкритической жидкостной хроматографии) с применением иммобилизованных хиральных фаз на основе амилозы (CHIRALPAK® IA, CHIRALPAK® IG) или на основе целлюлозы (CHIRALPAK® IC).

Одну группу соединений в соответствии с данным вариантом осуществления составляют соединения формулы (I-2e), которые представляют собой соединения формулы (I-2) или любой из предпочтительных вариантов осуществления соединений формулы (I-2), которые представляют собой энантиомеры, которые элюируются первыми во время хирального разделения рацемата с помощью препаративной SFC с применением иммобилизованных хиральных фаз на основе амилозы (CHIRALPAK® IA, CHIRALPAK® IG) или на основе целлюлозы (CHIRALPAK® IC) и с применением сверхкритического CO₂ и спиртового соразтворителя, такого как предпочтительно метанол, этанол или изопропиловый спирт, в качестве подвижной фазы.

Одну группу соединений в соответствии с данным вариантом осуществления составляют соединения формулы (I-2f), которые представляют собой соединения формулы (I-2) или любой из предпочтительных вариантов осуществления соединений формулы (I-2), которые представляют собой энантиомеры, которые элюируются вторыми во время хирального разделения рацемата с помощью препаративной

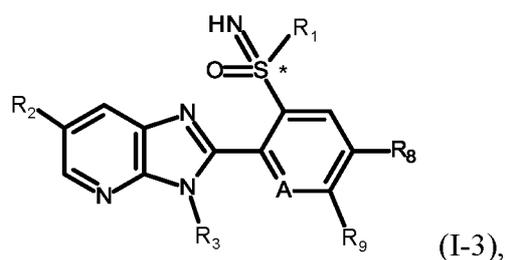
хроматографии с применением иммобилизованных хиральных фаз на основе амилозы (CHIRALPAK® IA, CHIRALPAK® IG) или на основе целлюлозы (CHIRALPAK® IC).

5 Одну группу соединений в соответствии с данным вариантом осуществления составляют соединения формулы (I-2g), которые представляют собой соединения формулы (I-2) или любой из предпочтительных вариантов осуществления соединений формулы (I-2), которые представляют собой энантиомеры, которые элюируются вторыми во время хирального разделения рацемата с помощью препаративной SFC
10 (сверхкритической жидкостной хроматографии) с применением иммобилизованных хиральных фаз на основе амилозы (CHIRALPAK® IA, CHIRALPAK® IG) или на основе целлюлозы (CHIRALPAK® IC).

Одну группу соединений в соответствии с данным вариантом осуществления
15 составляют соединения формулы (I-2h), которые представляют собой соединения формулы (I-2) или любой из предпочтительных вариантов осуществления соединений формулы (I-2), которые представляют собой энантиомеры, которые элюируются вторыми во время хирального разделения рацемата с помощью препаративной SFC с применением иммобилизованных хиральных фаз на основе амилозы (CHIRALPAK®
20 IA, CHIRALPAK® IG) или на основе целлюлозы (CHIRALPAK® IC) и с применением сверхкритического CO₂ и спиртового соразтворителя, такого как предпочтительно метанол, этанол или изопропиловый спирт, в качестве подвижной фазы.

Другую группу соединений в соответствии с данным вариантом осуществления
25 составляют соединения формулы (I-2i), которые представляют собой соединения формулы (I-2) или любой из предпочтительных вариантов осуществления соединений формулы (I-2), или полученные, или получаемые стереоспецифическим способом путем осуществления иминирования стереогенных сульфинильных производных, которые получены путем осуществления стереоселективного окисления
30 соответствующих сульфаниловых соединений, как дополнительно изложено и описано в варианте осуществления 31.

Другая предпочтительная группа соединений формулы I представлена соединениями формулы I-3,



где R₁, R₂, R₃, R₈, R₉, S* и A определены для формулы I выше.

5

В одной предпочтительной группе соединений формулы I-3 A представляет собой СН или N; R₁ представляет собой этил, пропил или изопропил; R₂ представляет собой C₁-C₂галогеналкил, C₁-C₂галогеналкилсульфанил, C₁-C₂галогеналкилсульфинил или C₁-C₂галогеналкилсульфонил; R₃ представляет собой C₁-C₂алкил; R₉ представляет собой водород, метил или этил; R₈ представляет собой цианоизопропокси, цианоизопропил или цианоциклопропил.

10

В другой предпочтительной группе соединений формулы I-3 A представляет собой СН или N; R₁ представляет собой этил; R₂ представляет собой C₁-C₂фторалкил, трифторметилсульфанил, трифторметилсульфинил, трифторметилсульфонил, дифторметилсульфанил, дифторметилсульфинил или дифторметилсульфонил; R₃ представляет собой метил; R₉ представляет собой водород или метил, предпочтительно R₉ представляет собой водород; R₈ представляет собой цианоизопропокси, цианоизопропил или цианоциклопропил.

15

20

В соединениях формулы I-3 и всех предпочтительных вариантах осуществления соединений формулы I-3, указанных выше, если не указано другое, R₁, R₂, R₃, R₈, R₉, S* и A определены для формулы I выше; предпочтительно A представляет собой СН или N, более предпочтительно A представляет собой N; R₁ представляет собой этил; R₂ представляет собой трифторметил, пентафторэтил или трифторметилсульфанил; предпочтительно R₂ представляет собой трифторметил; R₃ представляет собой метил; R₉ представляет собой водород; R₈ представляет собой 1-циано-1-метилэтокси, 1-циано-1-метилэтил или 1-цианоциклопропил.

25

Одну группу соединений в соответствии с данным вариантом осуществления составляют соединения формулы (I-3a), которые представляют собой соединения формулы (I-3) или любой из предпочтительных вариантов осуществления соединений формулы (I-3), где S* находится в R-конфигурации.

5

Одну группу соединений в соответствии с данным вариантом осуществления составляют соединения формулы (I-3b), которые представляют собой соединения формулы (I-3) или любой из предпочтительных вариантов осуществления соединений формулы (I-3), где S* находится в S-конфигурации.

10

Одну группу соединений в соответствии с данным вариантом осуществления составляют соединения формулы (I-3c), которые представляют собой соединения формулы (I-3) или любой из предпочтительных вариантов осуществления соединений формулы (I-3), которые представляют собой энантимеры, которые элюируются первыми во время хирального разделения рацемата с помощью препаративной хроматографии с применением иммобилизованных хиральных фаз на основе амилозы (CHIRALPAK® IA, CHIRALPAK® IG) или на основе целлюлозы (CHIRALPAK® IC).

15

Одну группу соединений согласно данному варианту осуществления составляют соединения формулы (I-3d), которые представляют собой соединения формулы (I-3) или любой из предпочтительных вариантов осуществления соединений формулы (I-3), которые представляют собой энантимеры, которые элюируются первыми во время хирального разделения рацемата с помощью препаративной SFC (сверхкритической жидкостной хроматографии) с применением иммобилизованных хиральных фаз на основе амилозы (CHIRALPAK® IA, CHIRALPAK® IG) или на основе целлюлозы (CHIRALPAK® IC).

20

Одну группу соединений в соответствии с данным вариантом осуществления составляют соединения формулы (I-3e), которые представляют собой соединения формулы (I-3) или любой из предпочтительных вариантов осуществления соединений формулы (I-3), которые представляют собой энантимеры, которые элюируются первыми во время хирального разделения рацемата с помощью препаративной SFC с

25

30

применением иммобилизованных хиральных фаз на основе амилозы (CHIRALPAK® IA, CHIRALPAK® IG) или на основе целлюлозы (CHIRALPAK® IC) и с применением сверхкритического CO₂ и спиртового соразтворителя, такого как предпочтительно метанол, этанол или изопропиловый спирт, в качестве подвижной фазы.

5

Одну группу соединений в соответствии с данным вариантом осуществления составляют соединения формулы (I-3f), которые представляют собой соединения формулы (I-3) или любой из предпочтительных вариантов осуществления соединений формулы (I-3), которые представляют собой энантиомеры, которые элюируются вторыми во время хирального разделения рацемата с помощью препаративной хроматографии с применением иммобилизованных хиральных фаз на основе амилозы (CHIRALPAK® IA, CHIRALPAK® IG) или на основе целлюлозы (CHIRALPAK® IC).

10

Одну группу соединений в соответствии с данным вариантом осуществления составляют соединения формулы (I-3g), которые представляют собой соединения формулы (I-3) или любой из предпочтительных вариантов осуществления соединений формулы (I-3), которые представляют собой энантиомеры, которые элюируются вторыми во время хирального разделения рацемата с помощью препаративной SFC (сверхкритической жидкостной хроматографии) с применением иммобилизованных хиральных фаз на основе амилозы (CHIRALPAK® IA, CHIRALPAK® IG) или на основе целлюлозы (CHIRALPAK® IC).

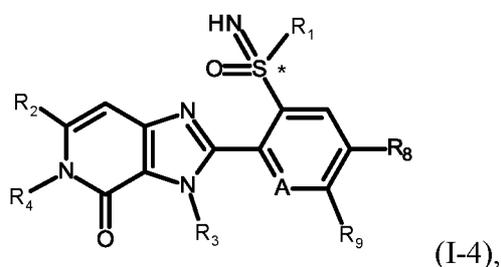
20

Одну группу соединений в соответствии с данным вариантом осуществления составляют соединения формулы (I-3h), которые представляют собой соединения формулы (I-3) или любой из предпочтительных вариантов осуществления соединений формулы (I-3), которые представляют собой энантиомеры, которые элюируются вторыми во время хирального разделения рацемата с помощью препаративной SFC с применением иммобилизованных хиральных фаз на основе амилозы (CHIRALPAK® IA, CHIRALPAK® IG) или на основе целлюлозы (CHIRALPAK® IC) и с применением сверхкритического CO₂ и спиртового соразтворителя, такого как предпочтительно метанол, этанол или изопропиловый спирт, в качестве подвижной фазы.

30

Другую группу соединений в соответствии с данным вариантом осуществления составляют соединения формулы (I-3i), которые представляют собой соединения формулы (I-3) или любой из предпочтительных вариантов осуществления соединений формулы (I-3), или полученные, или получаемые стереоспецифическим способом
 5 путем осуществления иминирования стереогенных сульфинильных производных, которые получены путем осуществления стереоселективного окисления соответствующих сульфаниловых соединений, как дополнительно изложено и описано в варианте осуществления 31.

10 Другая предпочтительная группа соединений формулы I представлена соединениями формулы I-4,



где R₁, R₂, R₃, R₄, R₈, R₉, S* и A определены для формулы I выше.

15 В одной предпочтительной группе соединений формулы I-4 A представляет собой СН или N; R₁ представляет собой этил, пропил или изопропил; R₂ представляет собой C₁-C₂галогеналкил, C₁-C₂галогеналкилсульфанил, C₁-C₂галогеналкилсульфинил или C₁-C₂галогеналкилсульфонил; R₃ представляет собой C₁-C₂алкил; R₄ представляет собой C₁-C₂алкил, C₁-C₂галогеналкил, C₁-C₂алкокси или циклопропил; R₉ представляет собой
 20 водород, метил или этил; R₈ представляет собой цианоизопропокси, цианоизопропил или цианоциклопропил.

В другой предпочтительной группе соединений формулы I-4 A представляет собой СН или N; R₁ представляет собой этил; R₂ представляет собой C₁-C₂фторалкил, трифторметилсульфанил, трифторметилсульфинил, трифторметилсульфонил, дифторметилсульфанил, дифторметилсульфинил или дифторметилсульфонил; R₃
 25 представляет собой метил; R₄ представляет собой метил, этил, метокси или циклопропил; R₉ представляет собой водород или метил, предпочтительно R₉

представляет собой водород; R_8 представляет собой цианоизопропокси, цианоизопропил или цианоциклопропил.

5 В другой предпочтительной группе соединений формулы I-4 R_4 представляет собой этил, метокси или циклопропил.

10 В соединениях формулы I-4 и всех предпочтительных вариантах осуществления соединений формулы I-4, указанных выше, если не указано другое, R_1 , R_2 , R_3 , R_4 , R_8 , R_9 , S^* и A определены для формулы I выше; предпочтительно A представляет собой СН или N, более предпочтительно A представляет собой N; R_1 представляет собой этил; R_2 представляет собой трифторметил, пентафторэтил или трифторметилсульфанил; предпочтительно R_2 представляет собой трифторметил; R_3 представляет собой метил; R_4 представляет собой этил, метокси или циклопропил; R_9 представляет собой водород; R_8 представляет собой 1-циано-1-метилэтокси, 1-циано-1-метилэтил или 1-цианоциклопропил.

20 Одну группу соединений в соответствии с данным вариантом осуществления составляют соединения формулы (I-4a), которые представляют собой соединения формулы (I-4) или любой из предпочтительных вариантов осуществления соединений формулы (I-4), где S^* находится в R-конфигурации.

25 Одну группу соединений в соответствии с данным вариантом осуществления составляют соединения формулы (I-4b), которые представляют собой соединения формулы (I-4) или любой из предпочтительных вариантов осуществления соединений формулы (I-4), где S^* находится в S-конфигурации.

30 Одну группу соединений в соответствии с данным вариантом осуществления составляют соединения формулы (I-4c), которые представляют собой соединения формулы (I-4) или любой из предпочтительных вариантов осуществления соединений формулы (I-4), которые представляют собой энантиомеры, которые элюируются первыми во время хирального разделения рацемата с помощью препаративной хроматографии с применением иммобилизованных хиральных фаз на основе

амилозы (CHIRALPAK® IA, CHIRALPAK® IG) или на основе целлюлозы (CHIRALPAK® IC).

5 Одну группу соединений в соответствии с данным вариантом осуществления составляют соединения формулы (I-4d), которые представляют собой соединения формулы (I-4) или любой из предпочтительных вариантов осуществления соединений формулы (I-4), которые представляют собой энантиомеры, которые элюируются первыми во время хирального разделения рацемата с помощью препаративной SFC (сверхкритической жидкостной хроматографии) с применением иммобилизованных хиральных фаз на основе амилозы (CHIRALPAK® IA, CHIRALPAK® IG) или на 10 основе целлюлозы (CHIRALPAK® IC).

Одну группу соединений в соответствии с данным вариантом осуществления составляют соединения формулы (I-4e), которые представляют собой соединения формулы (I-4) или любой из предпочтительных вариантов осуществления соединений формулы (I-4), которые представляют собой энантиомеры, которые элюируются первыми во время хирального разделения рацемата с помощью препаративной SFC с применением иммобилизованных хиральных фаз на основе амилозы (CHIRALPAK® IA, CHIRALPAK® IG) или на основе целлюлозы (CHIRALPAK® IC) и с применением 20 сверхкритического CO₂ и спиртового соразтворителя, такого как предпочтительно метанол, этанол или изопропиловый спирт, в качестве подвижной фазы.

Одну группу соединений в соответствии с данным вариантом осуществления составляют соединения формулы (I-4f), которые представляют собой соединения формулы (I-4) или любой из предпочтительных вариантов осуществления соединений формулы (I-4), которые представляют собой энантиомеры, которые элюируются вторыми во время хирального разделения рацемата с помощью препаративной хроматографии с применением иммобилизованных хиральных фаз на основе амилозы (CHIRALPAK® IA, CHIRALPAK® IG) или на основе целлюлозы 30 (CHIRALPAK® IC).

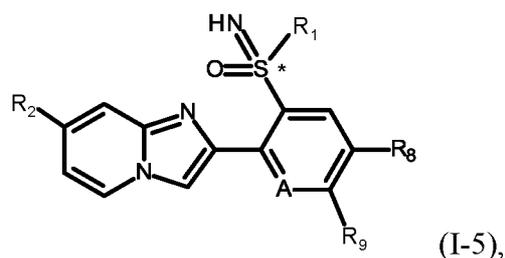
Одну группу соединений в соответствии с данным вариантом осуществления составляют соединения формулы (I-4g), которые представляют собой соединения

формулы (I-4) или любой из предпочтительных вариантов осуществления соединений формулы (I-4), которые представляют собой энантиомеры, которые элюируются вторыми во время хирального разделения рацемата с помощью препаративной SFC (сверхкритической жидкостной хроматографии) с применением иммобилизованных хиральных фаз на основе амилозы (CHIRALPAK® IA, CHIRALPAK® IG) или на основе целлюлозы (CHIRALPAK® IC).

Одну группу соединений в соответствии с данным вариантом осуществления составляют соединения формулы (I-4h), которые представляют собой соединения формулы (I-4) или любой из предпочтительных вариантов осуществления соединений формулы (I-4), которые представляют собой энантиомеры, которые элюируются вторыми во время хирального разделения рацемата с помощью препаративной SFC с применением иммобилизованных хиральных фаз на основе амилозы (CHIRALPAK® IA, CHIRALPAK® IG) или на основе целлюлозы (CHIRALPAK® IC) и с применением сверхкритического CO₂ и спиртового соразтворителя, такого как предпочтительно метанол, этанол или изопропиловый спирт, в качестве подвижной фазы.

Другую группу соединений в соответствии с данным вариантом осуществления составляют соединения формулы (I-4i), которые представляют собой соединения формулы (I-4) или любой из предпочтительных вариантов осуществления соединений формулы (I-4), или полученные, или получаемые стереоспецифическим способом путем осуществления иминирования стереогенных сульфинильных производных, которые получены путем осуществления стереоселективного окисления соответствующих сульфаниловых соединений, как дополнительно изложено и описано в варианте осуществления 31.

Другая предпочтительная группа соединений формулы I представлена соединениями формулы I-5,



где R_1 , R_2 , R_8 , R_9 , S^* и A определены для формулы I выше.

5 В одной предпочтительной группе соединений формулы I-5 A представляет собой CH или N ; R_1 представляет собой этил, пропил или изопропил; R_2 представляет собой C_1 - C_2 галогеналкил, C_1 - C_2 галогеналкилсульфанил, C_1 - C_2 галогеналкилсульфинил или C_1 - C_2 галогеналкилсульфонил; R_9 представляет собой водород, метил или этил; R_8 представляет собой цианоизопропокси, цианоизопропил или цианоциклопропил.

10 В другой предпочтительной группе соединений формулы I-5 A представляет собой CH или N ; R_1 представляет собой этил; R_2 представляет собой C_1 - C_2 фторалкил, трифторметилсульфанил, трифторметилсульфинил, трифторметилсульфонил, дифторметилсульфанил, дифторметилсульфинил или дифторметилсульфонил; R_9 представляет собой водород или метил, предпочтительно R_9 представляет собой водород; R_8 представляет собой цианоизопропокси, цианоизопропил или
15 цианоциклопропил.

В соединениях формулы I-5 и всех предпочтительных вариантах осуществления соединений формулы I-5, указанных выше, если не указано другое, R_1 , R_2 , R_8 , R_9 , S^* и A определены для формулы I выше; предпочтительно A представляет собой CH или N ,
20 более предпочтительно A представляет собой N ; R_1 представляет собой этил; R_2 представляет собой трифторметил, пентафторэтил или трифторметилсульфанил; предпочтительно R_2 представляет собой трифторметил; R_9 представляет собой водород; R_8 представляет собой 1-циано-1-метилэтокси, 1-циано-1-метилэтил или 1-цианоциклопропил.

25 Одну группу соединений в соответствии с данным вариантом осуществления составляют соединения формулы (I-5a), которые представляют собой соединения формулы (I-5) или любой из предпочтительных вариантов осуществления соединений формулы (I-5), где S^* находится в R -конфигурации.

30 Одну группу соединений в соответствии с данным вариантом осуществления составляют соединения формулы (I-5b), которые представляют собой соединения

формулы (I-5) или любой из предпочтительных вариантов осуществления соединений формулы (I-5), где S* находится в S-конфигурации.

5 Одну группу соединений в соответствии с данным вариантом осуществления составляют соединения формулы (I-5c), которые представляют собой соединения формулы (I-5) или любой из предпочтительных вариантов осуществления соединений формулы (I-5), которые представляют собой энантиомеры, которые элюируются первыми во время хирального разделения рацемата с помощью препаративной хроматографии с применением иммобилизованных хиральных фаз на основе амилозы (CHIRALPAK® IA, CHIRALPAK® IG) или на основе целлюлозы (CHIRALPAK® IC).

15 Одну группу соединений в соответствии с данным вариантом осуществления составляют соединения формулы (I-5d), которые представляют собой соединения формулы (I-5) или любой из предпочтительных вариантов осуществления соединений формулы (I-5), которые представляют собой энантиомеры, которые элюируются первыми во время хирального разделения рацемата с помощью препаративной SFC (сверхкритической жидкостной хроматографии) с применением иммобилизованных хиральных фаз на основе амилозы (CHIRALPAK® IA, CHIRALPAK® IG) или на основе целлюлозы (CHIRALPAK® IC).

25 Одну группу соединений в соответствии с данным вариантом осуществления составляют соединения формулы (I-5e), которые представляют собой соединения формулы (I-5) или любой из предпочтительных вариантов осуществления соединений формулы (I-5), которые представляют собой энантиомеры, которые элюируются первыми во время хирального разделения рацемата с помощью препаративной SFC с применением иммобилизованных хиральных фаз на основе амилозы (CHIRALPAK® IA, CHIRALPAK® IG) или на основе целлюлозы (CHIRALPAK® IC) и с применением сверхкритического CO₂ и спиртового соразтворителя, такого как предпочтительно метанол, этанол или изопропиловый спирт, в качестве подвижной фазы.

Одну группу соединений в соответствии с данным вариантом осуществления составляют соединения формулы (I-5f), которые представляют собой соединения

формулы (I-5) или любой из предпочтительных вариантов осуществления соединений формулы (I-5), которые представляют собой энантиомеры, которые элюируются вторыми во время хирального разделения рацемата с помощью препаративной хроматографии с применением иммобилизованных хиральных фаз на основе амилозы (CHIRALPAK® IA, CHIRALPAK® IG) или на основе целлюлозы (CHIRALPAK® IC).

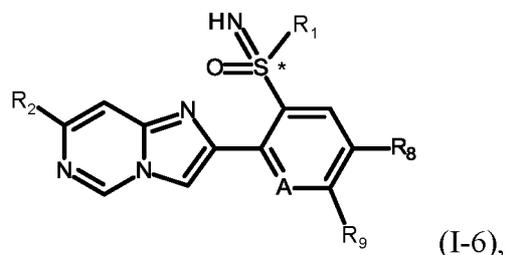
Одну группу соединений в соответствии с данным вариантом осуществления составляют соединения формулы (I-5g), которые представляют собой соединения формулы (I-5) или любой из предпочтительных вариантов осуществления соединений формулы (I-5), которые представляют собой энантиомеры, которые элюируются вторыми во время хирального разделения рацемата с помощью препаративной SFC (сверхкритической жидкостной хроматографии) с применением иммобилизованных хиральных фаз на основе амилозы (CHIRALPAK® IA, CHIRALPAK® IG) или на основе целлюлозы (CHIRALPAK® IC).

Одну группу соединений в соответствии с данным вариантом осуществления составляют соединения формулы (I-5h), которые представляют собой соединения формулы (I-5) или любой из предпочтительных вариантов осуществления соединений формулы (I-5), которые представляют собой энантиомеры, которые элюируются вторыми во время хирального разделения рацемата с помощью препаративной SFC с применением иммобилизованных хиральных фаз на основе амилозы (CHIRALPAK® IA, CHIRALPAK® IG) или на основе целлюлозы (CHIRALPAK® IC) и с применением сверхкритического CO₂ и спиртового соразтворителя, такого как предпочтительно метанол, этанол или изопропиловый спирт, в качестве подвижной фазы.

Другую группу соединений в соответствии с данным вариантом осуществления составляют соединения формулы (I-5i), которые представляют собой соединения формулы (I-5) или любой из предпочтительных вариантов осуществления соединений формулы (I-5), или полученные, или получаемые стереоспецифическим способом путем осуществления иминирования стереогенных сульфинильных производных, которые получены путем осуществления стереоселективного окисления

соответствующих сульфаниловых соединений, как дополнительно изложено и описано в варианте осуществления 31.

5 Другая предпочтительная группа соединений формулы I представлена соединениями формулы I-6,



где R_1 , R_2 , R_8 , R_9 , S^* и A определены для формулы I выше.

10 В одной предпочтительной группе соединений формулы I-6 A представляет собой CH или N ; R_1 представляет собой этил, пропил или изопропил; R_2 представляет собой C_1 - C_2 галогеналкил, C_1 - C_2 галогеналкилсульфанил, C_1 - C_2 галогеналкилсульфинил или C_1 - C_2 галогеналкилсульфонил; R_9 представляет собой водород, метил или этил; R_8 представляет собой цианоизопропокси, цианоизопропил или цианоциклопропил.

15 В другой предпочтительной группе соединений формулы I-6 A представляет собой CH или N ; R_1 представляет собой этил; R_2 представляет собой C_1 - C_2 фторалкил, трифторметилсульфанил, трифторметилсульфинил, трифторметилсульфонил, дифторметилсульфанил, дифторметилсульфинил или дифторметилсульфонил; R_9 представляет собой водород или метил, предпочтительно R_9 представляет собой водород; R_8 представляет собой цианоизопропокси, цианоизопропил или цианоциклопропил.

20

В соединениях формулы I-6 и всех предпочтительных вариантах осуществления соединений формулы I-6, указанных выше, если не указано другое, R_1 , R_2 , R_8 , R_9 , S^* и A определены для формулы I выше; предпочтительно A представляет собой CH или N , более предпочтительно A представляет собой N ; R_1 представляет собой этил; R_2 представляет собой трифторметил, пентафторэтил или трифторметилсульфанил; предпочтительно R_2 представляет собой трифторметил; R_9 представляет собой водород;

25

R₈ представляет собой 1-циано-1-метилэтокси, 1-циано-1-метилэтил или 1-цианоциклопропил.

5 Одну группу соединений в соответствии с данным вариантом осуществления составляют соединения формулы (I-6a), которые представляют собой соединения формулы (I-6) или любой из предпочтительных вариантов осуществления соединений формулы (I-6), где S* находится в R-конфигурации.

10 Одну группу соединений в соответствии с данным вариантом осуществления составляют соединения формулы (I-6b), которые представляют собой соединения формулы (I-6) или любой из предпочтительных вариантов осуществления соединений формулы (I-6), где S* находится в S-конфигурации.

15 Одну группу соединений в соответствии с данным вариантом осуществления составляют соединения формулы (I-6c), которые представляют собой соединения формулы (I-6) или любой из предпочтительных вариантов осуществления соединений формулы (I-6), которые представляют собой энантиомеры, которые элюируются первыми во время хирального разделения рацемата с помощью препаративной хроматографии с применением иммобилизованных хиральных фаз на основе
20 амилозы (CHIRALPAK® IA, CHIRALPAK® IG) или на основе целлюлозы (CHIRALPAK® IC).

25 Одну группу соединений в соответствии с данным вариантом осуществления составляют соединения формулы (I-6d), которые представляют собой соединения формулы (I-6) или любой из предпочтительных вариантов осуществления соединений формулы (I-6), которые представляют собой энантиомеры, которые элюируются первыми во время хирального разделения рацемата с помощью препаративной SFC (сверхкритической жидкостной хроматографии) с применением иммобилизованных хиральных фаз на основе амилозы (CHIRALPAK® IA, CHIRALPAK® IG) или на
30 основе целлюлозы (CHIRALPAK® IC).

Одну группу соединений в соответствии с данным вариантом осуществления составляют соединения формулы (I-6e), которые представляют собой соединения

формулы (I-6) или любой из предпочтительных вариантов осуществления соединений формулы (I-6), которые представляют собой энантиомеры, которые элюируются первыми во время хирального разделения рацемата с помощью препаративной SFC с применением иммобилизованных хиральных фаз на основе амилозы (CHIRALPAK® IA, CHIRALPAK® IG) или на основе целлюлозы (CHIRALPAK® IC) и с применением сверхкритического CO₂ и спиртового соразтворителя, такого как предпочтительно метанол, этанол или изопропиловый спирт, в качестве подвижной фазы.

Одну группу соединений в соответствии с данным вариантом осуществления составляют соединения формулы (I-6f), которые представляют собой соединения формулы (I-6) или любой из предпочтительных вариантов осуществления соединений формулы (I-6), которые представляют собой энантиомеры, которые элюируются вторыми во время хирального разделения рацемата с помощью препаративной хроматографии с применением иммобилизованных хиральных фаз на основе амилозы (CHIRALPAK® IA, CHIRALPAK® IG) или на основе целлюлозы (CHIRALPAK® IC).

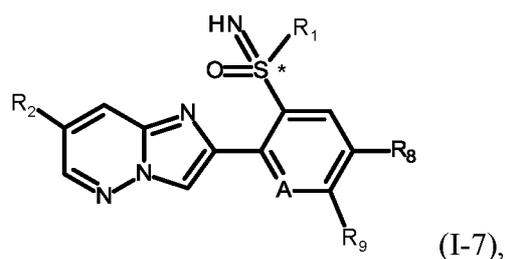
Одну группу соединений в соответствии с данным вариантом осуществления составляют соединения формулы (I-6g), которые представляют собой соединения формулы (I-6) или любой из предпочтительных вариантов осуществления соединений формулы (I-6), которые представляют собой энантиомеры, которые элюируются вторыми во время хирального разделения рацемата с помощью препаративной SFC (сверхкритической жидкостной хроматографии) с применением иммобилизованных хиральных фаз на основе амилозы (CHIRALPAK® IA, CHIRALPAK® IG) или на основе целлюлозы (CHIRALPAK® IC).

Одну группу соединений в соответствии с данным вариантом осуществления составляют соединения формулы (I-6h), которые представляют собой соединения формулы (I-6) или любой из предпочтительных вариантов осуществления соединений формулы (I-6), которые представляют собой энантиомеры, которые элюируются вторыми во время хирального разделения рацемата с помощью препаративной SFC с применением иммобилизованных хиральных фаз на основе амилозы (CHIRALPAK® IA, CHIRALPAK® IG) или на основе целлюлозы (CHIRALPAK® IC) и с применением

сверхкритического CO₂ и спиртового соразтворителя, такого как предпочтительно метанол, этанол или изопропиловый спирт, в качестве подвижной фазы.

5 Другую группу соединений в соответствии с данным вариантом осуществления составляют соединения формулы (I-6i), которые представляют собой соединения формулы (I-6) или любой из предпочтительных вариантов осуществления соединений формулы (I-6), или полученные, или получаемые стереоспецифическим способом путем осуществления иминирования стереогенных сульфинильных производных, которые получены путем осуществления стереоселективного окисления
10 соответствующих сульфаниловых соединений, как дополнительно изложено и описано в варианте осуществления 31.

Другая предпочтительная группа соединений формулы I представлена соединениями формулы I-7,



15 где R₁, R₂, R₈, R₉, S* и A определены для формулы I выше.

В одной предпочтительной группе соединений формулы I-7 A представляет собой СН или N; R₁ представляет собой этил, пропил или изопропил; R₂ представляет собой C₁-C₂галогеналкил, C₁-C₂галогеналкилсульфанил, C₁-C₂галогеналкилсульфинил или C₁-C₂галогеналкилсульфонил; R₉ представляет собой водород, метил или этил; R₈ представляет собой цианоизопропокси, цианоизопропил или цианоциклопропил.

20

В другой предпочтительной группе соединений формулы I-7 A представляет собой СН или N; R₁ представляет собой этил; R₂ представляет собой C₁-C₂фторалкил, трифторметилсульфанил, трифторметилсульфинил, трифторметилсульфонил, дифторметилсульфанил, дифторметилсульфинил или дифторметилсульфонил; R₉ представляет собой водород или метил, предпочтительно R₉ представляет собой

25

водород; R₈ представляет собой цианоизопропокси, цианоизопропил или цианоциклопропил.

5 В соединениях формулы I-7 и всех предпочтительных вариантах осуществления соединений формулы I-7, указанных выше, если не указано другое, R₁, R₂, R₈, R₉, S* и A определены для формулы I выше; предпочтительно A представляет собой СН или N, более предпочтительно A представляет собой N; R₁ представляет собой этил; R₂ представляет собой трифторметил, пентафторэтил или трифторметилсульфанил; предпочтительно R₂ представляет собой трифторметил; R₉ представляет собой водород; 10 R₈ представляет собой 1-циано-1-метилэтокси, 1-циано-1-метилэтил или 1-цианоциклопропил.

Одну группу соединений в соответствии с данным вариантом осуществления составляют соединения формулы (I-7a), которые представляют собой соединения 15 формулы (I-7) или любой из предпочтительных вариантов осуществления соединений формулы (I-7), где S* находится в R-конфигурации.

Одну группу соединений в соответствии с данным вариантом осуществления составляют соединения формулы (I-7b), которые представляют собой соединения 20 формулы (I-7) или любой из предпочтительных вариантов осуществления соединений формулы (I-7), где S* находится в S-конфигурации.

Одну группу соединений в соответствии с данным вариантом осуществления составляют соединения формулы (I-7c), которые представляют собой соединения 25 формулы (I-7) или любой из предпочтительных вариантов осуществления соединений формулы (I-7), которые представляют собой энантиомеры, которые элюируются первыми во время хирального разделения рацемата с помощью препаративной хроматографии с применением иммобилизированных хиральных фаз на основе амилозы (CHIRALPAK® IA, CHIRALPAK® IG) или на основе целлюлозы 30 (CHIRALPAK® IC).

Одну группу соединений в соответствии с данным вариантом осуществления составляют соединения формулы (I-7d), которые представляют собой соединения

формулы (I-7) или любой из предпочтительных вариантов осуществления соединений формулы (I-7), которые представляют собой энантиомеры, которые элюируются первыми во время хирального разделения рацемата с помощью препаративной SFC (сверхкритической жидкостной хроматографии) с применением иммобилизованных хиральных фаз на основе амилозы (CHIRALPAK® IA, CHIRALPAK® IG) или на основе целлюлозы (CHIRALPAK® IC).

Одну группу соединений в соответствии с данным вариантом осуществления составляют соединения формулы (I-7e), которые представляют собой соединения формулы (I-7) или любой из предпочтительных вариантов осуществления соединений формулы (I-7), которые представляют собой энантиомеры, которые элюируются первыми во время хирального разделения рацемата с помощью препаративной SFC с применением иммобилизованных хиральных фаз на основе амилозы (CHIRALPAK® IA, CHIRALPAK® IG) или на основе целлюлозы (CHIRALPAK® IC) и с применением сверхкритического CO₂ и спиртового соразтворителя, такого как предпочтительно метанол, этанол или изопропиловый спирт, в качестве подвижной фазы.

Одну группу соединений в соответствии с данным вариантом осуществления составляют соединения формулы (I-7f), которые представляют собой соединения формулы (I-7) или любой из предпочтительных вариантов осуществления соединений формулы (I-7), которые представляют собой энантиомеры, которые элюируются вторыми во время хирального разделения рацемата с помощью препаративной хроматографии с применением иммобилизованных хиральных фаз на основе амилозы (CHIRALPAK® IA, CHIRALPAK® IG) или на основе целлюлозы (CHIRALPAK® IC).

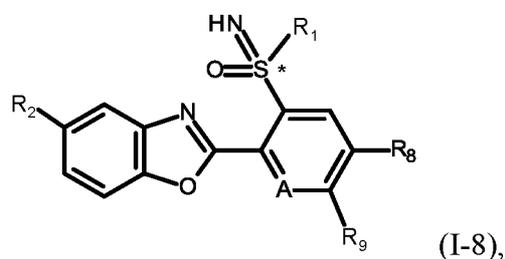
Одну группу соединений в соответствии с данным вариантом осуществления составляют соединения формулы (I-7g), которые представляют собой соединения формулы (I-7) или любой из предпочтительных вариантов осуществления соединений формулы (I-7), которые представляют собой энантиомеры, которые элюируются вторыми во время хирального разделения рацемата с помощью препаративной SFC (сверхкритической жидкостной хроматографии) с применением иммобилизованных

хиральных фаз на основе амилозы (CHIRALPAK® IA, CHIRALPAK® IG) или на основе целлюлозы (CHIRALPAK® IC).

Одну группу соединений в соответствии с данным вариантом осуществления составляют соединения формулы (I-7h), которые представляют собой соединения формулы (I-7) или любой из предпочтительных вариантов осуществления соединений формулы (I-7), которые представляют собой энантимеры, которые элюируются вторыми во время хирального разделения рацемата с помощью препаративной SFC с применением иммобилизованных хиральных фаз на основе амилозы (CHIRALPAK® IA, CHIRALPAK® IG) или на основе целлюлозы (CHIRALPAK® IC) и с применением сверхкритического CO₂ и спиртового соразтворителя, такого как предпочтительно метанол, этанол или изопропиловый спирт, в качестве подвижной фазы.

Другую группу соединений в соответствии с данным вариантом осуществления составляют соединения формулы (I-6i), которые представляют собой соединения формулы (I-6) или любой из предпочтительных вариантов осуществления соединений формулы (I-6), или полученные, или получаемые стереоспецифическим способом путем осуществления иминирования стереогенных сульфинильных производных, которые получены путем осуществления стереоселективного окисления соответствующих сульфаниловых соединений, как дополнительно изложено и описано в варианте осуществления 31.

Другая предпочтительная группа соединений формулы I представлена соединениями формулы I-8,



где R₁, R₂, R₈, R₉, S* и A определены для формулы I выше.

В одной предпочтительной группе соединений формулы I-8 A представляет собой CH или N; R₁ представляет собой этил, пропил или изопропил; R₂ представляет собой C₁-

C₂галогеналкил, C₁-C₂галогеналкилсульфанил, C₁-C₂галогеналкилсульфинил или C₁-C₂галогеналкилсульфонил; R₉ представляет собой водород, метил или этил; R₈ представляет собой цианоизопропокси, цианоизопропил или цианоциклопропил.

5 В другой предпочтительной группе соединений формулы I-8 A представляет собой СН или N; R₁ представляет собой этил; R₂ представляет собой C₁-C₂фторалкил, трифторметилсульфанил, трифторметилсульфинил, трифторметилсульфонил, дифторметилсульфанил, дифторметилсульфинил или дифторметилсульфонил; R₉ представляет собой водород или метил, предпочтительно R₉ представляет собой водород; R₈ представляет собой цианоизопропокси, цианоизопропил или цианоциклопропил.

В соединениях формулы I-8 и всех предпочтительных вариантах осуществления соединений формулы I-8, указанных выше, если не указано другое, R₁, R₂, R₈, R₉, S* и
15 A определены для формулы I выше; предпочтительно A представляет собой СН или N, более предпочтительно A представляет собой N; R₁ представляет собой этил; R₂ представляет собой трифторметил, пентафторэтил или трифторметилсульфанил; предпочтительно R₂ представляет собой трифторметил; R₉ представляет собой водород; R₈ представляет собой 1-циано-1-метилэтокси, 1-циано-1-метилэтил или 1-
20 цианоциклопропил.

Одну группу соединений в соответствии с данным вариантом осуществления составляют соединения формулы (I-8a), которые представляют собой соединения формулы (I-8) или любой из предпочтительных вариантов осуществления соединений формулы (I-8), где S* находится в R-конфигурации.
25

Одну группу соединений в соответствии с данным вариантом осуществления составляют соединения формулы (I-8b), которые представляют собой соединения формулы (I-8) или любой из предпочтительных вариантов осуществления соединений формулы (I-8), где S* находится в S-конфигурации.
30

Одну группу соединений в соответствии с данным вариантом осуществления составляют соединения формулы (I-8c), которые представляют собой соединения

формулы (I-8) или любой из предпочтительных вариантов осуществления соединений формулы (I-8), которые представляют собой энантиомеры, которые элюируются первыми во время хирального разделения рацемата с помощью препаративной хроматографии с применением иммобилизованных хиральных фаз на основе амилозы (CHIRALPAK® IA, CHIRALPAK® IG) или на основе целлюлозы (CHIRALPAK® IC).

Одну группу соединений в соответствии с данным вариантом осуществления составляют соединения формулы (I-8d), которые представляют собой соединения формулы (I-8) или любой из предпочтительных вариантов осуществления соединений формулы (I-8), которые представляют собой энантиомеры, которые элюируются первыми во время хирального разделения рацемата с помощью препаративной SFC (сверхкритической жидкостной хроматографии) с применением иммобилизованных хиральных фаз на основе амилозы (CHIRALPAK® IA, CHIRALPAK® IG) или на основе целлюлозы (CHIRALPAK® IC).

Одну группу соединений в соответствии с данным вариантом осуществления составляют соединения формулы (I-8e), которые представляют собой соединения формулы (I-8) или любой из предпочтительных вариантов осуществления соединений формулы (I-8), которые представляют собой энантиомеры, которые элюируются первыми во время хирального разделения рацемата с помощью препаративной SFC с применением иммобилизованных хиральных фаз на основе амилозы (CHIRALPAK® IA, CHIRALPAK® IG) или на основе целлюлозы (CHIRALPAK® IC) и с применением сверхкритического CO₂ и спиртового соразтворителя, такого как предпочтительно метанол, этанол или изопропиловый спирт, в качестве подвижной фазы.

Одну группу соединений в соответствии с данным вариантом осуществления составляют соединения формулы (I-8f), которые представляют собой соединения формулы (I-8) или любой из предпочтительных вариантов осуществления соединений формулы (I-8), которые представляют собой энантиомеры, которые элюируются вторыми во время хирального разделения рацемата с помощью препаративной хроматографии с применением иммобилизованных хиральных фаз на основе

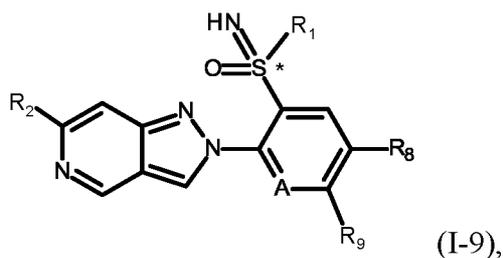
амилозы (CHIRALPAK® IA, CHIRALPAK® IG) или на основе целлюлозы (CHIRALPAK® IC).

5 Одну группу соединений в соответствии с данным вариантом осуществления составляют соединения формулы (I-8g), которые представляют собой соединения формулы (I-8) или любой из предпочтительных вариантов осуществления соединений формулы (I-8), которые представляют собой энантимеры, которые элюируются вторыми во время хирального разделения рацемата с помощью препаративной SFC (сверхкритической жидкостной хроматографии) с применением иммобилизованных хиральных фаз на основе амилозы (CHIRALPAK® IA, CHIRALPAK® IG) или на основе целлюлозы (CHIRALPAK® IC).

15 Одну группу соединений в соответствии с данным вариантом осуществления составляют соединения формулы (I-8h), которые представляют собой соединения формулы (I-8) или любой из предпочтительных вариантов осуществления соединений формулы (I-8), которые представляют собой энантимеры, которые элюируются вторыми во время хирального разделения рацемата с помощью препаративной SFC с применением иммобилизованных хиральных фаз на основе амилозы (CHIRALPAK® IA, CHIRALPAK® IG) или на основе целлюлозы (CHIRALPAK® IC) и с применением 20 сверхкритического CO₂ и спиртового соразтворителя, такого как предпочтительно метанол, этанол или изопропиловый спирт, в качестве подвижной фазы.

25 Другую группу соединений в соответствии с данным вариантом осуществления составляют соединения формулы (I-8i), которые представляют собой соединения формулы (I-8) или любой из предпочтительных вариантов осуществления соединений формулы (I-8), или полученные, или получаемые стереоспецифическим способом путем осуществления иминирования стереогенных сульфанильных производных, которые получены путем осуществления стереоселективного окисления соответствующих сульфаниловых соединений, как дополнительно изложено и описано 30 в варианте осуществления 31.

Другая предпочтительная группа соединений формулы I представлена соединениями формулы I-9,



где R_1 , R_2 , R_8 , R_9 , S^* и A определены для формулы I выше.

5 В одной предпочтительной группе соединений формулы I-9 A представляет собой СН или N; R_1 представляет собой этил, пропил или изопропил; R_2 представляет собой C_1 - C_2 галогеналкил, C_1 - C_2 галогеналкилсульфанил, C_1 - C_2 галогеналкилсульфинил или C_1 - C_2 галогеналкилсульфонил; R_9 представляет собой водород, метил или этил; R_8 представляет собой цианоизопропокси, цианоизопропил или цианоциклопропил.

10 В другой предпочтительной группе соединений формулы I-9 A представляет собой СН или N; R_1 представляет собой этил; R_2 представляет собой C_1 - C_2 фторалкил, трифторметилсульфанил, трифторметилсульфинил, трифторметилсульфонил, дифторметилсульфанил, дифторметилсульфинил или дифторметилсульфонил; R_9 представляет собой водород или метил, предпочтительно R_9 представляет собой водород; R_8 представляет собой цианоизопропокси, цианоизопропил или цианоциклопропил.

15

В соединениях формулы I-9 и всех предпочтительных вариантах осуществления соединений формулы I-9, указанных выше, если не указано другое, R_1 , R_2 , R_8 , R_9 , S^* и A определены для формулы I выше; предпочтительно A представляет собой СН или N, более предпочтительно A представляет собой N; R_1 представляет собой этил; R_2 представляет собой трифторметил, пентафторэтил или трифторметилсульфанил; предпочтительно R_2 представляет собой трифторметил; R_9 представляет собой водород; R_8 представляет собой 1-циано-1-метилэтокси, 1-циано-1-метилэтил или 1-цианоциклопропил.

20

25

Одну группу соединений в соответствии с данным вариантом осуществления составляют соединения формулы (I-9a), которые представляют собой соединения

формулы (I-9) или любой из предпочтительных вариантов осуществления соединений формулы (I-9), где S* находится в R-конфигурации.

5 Одну группу соединений в соответствии с данным вариантом осуществления составляют соединения формулы (I-9b), которые представляют собой соединения формулы (I-9) или любой из предпочтительных вариантов осуществления соединений формулы (I-9), где S* находится в S-конфигурации.

10 Одну группу соединений в соответствии с данным вариантом осуществления составляют соединения формулы (I-9c), которые представляют собой соединения формулы (I-9) или любой из предпочтительных вариантов осуществления соединений формулы (I-9), которые представляют собой энантиомеры, которые элюируются первыми во время хирального разделения рацемата с помощью препаративной хроматографии с применением иммобилизованных хиральных фаз на основе амилозы (CHIRALPAK® IA, CHIRALPAK® IG) или на основе целлюлозы (CHIRALPAK® IC).

20 Одну группу соединений в соответствии с данным вариантом осуществления составляют соединения формулы (I-9d), которые представляют собой соединения формулы (I-9) или любой из предпочтительных вариантов осуществления соединений формулы (I-9), которые представляют собой энантиомеры, которые элюируются первыми во время хирального разделения рацемата с помощью препаративной SFC (сверхкритической жидкостной хроматографии) с применением иммобилизованных хиральных фаз на основе амилозы (CHIRALPAK® IA, CHIRALPAK® IG) или на основе целлюлозы (CHIRALPAK® IC).

30 Одну группу соединений в соответствии с данным вариантом осуществления составляют соединения формулы (I-9e), которые представляют собой соединения формулы (I-9) или любой из предпочтительных вариантов осуществления соединений формулы (I-9), которые представляют собой энантиомеры, которые элюируются первыми во время хирального разделения рацемата с помощью препаративной SFC с применением иммобилизованных хиральных фаз на основе амилозы (CHIRALPAK® IA, CHIRALPAK® IG) или на основе целлюлозы (CHIRALPAK® IC) и с применением

сверхкритического CO₂ и спиртового соразтворителя, такого как предпочтительно метанол, этанол или изопропиловый спирт, в качестве подвижной фазы.

5 Одну группу соединений в соответствии с данным вариантом осуществления составляют соединения формулы (I-9f), которые представляют собой соединения формулы (I-9) или любой из предпочтительных вариантов осуществления соединений формулы (I-9), которые представляют собой энантимеры, которые элюируются вторыми во время хирального разделения рацемата с помощью препаративной хроматографии с применением иммобилизованных хиральных фаз на основе амилозы (CHIRALPAK® IA, CHIRALPAK® IG) или на основе целлюлозы (CHIRALPAK® IC).

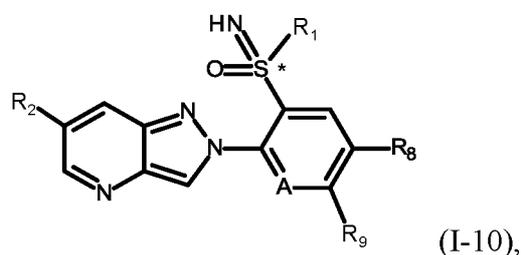
15 Одну группу соединений в соответствии с данным вариантом осуществления составляют соединения формулы (I-9g), которые представляют собой соединения формулы (I-9) или любой из предпочтительных вариантов осуществления соединений формулы (I-9), которые представляют собой энантимеры, которые элюируются вторыми во время хирального разделения рацемата с помощью препаративной SFC (сверхкритической жидкостной хроматографии) с применением иммобилизованных хиральных фаз на основе амилозы (CHIRALPAK® IA, CHIRALPAK® IG) или на основе целлюлозы (CHIRALPAK® IC).

25 Одну группу соединений в соответствии с данным вариантом осуществления составляют соединения формулы (I-9h), которые представляют собой соединения формулы (I-9) или любой из предпочтительных вариантов осуществления соединений формулы (I-9), которые представляют собой энантимеры, которые элюируются вторыми во время хирального разделения рацемата с помощью препаративной SFC с применением иммобилизованных хиральных фаз на основе амилозы (CHIRALPAK® IA, CHIRALPAK® IG) или на основе целлюлозы (CHIRALPAK® IC) и с применением сверхкритического CO₂ и спиртового соразтворителя, такого как предпочтительно метанол, этанол или изопропиловый спирт, в качестве подвижной фазы.

Другую группу соединений в соответствии с данным вариантом осуществления составляют соединения формулы (I-9i), которые представляют собой соединения

формулы (I-9) или любой из предпочтительных вариантов осуществления соединений формулы (I-9), или полученные, или получаемые стереоспецифическим способом путем осуществления иминирования стереогенных сульфинильных производных, которые получены путем осуществления стереоселективного окисления соответствующих сульфаниловых соединений, как дополнительно изложено и описано в варианте осуществления 31.

Другая предпочтительная группа соединений формулы I представлена соединениями формулы I-10,



где R_1 , R_2 , R_8 , R_9 , S^* и A определены для формулы I выше.

В одной предпочтительной группе соединений формулы I-10 A представляет собой CH или N ; R_1 представляет собой этил, пропил или изопропил; R_2 представляет собой C_1 - C_2 галогеналкил, C_1 - C_2 галогеналкилсульфанил, C_1 - C_2 галогеналкилсульфинил или C_1 - C_2 галогеналкилсульфонил; R_9 представляет собой водород, метил или этил; R_8 представляет собой цианоизопропокси, цианоизопропил или цианоциклопропил.

В другой предпочтительной группе соединений формулы I-10 A представляет собой CH или N ; R_1 представляет собой этил; R_2 представляет собой C_1 - C_2 фторалкил, трифторметилсульфанил, трифторметилсульфинил, трифторметилсульфонил, дифторметилсульфанил, дифторметилсульфинил или дифторметилсульфонил; R_9 представляет собой водород или метил, предпочтительно R_9 представляет собой водород; R_8 представляет собой цианоизопропокси, цианоизопропил или цианоциклопропил.

В соединениях формулы I-10 и всех предпочтительных вариантах осуществления соединений формулы I-10, указанных выше, если не указано другое, R_1 , R_2 , R_8 , R_9 , S^* и A определены для формулы I выше; предпочтительно A представляет собой CH или N ,

более предпочтительно А представляет собой N; R₁ представляет собой этил; R₂ представляет собой трифторметил, пентафторэтил или трифторметилсульфанил; предпочтительно R₂ представляет собой трифторметил; R₉ представляет собой водород; R₈ представляет собой 1-циано-1-метилэтокси, 1-циано-1-метилэтил или 1-цианоциклопропил.

Одну группу соединений в соответствии с данным вариантом осуществления составляют соединения формулы (I-10a), которые представляют собой соединения формулы (I-10) или любой из предпочтительных вариантов осуществления соединений формулы (I-10), где S* находится в R-конфигурации.

Одну группу соединений в соответствии с данным вариантом осуществления составляют соединения формулы (I-10b), которые представляют собой соединения формулы (I-10) или любой из предпочтительных вариантов осуществления соединений формулы (I-10), где S* находится в S-конфигурации.

Одну группу соединений в соответствии с данным вариантом осуществления составляют соединения формулы (I-10c), которые представляют собой соединения формулы (I-10) или любой из предпочтительных вариантов осуществления соединений формулы (I-10), которые представляют собой энантимеры, которые элюируются первыми во время хирального разделения рацемата с помощью препаративной хроматографии с применением иммобилизованных хиральных фаз на основе амилозы (CHIRALPAK® IA, CHIRALPAK® IG) или на основе целлюлозы (CHIRALPAK® IC).

Одну группу соединений в соответствии с данным вариантом осуществления составляют соединения формулы (I-10d), которые представляют собой соединения формулы (I-10) или любой из предпочтительных вариантов осуществления соединений формулы (I-10), которые представляют собой энантимеры, которые элюируются первыми во время хирального разделения рацемата с помощью препаративной SFC (сверхкритической жидкостной хроматографии) с применением иммобилизованных хиральных фаз на основе амилозы (CHIRALPAK® IA, CHIRALPAK® IG) или на основе целлюлозы (CHIRALPAK® IC).

Одну группу соединений в соответствии с данным вариантом осуществления составляют соединения формулы (I-10e), которые представляют собой соединения формулы (I-10) или любой из предпочтительных вариантов осуществления соединений формулы (I-10), которые представляют собой энантиомеры, которые элюируются первыми во время хирального разделения рацемата с помощью препаративной SFC с применением иммобилизованных хиральных фаз на основе амилозы (CHIRALPAK® IA, CHIRALPAK® IG) или на основе целлюлозы (CHIRALPAK® IC) и с применением сверхкритического CO₂ и спиртового соразтворителя, такого как предпочтительно метанол, этанол или изопропиловый спирт, в качестве подвижной фазы.

Одну группу соединений в соответствии с данным вариантом осуществления составляют соединения формулы (I-10f), которые представляют собой соединения формулы (I-10) или любой из предпочтительных вариантов осуществления соединений формулы (I-10), которые представляют собой энантиомеры, которые элюируются вторыми во время хирального разделения рацемата с помощью препаративной хроматографии с применением иммобилизованных хиральных фаз на основе амилозы (CHIRALPAK® IA, CHIRALPAK® IG) или на основе целлюлозы (CHIRALPAK® IC).

Одну группу соединений в соответствии с данным вариантом осуществления составляют соединения формулы (I-10g), которые представляют собой соединения формулы (I-10) или любой из предпочтительных вариантов осуществления соединений формулы (I-10), которые представляют собой энантиомеры, которые элюируются вторыми во время хирального разделения рацемата с помощью препаративной SFC (сверхкритической жидкостной хроматографии) с применением иммобилизованных хиральных фаз на основе амилозы (CHIRALPAK® IA, CHIRALPAK® IG) или на основе целлюлозы (CHIRALPAK® IC).

Одну группу соединений в соответствии с данным вариантом осуществления составляют соединения формулы (I-10h), которые представляют собой соединения формулы (I-10) или любой из предпочтительных вариантов осуществления соединений формулы (I-10), которые представляют собой энантиомеры, которые элюируются

вторыми во время хирального разделения рацемата с помощью препаративной SFC с применением иммобилизированных хиральных фаз на основе амилозы (CHIRALPAK® IA, CHIRALPAK® IG) или на основе целлюлозы (CHIRALPAK® IC) и с применением сверхкритического CO₂ и спиртового соразтворителя, такого как предпочтительно метанол, этанол или изопропиловый спирт, в качестве подвижной фазы.

Другую группу соединений в соответствии с данным вариантом осуществления составляют соединения формулы (I-10i), которые представляют собой соединения формулы (I-10) или любой из предпочтительных вариантов осуществления соединений формулы (I-10), или полученные, или получаемые стереоспецифическим способом путем осуществления иминирования стереогенных сульфанильных производных, которые получены путем осуществления стереоселективного окисления соответствующих сульфаниловых соединений, как дополнительно изложено и описано в варианте осуществления 31.

Другую предпочтительную группу соединений формулы I составляют соединения, где Q, R₃, R₄ и X₁ определены для формулы I (выше);

A представляет собой CH или N, предпочтительно A представляет собой N;

S* представляет собой стереогенный атом серы, который находится в R- или S-конфигурации;

R₁ представляет собой этил, пропил или изопропил; предпочтительно R₁ представляет собой этил;

R₂ представляет собой трифторметил, пентафторэтил или трифторметилсульфанил; предпочтительно R₂ представляет собой трифторметил;

R₈ представляет собой 1-циано-1-метилэтокси, 1-циано-1-метилэтил или 1-цианоциклопропил;

R₉ представляет собой водород или метил; предпочтительно R₉ представляет собой водород; и,

в случае соединений, где Q представляет собой Q₁ или Q₄, G₁ представляет собой N, и G₂ представляет собой CH, или G₁ представляет собой CH, и G₂ представляет собой N, или одновременно G₁ и G₂ представляют собой N; и,

в случае соединений, где Q представляет собой Q₂, G₂ представляет собой N или CH; или

их агрохимически приемлемая соль, стереоизомер, энантиомер, таутомер или N-оксид.

Другую особенно предпочтительную группу соединений формулы I составляют соединения, представленные соединениями формул I-1, I-2, I-3, I-4, I-5, I-6, I-7, I-8, I-9 или I-10, где

A представляет собой CH или N, предпочтительно A представляет собой N;

S* представляет собой стереогенный атом серы, который находится в R- или S-конфигурации;

R₁ представляет собой этил, пропил или изопропил; предпочтительно R₁ представляет собой этил;

R₂ представляет собой трифторметил, пентафторэтил или трифторметилсульфанил; предпочтительно R₂ представляет собой трифторметил;

R₈ представляет собой 1-циано-1-метилэтокси, 1-циано-1-метилэтил или 1-цианоциклопропил;

R₉ представляет собой водород или метил; предпочтительно R₉ представляет собой водород; и

в случае соединений формул I-1, I-2, I-3 и I-4 R₃ представляет собой метил; и в случае соединений формулы I-4 R₄ представляет собой этил, метокси или циклопропил.

Предпочтительную группу соединений формулы I составляют соединения, представленные абсолютной конфигурацией (S) в стереогенном центре, который представляет собой атом серы (S*).

Другую предпочтительную группу соединений формулы I составляют соединения или в (S)-энантиомерно чистой форме, или которые характеризуются S-энантиомерным избытком (э. и.), составляющим по меньшей мере 40%, например, по меньшей мере 50%, 60%, 70% или 80%, предпочтительно по меньшей мере 90%, более предпочтительно по меньшей мере 95%, еще более предпочтительно по меньшей мере 98% и наиболее предпочтительно по меньшей мере 99%.

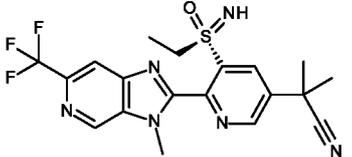
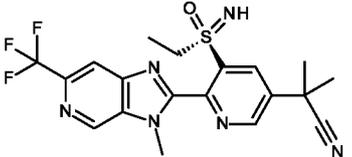
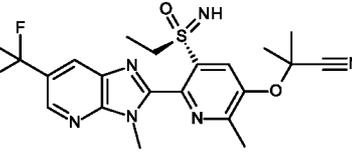
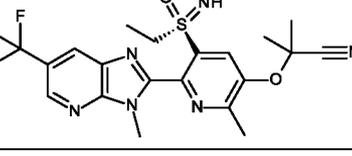
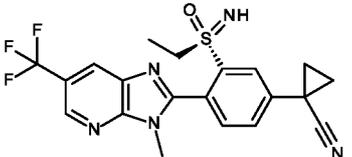
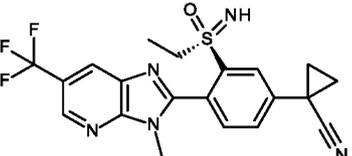
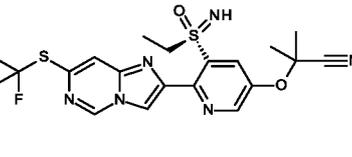
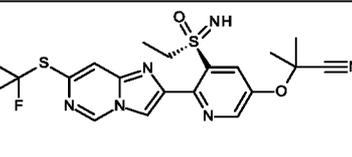
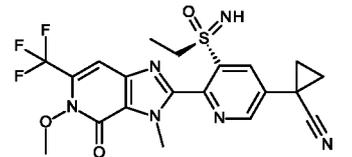
Другую предпочтительную группу соединений формулы I составляют соединения, представленные абсолютной конфигурацией (R) в стереогенном центре, который представляет собой атом серы (S*).

Другую предпочтительную группу соединений формулы I составляют соединения или в (R)-энантимерно чистой форме, или которые характеризуются R-энантиомерным избытком (э. и.), составляющим по меньшей мере 40%, например, по меньшей мере 50%, 60%, 70% или 80%, предпочтительно по меньшей мере 90%, более предпочтительно по меньшей мере 95%, еще более предпочтительно по меньшей мере 98% и наиболее предпочтительно по меньшей мере 99%.

Исключительную предпочтительную группу соединений формулы I составляют соединения, представленные (S)- или (R)-энантиомерами соединений P1 – P19, определенными в таблице Y, представленной ниже.

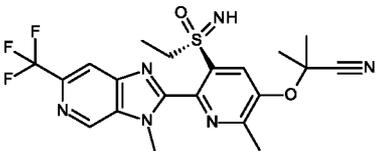
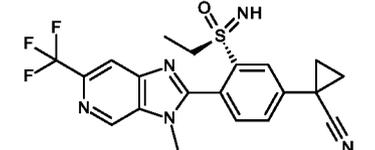
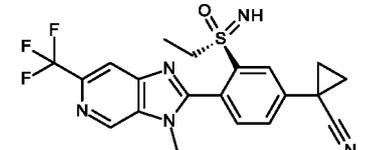
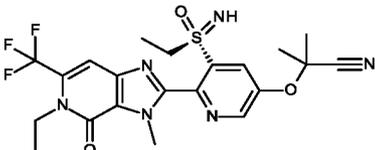
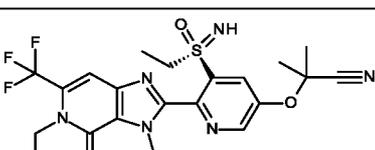
Таблица Y

№	Название согласно IUPAC	Структуры	Конфигурация при атоме серы
(S)-P1	(S)-2-[[6-[5-циклопропил-3-метил-4-оксо-6-(трифторметил)имидазо[4,5-с]пиридин-2-ил]-5-(этилсульфонимидоил)-3-пиридил]окси]-2-метилпропаннитрил		S
(R)-P1	(R)-2-[[6-[5-циклопропил-3-метил-4-оксо-6-(трифторметил)имидазо[4,5-с]пиридин-2-ил]-5-(этилсульфонимидоил)-3-пиридил]окси]-2-метилпропаннитрил		R
(S)-P2	(S)-1-[5-(этилсульфонимидоил)-6-[7-метил-3-(трифторметил)имидазо[4,5-с]пиридазин-6-ил]-3-пиридил]циклопропанкарбонитрил		S
(R)-P2	(R)-1-[5-(этилсульфонимидоил)-6-[7-метил-3-(трифторметил)имидазо[4,5-с]пиридазин-6-ил]-3-пиридил]циклопропанкарбонитрил		R
(S)-P3	(S)-2-[[5-(этилсульфонимидоил)-6-[7-(трифторметил)имидазо[1,2-а]пиридин-2-ил]-3-пиридил]окси]-2-метилпропаннитрил		S
(R)-P3	(R)-2-[[5-(этилсульфонимидоил)-6-[7-(трифторметил)имидазо[1,2-а]пиридин-2-ил]-3-пиридил]окси]-2-метилпропаннитрил		R

№	Название согласно IUPAC	Структуры	Конфигурация при атоме серы
(S)-P4	(S)-2-[5-(этилсульфонимидоил)-6-[3-метил-6-(трифторметил)имидазо[4,5-с]пиридин-2-ил]-3-пиридил]-2-метилпропаннитрил		S
(R)-P4	(R)-2-[5-(этилсульфонимидоил)-6-[3-метил-6-(трифторметил)имидазо[4,5-с]пиридин-2-ил]-3-пиридил]-2-метилпропаннитрил		R
(S)-P5	(S)-2-[[5-(этилсульфонимидоил)-2-метил-6-[3-метил-6-(трифторметил)имидазо[4,5-б]пиридин-2-ил]-3-пиридил]окси]-2-метилпропаннитрил		S
(R)-P5	(R)-2-[[5-(этилсульфонимидоил)-2-метил-6-[3-метил-6-(трифторметил)имидазо[4,5-б]пиридин-2-ил]-3-пиридил]окси]-2-метилпропаннитрил		R
(S)-P6	(S)-1-[3-(этилсульфонимидоил)-4-[3-метил-6-(трифторметил)имидазо[4,5-б]пиридин-2-ил]фенил]циклопропанкарбонитрил		S
(R)-P6	(R)-1-[3-(этилсульфонимидоил)-4-[3-метил-6-(трифторметил)имидазо[4,5-б]пиридин-2-ил]фенил]циклопропанкарбонитрил		R
(S)-P7	(S)-2-[[5-(этилсульфонимидоил)-6-[7-(трифторметилсульфанил)имидазо[1,2-с]пиримидин-2-ил]-3-пиридил]окси]-2-метилпропаннитрил		S
(R)-P7	(R)-2-[[5-(этилсульфонимидоил)-6-[7-(трифторметилсульфанил)имидазо[1,2-с]пиримидин-2-ил]-3-пиридил]окси]-2-метилпропаннитрил		R
(S)-P8	(S)-1-[5-(этилсульфонимидоил)-6-[5-метокси-3-метил-4-оксо-6-(трифторметил)имидазо[4,5-с]пиридин-2-ил]-3-пиридил]циклопропанкарбонитрил		S

№	Название согласно IUPAC	Структуры	Конфигурация при атоме серы
(R)-P8	(R)-1-[5-(этилсульфонимидоил)-6-[5-метокси-3-метил-4-оксо-6-(трифторметил)имидазо[4,5-с]пиридин-2-ил]-3-пиридил]циклопропанкарбонитрил		R
(S)-P9	(S)-2-[[5-(этилсульфонимидоил)-6-[3-метил-6-(трифторметил)имидазо[4,5-b]пиридин-2-ил]-3-пиридил]окси]-2-метилпропаннитрил		S
(R)-P9	(R)-2-[[5-(этилсульфонимидоил)-6-[3-метил-6-(трифторметил)имидазо[4,5-b]пиридин-2-ил]-3-пиридил]окси]-2-метилпропаннитрил		R
(S)-P10	(S)-1-[5-(этилсульфонимидоил)-6-[3-метил-6-(трифторметил)имидазо[4,5-с]пиридин-2-ил]-3-пиридил]циклопропанкарбонитрил		S
(R)-P10	(R)-1-[5-(этилсульфонимидоил)-6-[3-метил-6-(трифторметил)имидазо[4,5-с]пиридин-2-ил]-3-пиридил]циклопропанкарбонитрил		R
(S)-P11	(S)-2-[[5-(этилсульфонимидоил)-6-[7-(трифторметил)имидазо[1,2-с]пиримидин-2-ил]-3-пиридил]окси]-2-метилпропаннитрил		S
(R)-P11	(R)-2-[[5-(этилсульфонимидоил)-6-[7-(трифторметил)имидазо[1,2-с]пиримидин-2-ил]-3-пиридил]окси]-2-метилпропаннитрил		R
(S)-P12	(S)-2-[5-(этилсульфонимидоил)-6-[3-метил-6-(трифторметил)имидазо[4,5-b]пиридин-2-ил]-3-пиридил]-2-метилпропаннитрил		S
(R)-P12	(R)-2-[5-(этилсульфонимидоил)-6-[3-метил-6-(трифторметил)имидазо[4,5-b]пиридин-2-ил]-3-пиридил]-2-метилпропаннитрил		R

№	Название согласно IUPAC	Структуры	Конфигурация при атоме серы
(S)-P13	(S)-2-[[5-(этилсульфонимидоил)-6-[3-метил-6-(трифторметил)имидазо[4,5-с]пиридин-2-ил]-3-пиридил]окси]-2-метилпропаннитрил		S
(R)-P13	(R)-2-[[5-(этилсульфонимидоил)-6-[3-метил-6-(трифторметил)имидазо[4,5-с]пиридин-2-ил]-3-пиридил]окси]-2-метилпропаннитрил		R
(S)-P14	(S)-1-[6-[5-этил-3-метил-4-оксо-6-(трифторметил)имидазо[4,5-с]пиридин-2-ил]-5-(этилсульфонимидоил)-3-пиридил]циклопропанкарбонитрил		S
(R)-P14	(R)-1-[6-[5-этил-3-метил-4-оксо-6-(трифторметил)имидазо[4,5-с]пиридин-2-ил]-5-(этилсульфонимидоил)-3-пиридил]циклопропанкарбонитрил		R
(S)-P15	(S)-2-[[5-(этилсульфонимидоил)-6-[7-метил-3-(трифторметил)имидазо[4,5-с]пиридазин-6-ил]-3-пиридил]окси]-2-метилпропаннитрил		S
(R)-P15	(R)-2-[[5-(этилсульфонимидоил)-6-[7-метил-3-(трифторметил)имидазо[4,5-с]пиридазин-6-ил]-3-пиридил]окси]-2-метилпропаннитрил		R
(S)-P16	(S)-1-[5-(этилсульфонимидоил)-6-[3-метил-6-(трифторметил)имидазо[4,5-б]пиридин-2-ил]-3-пиридил]циклопропанкарбонитрил		S
(R)-P16	(R)-1-[5-(этилсульфонимидоил)-6-[3-метил-6-(трифторметил)имидазо[4,5-б]пиридин-2-ил]-3-пиридил]циклопропанкарбонитрил		R
(S)-P17	(S)-2-[[5-(этилсульфонимидоил)-2-метил-6-[3-метил-6-(трифторметил)имидазо[4,5-с]пиридин-2-ил]-3-пиридил]окси]-2-метилпропаннитрил		S

№	Название согласно IUPAC	Структуры	Конфигурация при атоме серы
(R)-P17	(R)-2-[[5-(этилсульфонимидоил)-2-метил-6-[3-метил-6-(трифторметил)имидазо[4,5-с]пиридин-2-ил]-3-пиридил]окси]-2-метилпропаннитрил		R
(S)-P18	(S)-1-[3-(этилсульфонимидоил)-4-[3-метил-6-(трифторметил)имидазо[4,5-с]пиридин-2-ил]фенил]циклопропанкарбонитрил		S
(R)-P18	(R)-1-[3-(этилсульфонимидоил)-4-[3-метил-6-(трифторметил)имидазо[4,5-с]пиридин-2-ил]фенил]циклопропанкарбонитрил		R
(S)-P19	(S)-2-[[6-[5-этил-3-метил-4-оксо-6-(трифторметил)имидазо[4,5-с]пиридин-2-ил]-5-(этилсульфонимидоил)-3-пиридил]окси]-2-метилпропаннитрил		S
(R)-P19	(R)-2-[[6-[5-этил-3-метил-4-оксо-6-(трифторметил)имидазо[4,5-с]пиридин-2-ил]-5-(этилсульфонимидоил)-3-пиридил]окси]-2-метилпропаннитрил		R

Другую предпочтительную группу соединений формулы I составляют соединения, предусматривающие энантимеры, которые элюируются первыми во время хирального разделения с помощью препаративной хроматографии с применением 5 иммобилизованных хиральных фаз на основе амилозы (CHIRALPAK® IA, CHIRALPAK® IG) или на основе целлюлозы (CHIRALPAK® IC).

Другую предпочтительную группу соединений формулы I составляют соединения, предусматривающие энантимеры, которые элюируются первыми во время хирального разделения с помощью препаративной SFC (сверхкритической жидкостной хроматографии) с применением иммобилизованных хиральных фаз на основе амилозы (CHIRALPAK® IA, CHIRALPAK® IG) или на основе целлюлозы (CHIRALPAK® IC). 10

Другую предпочтительную группу соединений формулы I составляют соединения, предусматривающие энантиомеры, которые элюируются первыми во время хирального разделения с помощью препаративной SFC с применением иммобилизованных хиральных фаз на основе амилозы (CHIRALPAK® IA, CHIRALPAK® IG) или на основе целлюлозы (CHIRALPAK® IC) и с применением сверхкритического CO₂ и спиртового сорастворителя, такого как предпочтительно метанол, этанол или изопропиловый спирт, в качестве подвижной фазы.

Другую предпочтительную группу соединений формулы I составляют соединения, которые характеризуются энантиомерным избытком (э. и.) энантиомера, который элюируется первым, составляющим по меньшей мере 40%, например, по меньшей мере 50%, 60%, 70% или 80%, предпочтительно по меньшей мере 90%, более предпочтительно по меньшей мере 95%, еще более предпочтительно по меньшей мере 98% и наиболее предпочтительно по меньшей мере 99%.

Другую предпочтительную группу соединений формулы I составляют соединения, предусматривающие энантиомеры, которые элюируются вторыми во время хирального разделения с помощью препаративной хроматографии с применением иммобилизованных хиральных фаз на основе амилозы (CHIRALPAK® IA, CHIRALPAK® IG) или на основе целлюлозы (CHIRALPAK® IC).

Другую предпочтительную группу соединений формулы I составляют соединения, предусматривающие энантиомеры, которые элюируются вторыми во время хирального разделения рацемата с помощью препаративной SFC (сверхкритической жидкостной хроматографии) с применением иммобилизованных хиральных фаз на основе амилозы (CHIRALPAK® IA, CHIRALPAK® IG) или на основе целлюлозы (CHIRALPAK® IC).

Другую предпочтительную группу соединений формулы I составляют соединения, предусматривающие энантиомеры, которые элюируются вторыми во время хирального разделения рацемата с помощью препаративной SFC с применением иммобилизованных хиральных фаз на основе амилозы (CHIRALPAK® IA, CHIRALPAK® IG) или на основе целлюлозы (CHIRALPAK® IC) и с применением

сверхкритического CO₂ и спиртового соразтворителя, такого как предпочтительно метанол, этанол или изопропиловый спирт, в качестве подвижной фазы.

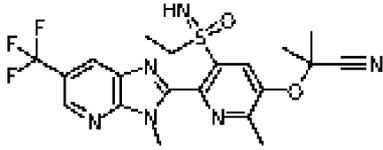
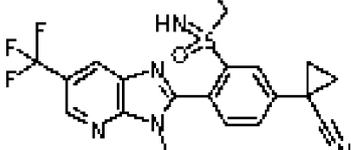
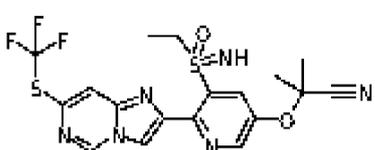
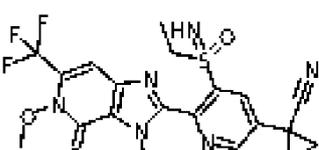
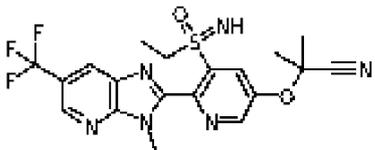
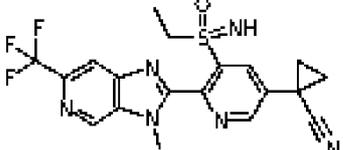
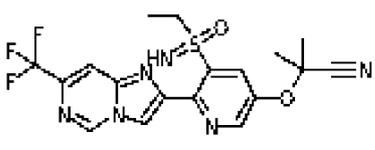
5 Другую предпочтительную группу соединений формулы I составляют соединения, которые характеризуются энантимерным избытком (э. и.) энантиомера, который элюируется вторым, составляющим по меньшей мере 40%, например, по меньшей мере 50%, 60%, 70% или 80%, предпочтительно по меньшей мере 90%, более предпочтительно по меньшей мере 95%, еще более предпочтительно по меньшей мере 98% и наиболее предпочтительно по меньшей мере 99%.

10

Исключительную предпочтительную группу соединений формулы I составляют соединения, представленные энантиомерами, которые элюируются первыми (от P1-A до P19-A) или элюируются вторыми (от P1-B до P19-B), соединений P1 – P19, определенные в таблице Z, представленной ниже.

15 Таблица Z.

№	Название согласно IUPAC	Структуры	Энантиомер, который элюируется первым	Энантиомер, который элюируется вторым
P1	2-[[6-[5-циклопропил-3-метил-4-оксо-6-(трифторметил)имидазо[4,5-с]пиридин-2-ил]-5-(этилсульфонимидоил)-3-пиридил]окси]-2-метилпропаннитрил		P1-A	P1-B
P2	1-[5-(этилсульфонимидоил)-6-[7-метил-3-(трифторметил)имидазо[4,5-с]пиридазин-6-ил]-3-пиридил]циклопропанкарбонитрил		P2-A	P2-B
P3	2-[[5-(этилсульфонимидоил)-6-[7-(трифторметил)имидазо[1,2-а]пиридин-2-ил]-3-пиридил]окси]-2-метилпропаннитрил		P3-A	P3-B
P4	2-[5-(этилсульфонимидоил)-6-[3-метил-6-(трифторметил)имидазо[4,5-с]пиридин-2-ил]-3-пиридил]-2-метилпропаннитрил		P4-A	P4-B

№	Название согласно IUPAC	Структуры	Энантиомер, который элюируется первым	Энантиомер, который элюируется вторым
P5	2-[[5-(этилсульфонимидоил)-2-метил-6-(3-метил-6-(трифторметил)имидазо[4,5-b]пиридин-2-ил]-3-пиридил)окси]-2-метилпропаннитрил		P5-A	P5-B
P6	1-[3-(этилсульфонимидоил)-4-[3-метил-6-(трифторметил)имидазо[4,5-b]пиридин-2-ил]фенил]циклопропанкарбонитрил		P6-A	P6-B
P7	2-[[5-(этилсульфонимидоил)-6-[7-(трифторметилсульфанил)имидазо[1,2-c]пиримидин-2-ил]-3-пиридил]окси]-2-метилпропаннитрил		P7-A	P7-B
P8	1-[5-(этилсульфонимидоил)-6-[5-метокси-3-метил-4-оксо-6-(трифторметил)имидазо[4,5-c]пиридин-2-ил]-3-пиридил]циклопропанкарбонитрил		P8-A	P8-B
P9	2-[[5-(этилсульфонимидоил)-6-[3-метил-6-(трифторметил)имидазо[4,5-b]пиридин-2-ил]-3-пиридил]окси]-2-метилпропаннитрил		P9-A	P9-B
P10	1-[5-(этилсульфонимидоил)-6-[3-метил-6-(трифторметил)имидазо[4,5-c]пиридин-2-ил]-3-пиридил]циклопропанкарбонитрил		P10-A	P10-B
P11	2-[[5-(этилсульфонимидоил)-6-[7-(трифторметил)имидазо[1,2-c]пиримидин-2-ил]-3-пиридил]окси]-2-метилпропаннитрил		P11-A	P11-B

№	Название согласно IUPAC	Структуры	Энантиомер, который элюируется первым	Энантиомер, который элюируется вторым
P12	2-[5-(этилсульфонимидоил)-6-[3-метил-6-(трифторметил)имидазо[4,5-b]пиридин-2-ил]-3-пиридил]-2-метилпропаннитрил		P12-A	P12-B
P13	2-[[5-(этилсульфонимидоил)-6-[3-метил-6-(трифторметил)имидазо[4,5-c]пиридин-2-ил]-3-пиридил]окси]-2-метилпропаннитрил		P13-A	P13-B
P14	1-[6-[5-Этил-3-метил-4-оксо-6-(трифторметил)имидазо[4,5-c]пиридин-2-ил]-5-(этилсульфонимидоил)-3-пиридил]циклопропанкарбонитрил		P14-A	P14-B
P15	2-[[5-(этилсульфонимидоил)-6-[7-метил-3-(трифторметил)имидазо[4,5-c]пиридазин-6-ил]-3-пиридил]окси]-2-метилпропаннитрил		P15-A	P15-B
P16	1-[5-(этилсульфонимидоил)-6-[3-метил-6-(трифторметил)имидазо[4,5-b]пиридин-2-ил]-3-пиридил]циклопропанкарбонитрил		P16-A	P16-B
P17	2-[[5-(этилсульфонимидоил)-2-метил-6-[3-метил-6-(трифторметил)имидазо[4,5-c]пиридин-2-ил]-3-пиридил]окси]-2-метилпропаннитрил		P17-A	P17-B
P18	1-[3-(этилсульфонимидоил)-4-[3-метил-6-(трифторметил)имидазо[4,5-c]пиридин-2-ил]фенил]циклопропанкарбонитрил		P18-A	P18-B

№	Название согласно IUPAC	Структуры	Энантиомер, который элюируется первым	Энантиомер, который элюируется вторым
P19	2-[[6-[5-этил-3-метил-4-оксо-6-(трифторметил)имидазо[4,5-с]пиридин-2-ил]-5-(этилсульфонимидоил)-3-пиридил]окси]-2-метилпропаннитрил		P19-A	P19-B

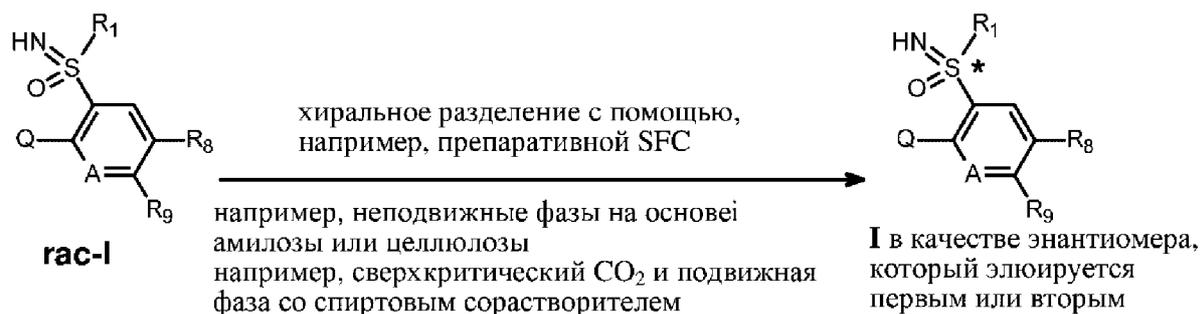
Соединения в соответствии с настоящим изобретением могут обладать любым рядом преимуществ, в том числе, среди прочего, преимущественными уровнями биологической активности для защиты растений от насекомых или превосходными свойствами для применения в качестве агрохимических активных ингредиентов (например, более высокой биологической активностью, различающейся биологической активностью энантиомера или энантиомерно обогащенной композиции и рацемата, различающейся биологической активностью (R)-энантиомера или (R)-энантиомерно обогащенной композиции и (S)-энантиомера или (S)-энантиомерно обогащенной композиции, преимущественным спектром активности, повышенным профилем безопасности, улучшенными физико-химическими свойствами или повышенной биоразлагаемостью или экологическим профилем). В частности, неожиданно было обнаружено, что определенные соединения формулы (I) могут проявлять благоприятный профиль безопасности в отношении нецелевых членистоногих, в частности, опылителей, таких как медоносные пчелы, одиночные пчелы и шмели. Наиболее конкретно, *Apis mellifera*.

В другом аспекте в настоящем изобретении предусмотрена композиция, содержащая инсектицидно, акарицидно, нематоцидно или моллюскоцидно эффективное количество соединения формулы (I) или его агрохимически приемлемой соли, стереоизомера, энантиомера, таутомера или N-оксида, определенных в любом из вариантов осуществления 1-34 (выше) или в любом из вариантов осуществления для соединений формул I-1, I-2, I-3, I-4, I-5, I-6, I-7, I-8, I-9 или I-10, и необязательно вспомогательное средство или разбавитель.

В другом аспекте в настоящем изобретении предусмотрен способ борьбы с насекомыми, клещами, нематодами или моллюсками и их контроля, который

- предусматривает применение по отношению к вредителю, по отношению к месту обитания вредителя или по отношению к растению, восприимчивому к воздействию вредителя, инсектицидно, акарицидно, нематоцидно или моллюскоцидно эффективного количества соединения формулы (I) или его агрохимически приемлемой соли, стереоизомера, энантиомера, таутомера или N-оксида, определенных в любом из вариантов осуществления 1-34 (выше) или в любом из вариантов осуществления для соединений формул I-1, I-2, I-3, I-4, I-5, I-6, I-7, I-8, I-9 или I-10 (выше), или композиции, определенной выше.
- 10 В еще одном дополнительном аспекте в настоящем изобретении предусмотрен способ защиты материала для размножения растений от воздействия насекомых, клещей, нематод или моллюсков, который предусматривает обработку материала для размножения или участка, где посажен материал для размножения, с помощью композиции, определенной выше.
- 15 Способ получения соединений формулы I по настоящему изобретению осуществляют с помощью способов, известных специалистам в данной области. Отдельные энантиомеры могут быть получены, например, i) с помощью энантиоселективных превращений, ii) путем разделения рацемической или частично обогащенной смеси с помощью фракционной кристаллизации с энантиомерно обогащенным реагентом, iii) с помощью хроматографического разделения энантиомеров с применением энантиомерно обогащенной подвижной фазы.
- 20 Отдельные энантиомеры могут быть получены с помощью хроматографического разделения рацемической смеси на хиральной неподвижной фазе с применением препаративной высокоэффективной жидкостной хроматографии (HPLC, в режиме нормальной или обращенной фазы) или с применением препаративной сверхкритической жидкостной хроматографии (SFC).
- 25 Соединения формулы I в форме энантиомера, который элюируется первым или вторым, где Q, R₁, R₂, G₁, G₂, X₁, R₃, R₄, R₈, R₉, S* и A являются такими, как определено в формуле I выше,

Схема 1.

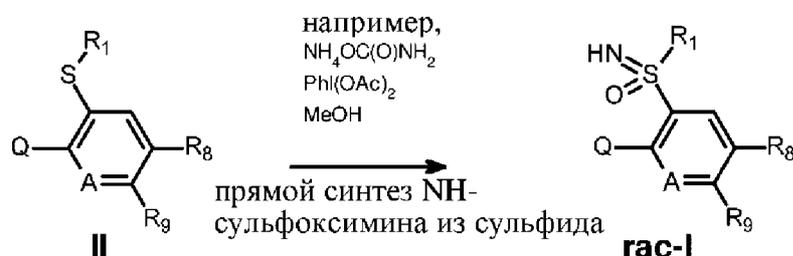


могут быть получены (схема 1) во время хирального разделения рацемической смеси соединений формулы I (rac-I), где Q, R₁, R₂, G₁, G₂, X₁, R₃, R₄, R₈, R₉ и A являются такими, как определено в формуле I выше, например, с помощью препаративной SFC с применением иммобилизованных хиральных фаз на основе амилозы (таких как CHIRALPAK® IA, CHIRALPAK® IG) или на основе целлюлозы (таких как CHIRALPAK® IC) и с применением сверхкритического CO₂ и спиртового соразтворителя, такого как предпочтительно метанол, этанол или изопропиловый спирт, в качестве подвижной фазы.

10

Рацемические смеси соединений формулы I (rac-I), где Q, R₁, R₂, G₁, G₂, X₁, R₃, R₄, R₈, R₉ и A являются такими, как определено в формуле I выше,

Схема 2.

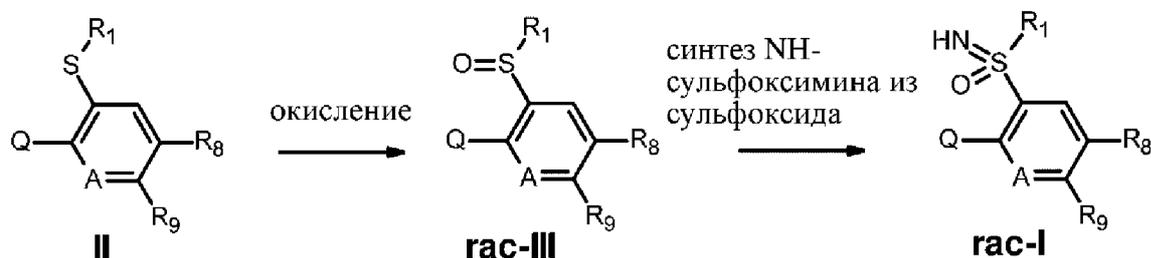


могут быть получены (схема 2) путем осуществления реакции сульфидных соединений формулы II, где Q, R₁, R₂, G₁, G₂, X₁, R₃, R₄, R₈, R₉ и A являются такими, как определено в формуле I, с подходящим источником азота, таким как, например, аммиак, карбамат аммония или ацетат аммония (предпочтительно карбамат аммония), в присутствии реагентов на основе гипервалентного йода, таких как диацетоксийодбензол, в растворителях, таких как толуол, ацетонитрил или метанол, при температурах от 0 до 100°C, предпочтительно около комнатной температуры, аналогично описаниям, представленным, например, в Chem. Commun. 53, 348-351; 2017 (и ссылок, процитированных в нем).

20

В качестве альтернативы рацемические смеси соединений формулы I (rac-I), где Q, R₁, R₂, G₁, G₂, X₁, R₃, R₄, R₈, R₉ и A являются такими, как определено в формуле I выше,

Схема 3.



5 могут быть получены (схема 3) путем осуществления реакции рацемических сульфоксидных соединений формулы rac-III, где Q, R₁, R₂, G₁, G₂, X₁, R₃, R₄, R₈, R₉ и A являются такими, как определено в формуле I выше, с подходящим источником азота, необязательно в присутствии окислителя, необязательно в присутствии металлического катализатора и необязательно в растворителе, таком как ацетонитрил, дихлорметан или
 10 метанол. Примеры типичных условий иминирования включают O-динитрофенилгидроксиламин/Rh₂(esp)₄, NH₂COONH₄/PhI(OAc)₂, NaN₃/H₂SO₄ или O-мезитилсульфонилгидроксиламин (MSH). Примеры таких превращений описаны в Chemistry – A European Journal 2021, 27, 17293-17321 (и ссылках, процитированных в нем), Chemical Communications 2014, 50, 9687-9689 и Angewandte Chemie, International
 15 Edition 2016, 55, 7203-7207 (и ссылках, процитированных в нем).

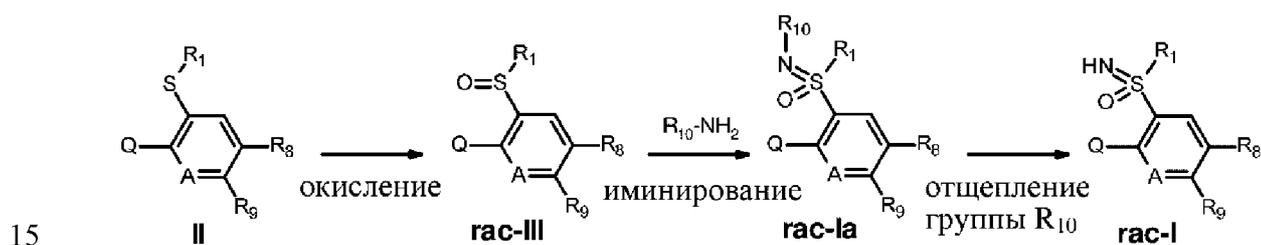
Особый интерес представляют способы с применением производного гидроксиламина, такого как O-(4-нитробензоил)гидроксиламинтрифлатная кислота (также известная как трифлат O-(4-нитробензоил)гидроксиламмония или трифторметансульфонат O-(4-нитробензоил)гидроксиламмония), и катализатора на основе железа, такого как сульфат
 20 железа(II) (FeSO₄) или фталоцианин железа(II) (фталоцианин Fe(II), FePc), в растворителе, таком как ацетонитрил или дихлорметан, как описано в Angewandte Chemie International Edition 2018, 57 324-327.

Соединения формулы rac-III, где Q, R₁, R₂, G₁, G₂, X₁, R₃, R₄, R₈, R₉ и A являются
 25 такими, как определено в формуле I выше, могут быть получены способами осуществления реакции окисления соответствующих сульфидных соединений формулы II, где Q, R₁, R₂, G₁, G₂, X₁, R₃, R₄, R₈, R₉ и A являются такими, как определено в формуле I, с использованием реагентов, таких как, например, среди прочих окислителей, м-хлорпероксибензойная кислота (mCPBA), пероксид водорода, оксон,

периодат натрия, гипохлорит натрия или трет-бутилгипохлорит. Реакцию окисления обычно проводят в присутствии растворителя. Примеры растворителя, применяемого в реакции, включают алифатические галогенированные углеводороды, такие как дихлорметан и хлороформ; спирты, такие как метанол и этанол; уксусную кислоту; воду; а также их смеси. Количество окислителя, которое будет применяться в реакции, предпочтительно составляет от 1 до 1,2 моля в пересчете на 1 моль сульфидных соединений II, с получением сульфоксидных соединений гас-III.

Соединения формулы гас-Ia могут также служить для получения соединений формулы гас-I, как проиллюстрировано на схеме 4. Такие соединения формулы гас-Ia, где Q, R₁, R₂, G₁, G₂, X₁, R₃, R₄, R₈, R₉ и A являются такими, как определено в формуле I выше, и где R₁₀ представляет собой циано или -C(O)R₂₅, в котором R₂₅ представляет собой водород, C₁-C₆алкил, C₁-C₆галогеналкил, C₁-C₆алкокси или C₁-C₆галогеналкокси,

Схема 4.



могут быть получены (схема 4) путем подвергания соединений формулы гас-III, где Q, R₁, R₂, G₁, G₂, X₁, R₃, R₄, R₈, R₉ и A являются такими, как определено в формуле I выше, условиям реакции иминирования с применением реагента R₁₀-NH₂ (R₁₀ определен выше), как описано, например, в Н. Okamura, С. Bolm, Org. Lett. 2004, 6, 1305-1307; Н. Okamura, С. Bolm, Chem. Lett. 2004, 33, 482-487; D. Leca, K. Song, M. Amatore, L. Fensterbank, E. Lacôte, M. Malacria, Chem. Eur. J. 2004, 10, 906-916 или M. Reggelin, С. Zur, Synthesis, 2000, 1-64. Типичные реагенты/условия для иминирования могут включать способы, предусматривающие катализ металлом [см. O.G. Mancheno, С. Bolm, Chem. Eur. J. 2007, 13, 6674-6681], например, R₁₀-N₃/FeCl₂, R₁₀-NH₂/Fe(acac)₃/PhI=O, PhI=N-R₁₀/Fe(OTf)₂, PhI=N-R₁₀/CuOTf, PhI=N-R₁₀/Cu(OTf)₂, PhI=N-R₁₀/CuPF₆, PhI(OAc)₂/R₁₀-NH₂/MgO/Rh₂(OAc)₄, R₁₀NHOMs/FeCl₂ или оксазиридины (например, трет-бутиловый сложный эфир 3-(4-цианофенил)оксазиридин-2-карбоновой кислоты).

20

25

Особенный интерес представляют способы иминирования без участия металла, предусматривающие R₁₀-NH₂ и окислитель, например, PhI(OAc)₂/R₁₀-NH₂, как описано

30

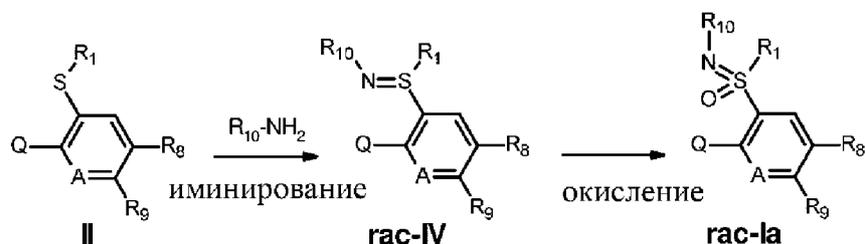
в G.Y. Cho, C. Bolm, *Tetrahedron Lett.*, 2005, 46, 8007-8008; или N-бромсукцинимид (NBS)/R₁₀-NH₂ и основание, такое как трет-бутоксид натрия или калия, как описано в C. Bolm et al., *Synthesis*, 2010, № 17, 2922-2925. Окислители, такие как N-иодсукцинимид (NIS) или иод, могут также применяться в качестве альтернативы, как описано, например, в O.G. Mancheno, C. Bolm, *Org. Lett.* 2007, 9, 3809-3811. Пример гипохлоритных солей, применяемых в качестве окислителя, таких как гипохлорит натрия NaOCl или гипохлорит кальция Ca(OCl)₂, был описан в WO2008/1060.

Соединение формулы гас-Ia, где Q, R₁, R₂, G₁, G₂, X₁, R₃, R₄, R₈, R₉ и A являются такими, как определено в формуле I выше, и где R₁₀ представляет собой CN, может быть превращено в соединение формулы гас-Ia, где R₁₀ представляет собой C(O)CF₃, путем обработки трифторуксусным ангидридом в растворителе, таком как дихлорметан, как описано, например, в O.G. Mancheno, C. Bolm, *Org. Lett.* 2007, 9, 3809-3811.

Соединение формулы гас-Ia, где Q, R₁, R₂, G₁, G₂, X₁, R₃, R₄, R₈, R₉ и A являются такими, как определено в формуле I выше, и где R₁₀ представляет собой C(O)CF₃, может быть превращено в соединение формулы гас-I (отщепление группы R₁₀) путем обработки основанием, таким как карбонат натрия или калия, в полярном протонном растворителе, таком как метанол или этанол, как описано, например, в H. Okamura, C. Bolm, *Org. Lett.* 2004, 6, 1305-1307.

Наоборот, порядок двух стадий окисления/иминирования, раскрытых на схеме 4, для получения соединений формулы гас-Ia может быть обращен, как показано на схеме 5.

25 Схема 5.



Окисление соединений формулы гас-IV, где Q, R₁, R₂, G₁, G₂, X₁, R₃, R₄, R₈, R₉ и A являются такими, как определено в формуле I выше, и в которых R₁₀ является таким, как определено на схеме 4, для получения соединений формулы гас-Ia (заместители

определены на схеме 4) может быть осуществлено при условиях, уже описанных выше, или которые могут альтернативно предусматривать, например, KMnO_4 , NaMnO_4 , mCPBA , $\text{NaIO}_4/\text{RuO}_2$, $\text{NaIO}_4/\text{RuCl}_3$, H_2O_2 или оксон. В частности, применение солей рутения в комбинации с периодатами щелочных металлов и в качестве альтернативы

5 применение перманганатов щелочных металлов было описано в WO2008/097235 и WO2008/106006.

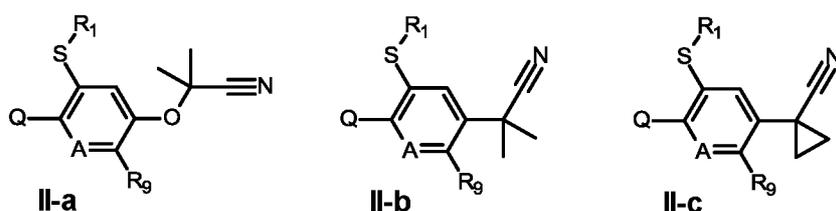
Соединения формулы гас-IV, где Q, R_1 , R_2 , G_1 , G_2 , X_1 , R_3 , R_4 , R_8 , R_9 и A являются такими, как определено в формуле I выше, и в которых R_{10} представляет собой циано или $-\text{C}(\text{O})\text{R}_{25}$, в котором R_{25} представляет собой водород, C_1 - C_6 алкил, C_1 - C_6 галогеналкил, C_1 - C_6 алкокси или C_1 - C_6 галогеналкокси, могут быть получены путем

10 подвергания соединений формулы II, где Q, R_1 , R_2 , G_1 , G_2 , X_1 , R_3 , R_4 , R_8 , R_9 и A являются такими, как определено в формуле I, условиям реакции иминирования, как описано выше на схеме 4.

15 Подгруппа соединений формулы II, где R_8 представляет собой цианоизопропокси, более конкретно 1-циано-1-метилэтокси, и где Q, R_1 , R_2 , G_1 , G_2 , X_1 , R_3 , R_4 , R_9 и A являются такими, как определено в формуле I выше, может быть определена как соединения формулы II-a (схема 6). Такие соединения II-a или известны, или могут

20 быть получены с помощью способов или аналогично способам, описанным, например, в WO2020/084075, JP2019/081800, WO2018/206348 и WO2018/197315.

Схема 6.



Подгруппа соединений формулы II, где R_8 представляет собой цианоизопропил, более конкретно 1-циано-1-метилэтил, и где Q, R_1 , R_2 , G_1 , G_2 , X_1 , R_3 , R_4 , R_9 и A являются такими, как определено в формуле I выше, может быть определена как соединения

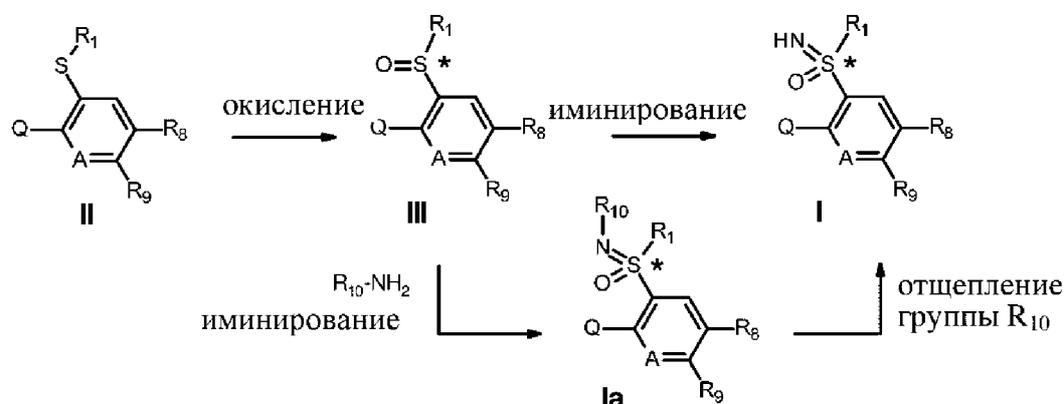
25 формулы II-b (схема 6). Такие соединения II-b или известны, или могут быть получены с помощью способов или аналогично способам, описанным, например, в WO2019/053182, WO2018/153778 и WO2018/077565.

Подгруппа соединений формулы II, где R₈ представляет собой цианоциклопропил, более конкретно 1-цианоциклопропил, и где Q, R₁, R₂, G₁, G₂, X₁, R₃, R₄, R₉ и A являются такими, как определено в формуле I выше, может быть определена как соединения формулы II-с (схема 6). Такие соединения II-с или известны, или могут
 5 быть получены с помощью способов или аналогично способам, описанным, например, в WO2019/234158, WO2019/059244, WO2018/108726, WO2018/077565, WO2017/089190, WO2016/121997 и WO2016/071214.

В качестве альтернативы отдельные энантиомеры могут быть получены способами
 10 стереоселективного синтеза.

Соединения формулы I в форме отдельного энантиомера, где Q, R₁, R₂, G₁, G₂, X₁, R₃, R₄, R₈, R₉ и A являются такими, как определено в формуле I выше, и где S* представляет собой стереогенный атом серы в R- или S-конфигурации, при этом
 15 указанный S*-центр находится или в энантиомерно чистой, или в энантиомерно обогащенной форме,

Схема 7.

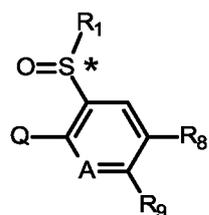


могут быть получены (схема 7) путем адаптации условий, уже описанных на схемах 3 и
 4.

20 Соединения формулы III в форме отдельного энантиомера, где Q, R₁, R₂, G₁, G₂, X₁, R₃, R₄, R₈, R₉ и A являются такими, как определено в формуле I выше, и где S* представляет собой стереогенный атом серы в R- или S-конфигурации, при этом указанный S*-центр находится или в энантиомерно чистой, или в энантиомерно
 25 обогащенной форме, могут быть получены из соединений формулы II (заместители определены на схемах 3 и 4) с помощью способов стереоселективного синтеза хиральных сульфинильных соединений, предпочтительно в форме каталитического

энантиоселективного синтеза сульфоксидов, путем обработки окислительным средством, например, H_2O_2 или $tBuOOH$, в присутствии соли металла и хирального лиганда. Примеры подходящих комбинаций соли металла и лиганда включают $Fe(acac)_3$, $V(O)(acac)_2$ или $Cu(acac)_2$ с основанием Шиффа, образованным из производных салицилового альдегида и хиральных аминоспиртов, или комплексы саленов или $Ti(OiPr)_4$ в комбинации со сложным эфиром винной кислоты, таким как диизопропиловый или диэтиловый сложный эфир винной кислоты. Реакция может быть осуществлена в растворителе или смеси растворителей, таких как дихлорметан, толуол, хлорбензол или метанол, и необязательно в присутствии добавок, таких как 4-метоксибензойная кислота, бензойная кислота, триэтиламин, диизопропилетиламин или вода. Примеры таких реакций описаны в *Chemical Reviews* 2020, 120, 4578-4611, *Chemistry – A European Journal* 2005, 11, 1086-1092, *Angewandte Chemie (International Edition in English)* 1996, 34, 2640-2642, *Journal of Organic Chemistry* 2012, 3288-3296 и *Synlett* 1996, 404-406. В качестве альтернативы в качестве катализатора вместо комплекса металла и лиганда может применяться хиральная кислота, такая как дериватизированная из BINOL хиральная фосфорная кислота, как описано в *Journal of American Chemical Society* 2012, 134, 10765-10768.

Соединения формулы III в форме отдельного энантиомера,



(III),

где

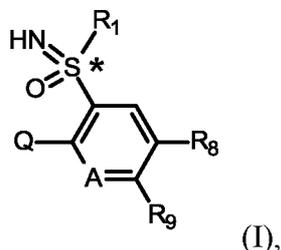
$Q, R_1, R_2, G_1, G_2, X_1, R_3, R_4, R_8, R_9$ и A являются такими, как определено в формуле I; и S^* представляет собой стереогенный атом серы в *R*- или *S*-конфигурации, при этом указанный S^* -центр находится или в энантиомерно чистой, или в энантиомерно обогащенной форме,

являются новыми, специально разработанными для получения соединений формулы I в соответствии с настоящим изобретением и, таким образом, представляют собой дополнительную цель настоящего изобретения. Предпочтительные определения и предпочтительные варианты осуществления заместителей соединений формулы I также

применимы для соединений формулы III. В частности, предпочтительными являются энантиомеры сульфинильных соединений формулы III, перечисленных в таблице P(SO).

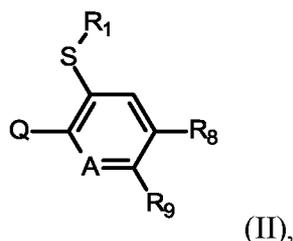
- 5 Соединения формулы I в форме отдельного энантиомера, где Q, R₁, R₂, G₁, G₂, X₁, R₃, R₄, R₈, R₉ и A являются такими, как определено в формуле I выше, и где S* представляет собой стереогенный атом серы в R- или S-конфигурации, при этом указанный S*-центр находится или в энантимерно чистой, или в энантимерно обогащенной форме, могут быть получены из соединений формулы III в форме
- 10 отдельного энантиомера, где Q, R₁, R₂, G₁, G₂, X₁, R₃, R₄, R₈, R₉ и A являются такими, как определено в формуле I выше, и где S* представляет собой стереогенный атом серы в R- или S-конфигурации, при этом указанный S*-центр находится или в энантимерно чистой, или в энантимерно обогащенной форме, с помощью способов стадии иминирования посредством стереоспецифического переноса азота или в прямом
- 15 режиме (условия, аналогичные таковым на схеме 3), или путем использования реагента формулы R₁₀-NH₂ (R₁₀ определен выше) и опосредующего участия соединений формулы Ia, где Q, R₁, R₂, G₁, G₂, X₁, R₃, R₄, R₈, R₉ и A являются такими, как определено в формуле I выше, и где S* представляет собой стереогенный атом серы в R- или S-конфигурации, при этом указанный S*-центр находится или в энантимерно чистой,
- 20 или в энантимерно обогащенной форме (условия, аналогичные таковым на схеме 4).

В другом аспекте в настоящем изобретении предусмотрен способ получения соединения формулы (I),



- 25 где Q, R₁, R₂, G₁, G₂, X₁, R₃, R₄, R₈, R₉ и A определены для формулы (I), и где S* представляет собой стереогенный атом серы в R- или S-конфигурации, при этом указанный S*-центр находится или в энантимерно чистой, или в энантимерно обогащенной форме;
- при этом способ включает:

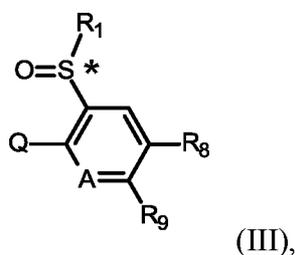
(A) стереоселективное окисление сульфанилового соединения формулы (II),



где Q, R₁, R₂, G₁, G₂, X₁, R₃, R₄, R₈, R₉ и A определены для формулы (I),

5 в присутствии окислителя, в присутствии металлического катализатора, в присутствии хирального лиганда, необязательно в присутствии подходящей добавки, в подходящем растворителе (или разбавителе)

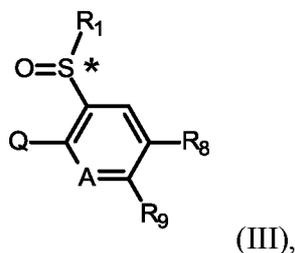
с получением сульфинильного соединения формулы (III),



где Q, R₁, R₂, G₁, G₂, X₁, R₃, R₄, R₈, R₉ и A определены для формулы (I), и

10 где S* представляет собой стереогенный атом серы в R- или S-конфигурации, при этом указанный S*-центр находится или в энантимерно чистой, или в энантимерно обогащенной форме; и

(B) осуществление реакции сульфинильного соединения формулы (III),



15 где Q, R₁, R₂, G₁, G₂, X₁, R₃, R₄, R₈, R₉ и A определены для формулы (I), и где S* представляет собой стереогенный атом серы в R- или S-конфигурации, при этом указанный S*-центр находится или в энантимерно чистой, или в энантимерно обогащенной форме;

20 с иминирующим реагентом в присутствии катализатора, необязательно в присутствии подходящей добавки, в подходящем растворителе (или разбавителе)

с получением сульфоксиминового соединения формулы (I) стереоспецифическим способом.

5 Что касается способа получения соединений формулы (I), включающего стадии (A) и (B) выше, преимущества и предпочтительные варианты осуществления заместителей соединений формулы (I), описанных выше, также применимы для соединений формулы (II) и (III).

10 В одном предпочтительном варианте осуществления стадия (A) включает окисление сульфаниловых соединений формулы (II), перечисленных на каждой стадии 1 из примеров получения P1 – P19.

В другом особенно предпочтительном варианте осуществления стадия (B) включает осуществление реакции энантиомеров сульфанильных соединений формулы III, перечисленных в таблице P(SO), с иминирующим реагентом.

15 Что касается способа получения соединений формулы (III), стадии (A) выше, ниже приведены примеры подходящих и предпочтительных окислителей, подходящих и предпочтительных металлических катализаторов, подходящих и предпочтительных хиральных лигандов, подходящих и предпочтительных добавок, а также примеры 20 подходящих и предпочтительных условий реакций (таких как растворитель (или разбавитель) и температура).

В одном варианте осуществления стадия (A) включает:

25 (A-1) окисление сульфанилового соединения формулы (II) в присутствии окислителя, в присутствии металлического катализатора, в присутствии хирального лиганда, в подходящем растворителе (или разбавителе).

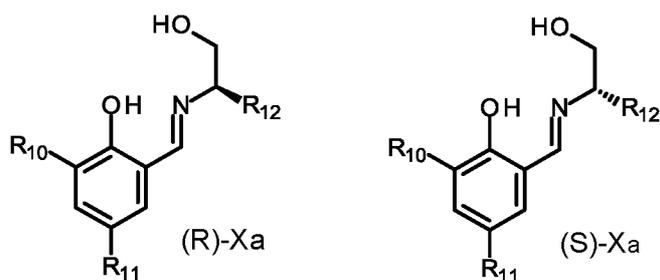
В другом варианте осуществления стадия (A) включает:

30 (A-2) окисление сульфанилового соединения формулы (II) в присутствии окислителя, в присутствии металлического катализатора, в присутствии хирального лиганда, в присутствии подходящей добавки, в подходящем растворителе (или разбавителе).

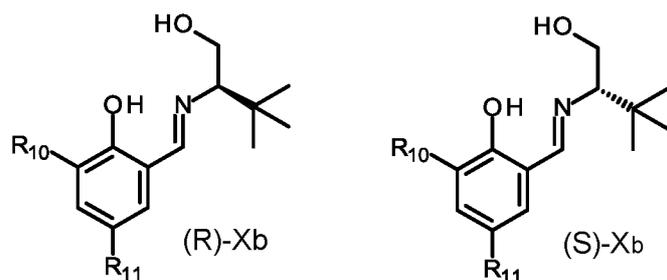
Примерами подходящих и предпочтительных окислителей для стадий (A-1) и (A-2) являются неорганические пероксиды, такие как пероксид водорода, или органические пероксиды, такие как трет-бутилгидропероксид. Предпочтительно окислитель представляет собой пероксид водорода или трет-бутилгидропероксид, еще более предпочтительно пероксид водорода. Соотношение применяемого окислителя в пересчете на сульфаниловое соединение формулы (II) находится в диапазоне от 8:1 до 0,8:1, предпочтительно от 5:1 до 1:1, более предпочтительно от 3:1 до 1:1.

Примерами подходящих и предпочтительных металлических катализаторов для стадий (A-1) и (A-2) являются ацетилацетонат железа(III) ($\text{Fe}(\text{acac})_3$) или ванадилацетилацетонат (оксиацетилацетонат ванадия(IV), $\text{VO}(\text{acac})_2$). Предпочтительно металлический катализатор представляет собой ацетилацетонат железа(III). Применяемое количество соли металла в пересчете на сульфаниловое соединение формулы (II) находится в диапазоне от 0,01 до 10 моль%, предпочтительно от 0,1 до 8 мол. %, наиболее предпочтительно от 1 до 6 мол. %.

Пример подходящих и предпочтительных хиральных лигандов для стадий (A-1) и (A-2) получают из *N,N'*-бис(салицилиден)этилендиамина (саленовый лиганд) или выбирают из оснований Шиффа, образованных из производных салицилового альдегида и хиральных аминоспиртов. Предпочтительно хиральный лиганд представляет собой основание Шиффа, образованное из производных салицилового альдегида и хиральных аминоспиртов, представленное соединением формулы (R)-Xa или (S)-Xa,



где R_{10} и R_{11} независимо друг от друга выбраны из C_1 - C_4 алкила и галогена, и R_{12} представляет собой трет-бутил, изопропил, необязательно замещенный фенил или необязательно замещенный бензил. Более предпочтительно хиральный лиганд представляет собой соединение формулы (R)-Xb или (S)-Xb,



где R_{10} и R_{11} независимо друг от друга выбраны из трет-бутила, хлора, брома и йода; еще более предпочтительно выбраны из хлора, брома и йода. Особенно предпочтительным является соединение хирального лиганда формулы (R)-Xb или (S)-Xb, где R_{10} является одинаковым с R_{11} и выбран из хлора, брома и йода. Соотношение применяемого хирального лиганда (преимущественно соединения формулы (R)-Xb или (S)-Xb) в пересчете на металлический катализатор (предпочтительно ацетилацетонат железа(III)) находится в диапазоне от 10:1 до 0,5:1, предпочтительно от 3:1 до 1:1, более предпочтительно составляет около 2:1.

10

Примеры подходящих и предпочтительных добавок для стадии (A-2) представляют собой карбоциклические кислоты. Предпочтительно добавка представляет собой бензойную кислоту, необязательно моно-, ди- или тризамещенную метилом, этилом, изопропилом, метокси или диметиламином, необязательно в форме литиевой, натриевой или калиевой соли. Более предпочтительно добавка представляет собой метоксибензойную кислоту (необязательно в форме литиевой, натриевой или калиевой соли), еще более предпочтительно 4-метоксибензойную кислоту. Применяемое количество добавки в пересчете на сульфаниловое соединение формулы (II) находится в диапазоне от 0,01 до 10 мол. %, предпочтительно от 0,1 до 8 мол. %, наиболее предпочтительно от 1 до 5 мол. %

20

В одном варианте осуществления, который относится к способу получения соединений формулы (III) в соответствии с настоящим изобретением, стадии (A), примерами подходящих растворителей (или разбавителей) являются алифатические галогенизированные углеводороды, такие как дихлорметан, 1,2-дихлорэтан или хлороформ, или ароматические углеводороды, галогенуглеводороды или алкоксиуглеводороды, такие как толуол, ксилол, хлорбензол, метоксибензол или

25

бензотрифторид, или их смеси. Предпочтительно растворитель (или разбавитель) представляет собой толуол или хлорбензол, еще более предпочтительно толуол.

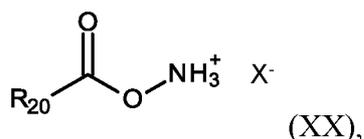
5 В одном варианте осуществления, который относится к способу получения соединений формулы (III) в соответствии с настоящим изобретением, стадии (A), реакцию преимущественно осуществляют при температуре, находящейся в диапазоне от примерно -20°C до примерно 50°C , предпочтительно от примерно -5°C до примерно 30°C . В предпочтительном варианте осуществления реакцию осуществляют при температуре в диапазоне от 0°C до 25°C .

10 Что касается способа получения соединений формулы (I), стадии (B) выше, ниже приведены примеры подходящих и предпочтительных иминирующих реагентов, примеры подходящих и предпочтительных катализаторов, подходящих и предпочтительных добавок, а также примеры подходящих и предпочтительных условий реакции (таких как растворитель (или) разбавитель) и температура).

В одном варианте осуществления стадия (B) включает:

20 (B-1) осуществление реакции сульфинильного соединения формулы (III) с иминирующим реагентом в присутствии катализатора в подходящем растворителе (или разбавителе).

25 Примерами подходящих и предпочтительных иминирующих реагентов для стадии (B-1) являются *O*-мезитилсульфонилгидроксиламин (MSH) или производные гидроксиламина. Предпочтительно иминирующий реагент представляет собой производное гидроксиламина, более предпочтительно *O*-ацилированную соль гидроксиламина, представленную соединением формулы (XX),



30 где R_{20} представляет собой трет-бутил или фенил, моно- или дизамещенный нитро, и X^- представляет собой сульфонатную или гидросульфатную группу. Более предпочтительно иминирующий реагент представляет собой соединение формулы (XX), где R_{20} представляет собой 4-нитрофенил или 2,4-динитрофенил, и X^-

представляет собой сульфатную группу. Еще более предпочтительно соединение иминирующего реагента формулы (XX) выбрано из трифторметансульфоната *O*-(4-нитробензоил)гидроксиламмония и метансульфоната *O*-(4-нитробензоил)гидроксиламмония. Особенно предпочтительным в качестве соединения иминирующего реагента формулы (XX) является трифторметансульфонат *O*-(4-нитробензоил)гидроксиламмония. Соотношение применяемого иминирующего реагента в пересчете на сульфинильное соединение формулы (III) находится в диапазоне от 8:1 до 0,8:1, предпочтительно от 5:1 до 1:1, более предпочтительно от 3:1 до 1:1.

10

Примерами подходящих и предпочтительных катализаторов для стадий (B-1) являются сульфат железа(II) (FeSO_4), ацетат железа(II) ($\text{Fe}(\text{OAc})_2$) или ацетилацетонат железа(II) ($\text{Fe}(\text{acac})_2$), каждый из которых в комбинации с или 2,2'-бипиридином, или 1,10-фенантролином, или фталоцианином железа(II) (фталоцианином $\text{Fe}(\text{II})$, FePc).

15 Предпочтительно металлический катализатор представляет собой фталоцианин железа(II). Применяемое количество катализатора в пересчете на сульфинильное соединение формулы (III) находится в диапазоне от 0,01 до 10 мол. %, предпочтительно от 0,1 до 8 мол. %, наиболее предпочтительно от 1 до 5 мол. %.

20 В одном варианте осуществления, который относится к способу получения соединений формулы (I) в соответствии с настоящим изобретением, стадии (B), примерами подходящих растворителей (или разбавителей) являются ацетонитрил, метанол, этанол, изопропанол, 2,2,2-трифторэтанол (TFE), гексафторизопропанол (HFIP), дихлорметан (DCM), толуол, этилацетат, уксусная кислота, вода или их смеси. Предпочтительно
25 растворитель (или разбавитель) представляет собой ацетонитрил, уксусную кислоту или дихлорметан, еще более предпочтительно дихлорметан.

В одном варианте осуществления, который относится к способу получения соединений формулы (I) в соответствии с настоящим изобретением, стадии (B), реакцию
30 предпочтительно осуществляют при температуре, находящейся в диапазоне от примерно -20°C до примерно 50°C , предпочтительно от примерно -5°C до примерно 30°C . В предпочтительном варианте осуществления реакцию осуществляют в диапазоне от 10°C до 25°C .

Продукты, полученные посредством способа в соответствии с настоящим изобретением, где S* представляет собой стереогенный атом серы в R- или S-конфигурации, при этом указанный S*-центр находится в энантимерно обогащенной форме, характеризуются соотношением энантимеров (R:S или S: R, в зависимости от конкретного случая), составляющим от 50,5:49,5 до 99,5:0,5, предпочтительно от 75:25 до 99:1, более предпочтительно от 85:15 до 98:2.

В одном варианте осуществления сульфинильные соединения формулы (III), полученные посредством стадии (A) способа в соответствии с настоящим изобретением, где S* представляет собой стереогенный атом серы в R- или S-конфигурации, при этом указанный S*-центр находится в энантимерно обогащенной форме, характеризуются соотношением энантимеров (R:S или S:R, в зависимости от конкретного случая), составляющим от 50,5:49,5 до 99,5:0,5, предпочтительно от 75:25 до 99:1, более предпочтительно от 85:15 до 98:2.

В другом варианте осуществления сульфоксиминовые соединения формулы (I), полученные посредством стадии (B) способа в соответствии с настоящим изобретением, где S* представляет собой стереогенный атом серы в R- или S-конфигурации, при этом указанный S*-центр находится в энантимерно обогащенной форме, характеризуются соотношением энантимеров (R:S или S:R, в зависимости от конкретного случая), составляющим от 50,5:49,5 до 99,5:0,5, предпочтительно от 75:25 до 99:1, более предпочтительно от 85:15 до 98:2.

В еще одном варианте осуществления соотношение энантимеров (R:S или S:R, в зависимости от конкретного случая) таких сульфинильных соединений формулы (III), полученных посредством стадии (A), и соотношение энантимеров (R:S или S:R, в зависимости от конкретного случая) таких сульфоксиминовых соединений формулы (I), полученных с помощью стадии (B), является по существу одинаковым. В одном варианте осуществления соотношение энантимеров сульфинильных соединений формулы (III), полученных с помощью стадии (A), и соотношение энантимеров сульфоксиминовых соединений формулы (I), полученных с помощью стадии (B), находится в пределах (\pm) плюс или минус одного процента друг относительно друга;

находится в пределах (\pm) плюс или минус 0,5 процента друг относительно друга; более предпочтительно находится в пределах (\pm) плюс или минус 0,1 процента друг относительно друга.

5 Не обязательно энантиомерная чистота таких продуктов, сульфинильных соединений формулы (III) и/или сульфоксиминовых соединений формулы (I), может быть повышена с помощью способа кристаллизации, известного специалистам в данной области, предпочтительно с помощью кристаллизации из органического растворителя или смеси органического растворителя и воды.

10

Способы определения энантиомерного избытка известны специалистам в данной области и включают, например, применение HPLC с использованием хиральных неподвижных фаз и ЯМР с хиральными реагентами, обеспечивающими смещение.

15 Реагенты можно вводить в реакцию в присутствии основания. Примерами подходящих оснований являются гидроксиды щелочных металлов или щелочноземельных металлов, гидриды щелочных металлов или щелочноземельных металлов, амиды щелочных металлов или щелочноземельных металлов, алкоксиды щелочных металлов или щелочноземельных металлов, ацетаты щелочных металлов или щелочноземельных металлов, карбонаты щелочных металлов или щелочноземельных металлов, диалкиламины щелочных металлов или щелочноземельных металлов или алкилсилиламины щелочных металлов или щелочноземельных металлов, алкиламины, алкилендиамины, свободные или N-алкилированные насыщенные или ненасыщенные циклоалкиламины, основные гетероциклы, гидроксиды аммония и карбоциклические амины. Примерами, которые можно упомянуть, являются гидроксид натрия, гидрид натрия, амид натрия, метоксид натрия, ацетат натрия, карбонат натрия, трет-бутоксид калия, гидроксид калия, карбонат калия, гидрид калия, диизопропиламид лития, бис(триметилсилил)амид калия, гидрид кальция, триэтиламин, диизопропилэтиламин, триэтилендиамин, циклогексиламин, N-циклогексил-N,N-диметиламин, N,N-диэтиланилин, пиридин, 4-(N,N-диметиламино)пиридин, хинуклидин, N-метилморфолин, бензилтриметиламмония гидроксид и 1,8-дизабицикло[5.4.0]ундец-7-ен (DBU).

Реагенты можно вводить в реакцию друг с другом как есть, т. е. без добавления растворителя или разбавителя. Однако в большинстве случаев преимущественным является добавление инертного растворителя, или разбавителя, или их смеси. Если реакцию проводят в присутствии основания, то основания, которые применяют в избытке, такие как триэтиламин, пиридин, N-метилморфолин или N,N-диэтиланилин, могут также выступать в качестве растворителей или разбавителей.

Реакцию преимущественно проводят при температуре в диапазоне от примерно -80°C до примерно $+140^{\circ}\text{C}$, предпочтительно от примерно -30°C до примерно $+100^{\circ}\text{C}$, во многих случаях в диапазоне от температуры окружающей среды до примерно $+80^{\circ}\text{C}$.

Соединение формулы I можно превращать известным *per se* способом в другое соединение формулы I путем замены одного или нескольких заместителей исходного соединения формулы I традиционным способом другим(-и) заместителем(-ями) в соответствии с настоящим изобретением и посредством постмодификации соединений с помощью таких реакций, как окисление, алкилирование, восстановление, ацилирование, и другими способами, известными специалистам в данной области техники.

В зависимости от выбора условий реакции и исходных веществ, подходящих в каждом случае, возможно, например, на одной стадии реакции заменить лишь один заместитель другим заместителем согласно настоящему изобретению, или на одной и той же стадии реакции можно заменить несколько заместителей другими заместителями согласно настоящему изобретению.

Соли соединений формулы I можно получать известным *per se* способом. Таким образом, например, соли присоединения кислоты соединений формулы I получают посредством обработки подходящей кислотой или подходящим ионообменным реагентом, а соли с основаниями получают посредством обработки подходящим основанием или подходящим ионообменным реагентом.

Соли соединений формулы I можно превращать традиционным способом в свободные соединения I, соли присоединения кислоты, например, посредством обработки

подходящим основным соединением или подходящим ионообменным реагентом, а соли с основаниями, например, посредством обработки подходящей кислотой или подходящим ионообменным реагентом.

- 5 Соли соединений формулы I можно преобразовывать известным *per se* способом в другие соли соединений формулы I, соли присоединения кислот, например, в другие соли присоединения кислот, например, посредством обработки соли неорганической кислоты, например гидрохлорида, подходящей солью металла и кислоты, такой как соль натрия, бария или серебра, например ацетатом серебра, в подходящем растворителе, в котором неорганическая соль, которая образуется, например, хлорид серебра, является нерастворимой и, таким образом, осаждается из реакционной смеси.

15 В зависимости от процедуры или условий реакции соединения формулы I, которые обладают солеобразующими свойствами, можно получать в свободной форме или в форме солей.

20 Соединения формулы I и в соответствующих случаях их таутомеры, в каждом случае в свободной форме или в форме соли, могут присутствовать в форме одного из возможных изомеров или в виде их смеси, например, в форме чистых изомеров, таких как антиподы и/или диастереомеры, или в виде смесей изомеров, таких как смеси энантиомеров, например рацематы, смесей диастереомеров или смесей рацематов в зависимости от числа, абсолютной и относительной конфигурации асимметричных атомов углерода, которые находятся в молекуле, и/или в зависимости от конфигурации неароматических двойных связей, которые находятся в молекуле; при этом настоящее изобретение относится к чистым изомерам, а также ко всем возможным смесям изомеров, и его следует понимать в каждом случае выше и ниже в данном документе в данном смысле, даже если стереохимические подробности не были упомянуты конкретно в каждом случае.

30 Смеси диастереомеров или смеси рацематов соединений формулы (I) в свободной форме или в форме соли, которые могут быть получены в зависимости от того, какие исходные материалы и процедуры были выбраны, могут быть разделены известным способом на чистые диастереомеры или рацематы на основе физико-химических

различий компонентов, например, с помощью фракционной кристаллизации, дистилляции и/или хроматографии.

5 Смеси энантиомеров, такие как рацематы, которые можно получать аналогичным способом, можно разделять на оптические антиподы с помощью известных способов, например, с помощью перекристаллизации из оптически активного растворителя, с помощью хроматографии на хиральных адсорбентах, например, с помощью высокоэффективной жидкостной хроматографии (HPLC) на ацетилцеллюлозе, с помощью подходящих микроорганизмов, путем расщепления специфичными
10 иммобилизованными ферментами, путем образования соединений включения, например, с применением хиральных краун-эфиров, где только один энантиомер участвует в образовании комплекса, или путем превращения в диастереомерные соли, например, путем проведения реакции рацемата основного конечного продукта с оптически активной кислотой, такой как карбоновая кислота, например, камфорная,
15 винная или яблочная кислота, или сульфоновая кислота, например камфорсульфоновая кислота, и разделения смеси диастереомеров, которая может быть получена таким образом, например, путем фракционной кристаллизации, основанной на их разной растворимости, с получением диастереомеров, из которых необходимый энантиомер может быть высвобожден под действием подходящих средств, например основных
20 средств.

Чистые диастереомеры или энантиомеры можно получать согласно настоящему изобретению не только путем разделения подходящих смесей изомеров, но также с помощью общеизвестных способов диастереоселективного или энантиоселективного
25 синтеза, например, посредством осуществления способа согласно настоящему изобретению с исходными веществами подходящей стереохимической конфигурации.

Известно несколько путей определения абсолютной конфигурации хиральных соединений, и они включают множество способов с применением спектроскопии и
30 дифракции. Среди них, например, дериватизация хиральным реагентом и анализ с помощью хроматографических методик, ЯМР с хиральными реагентами, обеспечивающими смещение, дисперсии оптической активности, циркулярного

дихроизма, химической корреляции и рентгеноструктурной кристаллографии, в частности, порошковой дифракции единичного кристалла (XRD).

5 N-оксиды можно получать посредством проведения реакции соединения формулы I с подходящим окислителем, например аддуктом H_2O_2 /мочевина, в присутствии ангидрида кислоты, например, ангидрида трифторуксусной кислоты. Такие типы реакций окисления известны из литературы, например, из J. Med. Chem., 32 (12), 2561-73, 1989 или WO 00/15615.

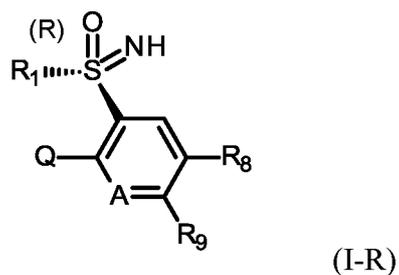
10 Соединения, где R_2 представляет собой C_1 - C_4 галогеналкилсульфинил или C_1 - C_4 галогеналкилсульфонил, могут быть получены из соответствующих соединений, где R_2 представляет собой C_1 - C_4 галогеналкилсульфанил, с применением подходящих способов окисления, описанных, например, в WO 19/008115.

15 Преимущественным является выделение или синтез в каждом случае биологически более эффективного изомера, например энантиомера или диастереомера, или смеси изомеров, например, смеси энантиомеров или смеси диастереомеров, если отдельные компоненты характеризуются различной биологической активностью.

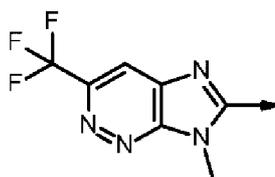
20 Соединения формулы I и в соответствующих случаях их таутомеры, в каждом случае в свободной форме или в форме соли, могут быть также получены, если необходимо, в форме гидратов и/или могут включать другие растворители, например, которые могли быть использованы для кристаллизации соединений, присутствующих в твердой форме.

25 Соединения формулы I согласно приведенным далее таблицам X A-1 - A-20 и B-1 - B-20 можно получать в соответствии со способами, описанными выше. Следующие примеры предназначены для иллюстрации настоящего изобретения и демонстрируют предпочтительные соединения формулы I.

30 В таблицах A-1 - A-20 ниже проиллюстрированы конкретные соединения по настоящему изобретению, где стереогенный атом серы находится в R-конфигурации.



В таблице А-1 представлено 12 соединений А-1.001 - А-1.012 формулы (I-R), где R₁ представляет собой этил, и А, R₈ и R₉ определены в таблице X, и Q взят из группы формулы Q₁ как

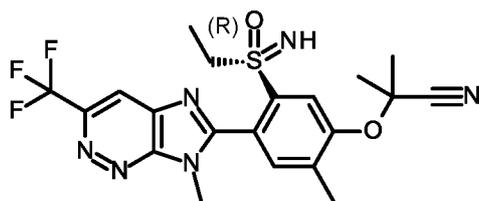


5

Таблица X. Определения заместителей А, R₈ и R₉

Индекс	A	R ₉	R ₈
1	N	H	-OC(CH ₃) ₂ CN
2	N	CH ₃	
3	CH	H	
4	CH	CH ₃	
5	N	H	
6	N	CH ₃	
7	CH	H	
8	CH	CH ₃	
9	N	H	-C(CH ₃) ₂ CN
10	N	CH ₃	
11	CH	H	
12	CH	CH ₃	

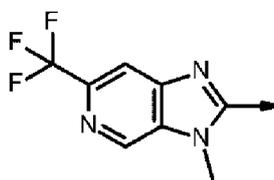
Например, соединение А-1.004 характеризуется следующей структурой:



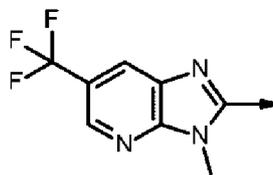
(A-1.004),

где (R) означает R-конфигурацию в стереогенном центре, который представляет собой атом серы.

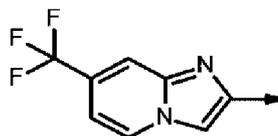
- 5 В таблице A-2 представлено 12 соединений A-2.001 - A-2.012 формулы (I-R), где R₁ представляет собой этил, и A, R₈ и R₉ определены в таблице X, и Q взят из группы формулы Q₁ как



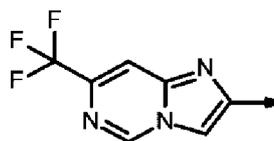
- 10 В таблице A-3 представлено 12 соединений A-3.001 - A-3.012 формулы (I-R), где R₁ представляет собой этил, и A, R₈ и R₉ определены в таблице X, и Q взят из группы формулы Q₁ как



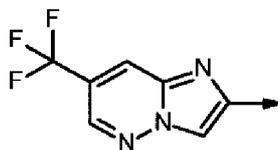
- 15 В таблице A-4 представлено 12 соединений A-4.001 - A-4.012 формулы (I-R), где R₁ представляет собой этил, и A, R₈ и R₉ определены в таблице X, и Q взят из группы формулы Q₂ как



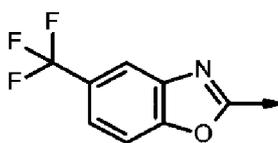
В таблице A-5 представлено 12 соединений A-5.001 - A-5.012 формулы (I-R), где R₁ представляет собой этил, и A, R₈ и R₉ определены в таблице X, и Q взят из группы формулы Q₂ как



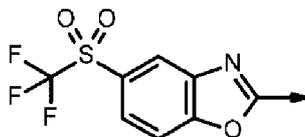
В таблице A-6 представлено 12 соединений A-6.001 - A-6.012 формулы (I-R), где R₁ представляет собой этил, и A, R₈ и R₉ определены в таблице X, и Q взят из группы формулы Q₃ как



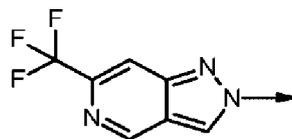
- 5 В таблице A-7 представлено 12 соединений A-7.001 - A-7.012 формулы (I-R), где R₁ представляет собой этил, и A, R₈ и R₉ определены в таблице X, и Q взят из группы формулы Q₁ как



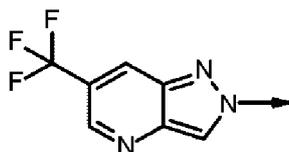
- 10 В таблице A-8 представлено 12 соединений A-8.001 - A-8.012 формулы (I-R), где R₁ представляет собой этил, и A, R₈ и R₉ определены в таблице X, и Q взят из группы формулы Q₁ как



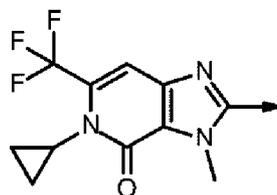
- 15 В таблице A-9 представлено 12 соединений A-9.001 - A-9.012 формулы (I-R), где R₁ представляет собой этил, и A, R₈ и R₉ определены в таблице X, и Q взят из группы формулы Q₄ как



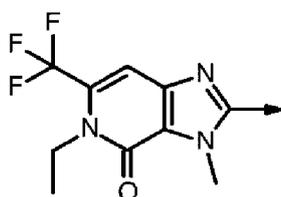
В таблице A-10 представлено 12 соединений A-10.001 - A-10.012 формулы (I-R), где R₁ представляет собой этил, и A, R₈ и R₉ определены в таблице X, и Q взят из группы формулы Q₄ как



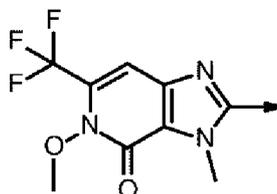
В таблице A-11 представлено 12 соединений A-11.001 - A-11.012 формулы (I-R), где R₁ представляет собой этил, и A, R₈ и R₉ определены в таблице X, и Q взят из группы формулы Q₅ как



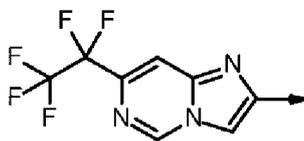
5 В таблице A-12 представлено 12 соединений A-12.001 - A-12.012 формулы (I-R), где R₁ представляет собой этил, и A, R₈ и R₉ определены в таблице X, и Q взят из группы формулы Q₅ как



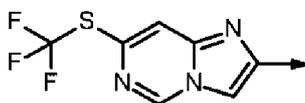
10 В таблице A-13 представлено 12 соединений A-13.001 - A-13.012 формулы (I-R), где R₁ представляет собой этил, и A, R₈ и R₉ определены в таблице X, и Q взят из группы формулы Q₅ как



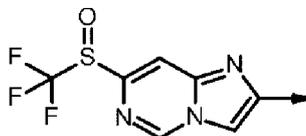
15 В таблице A-14 представлено 12 соединений A-14.001 - A-14.012 формулы (I-R), где R₁ представляет собой этил, и A, R₈ и R₉ определены в таблице X, и Q взят из группы формулы Q₂ как



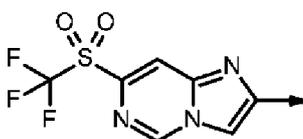
В таблице A-15 представлено 12 соединений A-15.001 - A-15.012 формулы (I-R), где R₁ представляет собой этил, и A, R₈ и R₉ определены в таблице X, и Q взят из группы формулы Q₂ как



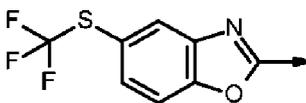
В таблице A-16 представлено 12 соединений A-16.001 - A-16.012 формулы (I-R), где R₁ представляет собой этил, и A, R₈ и R₉ определены в таблице X, и Q взят из группы формулы Q₂ как



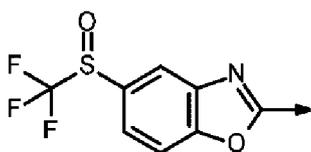
5 В таблице A-17 представлено 12 соединений A-17.001 - A-17.012 формулы (I-R), где R₁ представляет собой этил, и A, R₈ и R₉ определены в таблице X, и Q взят из группы формулы Q₂ как



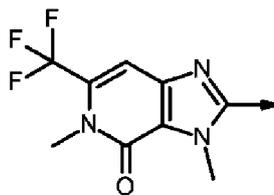
10 В таблице A-18 представлено 12 соединений A-18.001 - A-18.012 формулы (I-R), где R₁ представляет собой этил, и A, R₈ и R₉ определены в таблице X, и Q взят из группы формулы Q₁ как



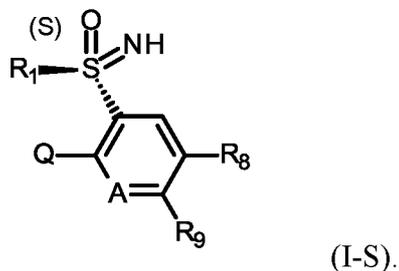
15 В таблице A-19 представлено 12 соединений A-19.001 - A-19.012 формулы (I-R), где R₁ представляет собой этил, и A, R₈ и R₉ определены в таблице X, и Q взят из группы формулы Q₁ как



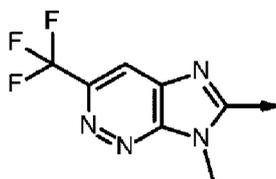
В таблице A-20 представлено 12 соединений A-20.001 - A-20.012 формулы (I-R), где R₁ представляет собой этил, и A, R₈ и R₉ определены в таблице X, и Q взят из группы формулы Q₅ как



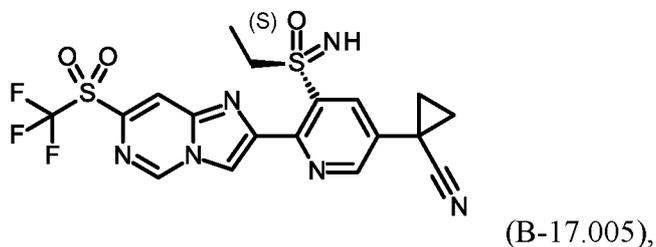
В таблицах В-1 - В-20 ниже дополнительно проиллюстрированы конкретные соединения по настоящему изобретению, где стереогенный атом серы находится в S-конфигурации.



- 5 В таблице В-1 представлено 12 соединений В-1.001 - В-1.012 формулы (I-S), где R₁ представляет собой этил, и А, R₈ и R₉ определены в таблице X, и Q взят из группы формулы Q₁ как

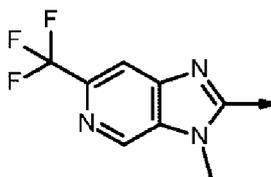


Например, соединение В-17.005 характеризуется следующей структурой:

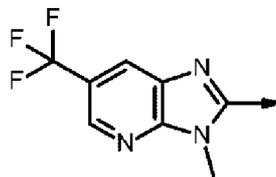


- 10 где (S) означает S-конфигурацию в стереогенном центре, который представляет собой атом серы.

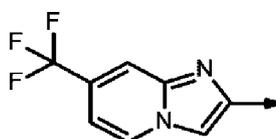
- 15 В таблице В-2 представлено 12 соединений В-2.001 - В-2.012 формулы (I-S), где R₁ представляет собой этил, и А, R₈ и R₉ определены в таблице X, и Q взят из группы формулы Q₁ как



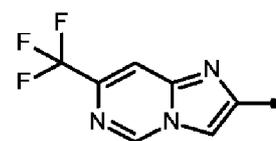
В таблице В-3 представлено 12 соединений В-3.001 - В-3.012 формулы (I-S), где R₁ представляет собой этил, и A, R₈ и R₉ определены в таблице X, и Q взят из группы формулы Q₁ как



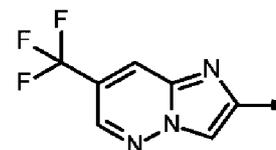
5 В таблице В-4 представлено 12 соединений В-4.001 - В-4.012 формулы (I-S), где R₁ представляет собой этил, и A, R₈ и R₉ определены в таблице X, и Q взят из группы формулы Q₂ как



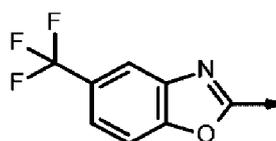
10 В таблице В-5 представлено 12 соединений В-5.001 - В-5.012 формулы (I-S), где R₁ представляет собой этил, и A, R₈ и R₉ определены в таблице X, и Q взят из группы формулы Q₂ как



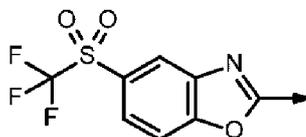
15 В таблице В-6 представлено 12 соединений В-6.001 - В-6.012 формулы (I-S), где R₁ представляет собой этил, и A, R₈ и R₉ определены в таблице X, и Q взят из группы формулы Q₃ как



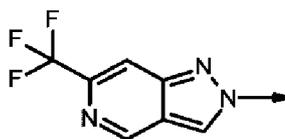
В таблице В-7 представлено 12 соединений В-7.001 - В-7.012 формулы (I-S), где R₁ представляет собой этил, и A, R₈ и R₉ определены в таблице X, и Q взят из группы формулы Q₁ как



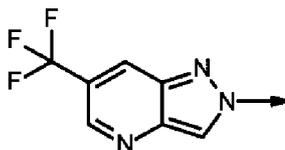
В таблице В-8 представлено 12 соединений В-8.001 - В-8.012 формулы (I-S), где R₁ представляет собой этил, и А, R₈ и R₉ определены в таблице X, и Q взят из группы формулы Q₁ как



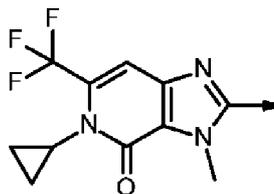
5 В таблице В-9 представлено 12 соединений В-9.001 - В-9.012 формулы (I-S), где R₁ представляет собой этил, и А, R₈ и R₉ определены в таблице X, и Q взят из группы формулы Q₄ как



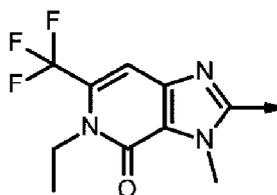
10 В таблице В-10 представлено 12 соединений В-10.001 - В-10.012 формулы (I-S), где R₁ представляет собой этил, и А, R₈ и R₉ определены в таблице X, и Q взят из группы формулы Q₄ как



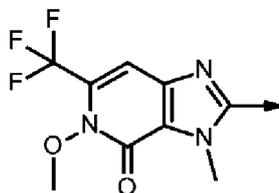
15 В таблице В-11 представлено 12 соединений В-11.001 - В-11.012 формулы (I-S), где R₁ представляет собой этил, и А, R₈ и R₉ определены в таблице X, и Q взят из группы формулы Q₅ как



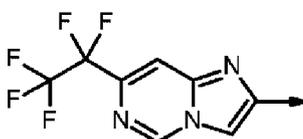
В таблице В-12 представлено 12 соединений В-12.001 - В-12.012 формулы (I-S), где R₁ представляет собой этил, и А, R₈ и R₉ определены в таблице X, и Q взят из группы формулы Q₅ как



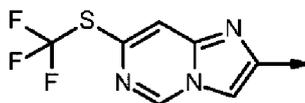
В таблице В-13 представлено 12 соединений В-13.001 - В-13.012 формулы (I-S), где R₁ представляет собой этил, и А, R₈ и R₉ определены в таблице X, и Q взят из группы формулы Q₅ как



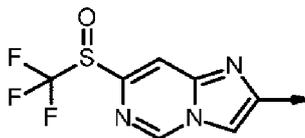
5 В таблице В-14 представлено 12 соединений В-14.001 - В-14.012 формулы (I-S), где R₁ представляет собой этил, и А, R₈ и R₉ определены в таблице X, и Q взят из группы формулы Q₂ как



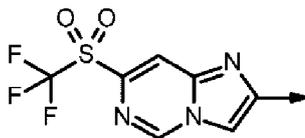
10 В таблице В-15 представлено 12 соединений В-15.001 - В-15.012 формулы (I-S), где R₁ представляет собой этил, и А, R₈ и R₉ определены в таблице X, и Q взят из группы формулы Q₂ как



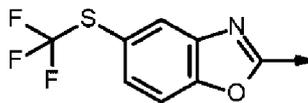
15 В таблице В-16 представлено 12 соединений В-16.001 - В-16.012 формулы (I-S), где R₁ представляет собой этил, и А, R₈ и R₉ определены в таблице X, и Q взят из группы формулы Q₂ как



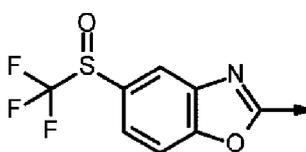
В таблице В-17 представлено 12 соединений В-17.001 - В-17.012 формулы (I-S), где R₁ представляет собой этил, и А, R₈ и R₉ определены в таблице X, и Q взят из группы формулы Q₂ как



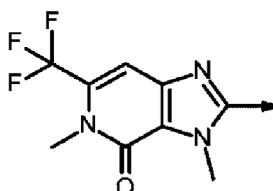
В таблице В-18 представлено 12 соединений В-18.001 - В-18.012 формулы (I-S), где R₁ представляет собой этил, и А, R₈ и R₉ определены в таблице X, и Q взят из группы формулы Q₁ как



5 В таблице В-19 представлено 12 соединений В-19.001 - В-19.012 формулы (I-S), где R₁ представляет собой этил, и А, R₈ и R₉ определены в таблице X, и Q взят из группы формулы Q₁ как



10 В таблице В-20 представлено 12 соединений В-20.001 - В-20.012 формулы (I-S), где R₁ представляет собой этил, и А, R₈ и R₉ определены в таблице X, и Q взят из группы формулы Q₅ как



15 Соединения формулы I согласно настоящему изобретению представляют собой активные ингредиенты, имеющие важное значение в области контроля вредителей для предупреждения и/или лечения даже при низких нормах применения, которые обладают весьма подходящим биоцидным спектром и хорошо переносятся теплокровными видами, рыбами и растениями. Активные ингредиенты согласно настоящему изобретению воздействуют на все или отдельные стадии развития животных-вредителей, таких как насекомые или представители отряда Asarina, нематоды или моллюски, с нормальной чувствительностью, а также с устойчивостью.

20 Инсектицидная, нематоцидная, моллюскоцидная или акарицидная активность активных ингредиентов согласно настоящему изобретению может проявляться непосредственно, т. е. в смертности или уничтожении вредителей, которое происходит либо немедленно,

25 либо по прошествии некоторого времени, например, во время линьки, или

опосредованно, например, в виде уменьшения числа откладываемых яиц и/или процента выхода личинок из яиц, антифидантного эффекта и/или подавления роста.

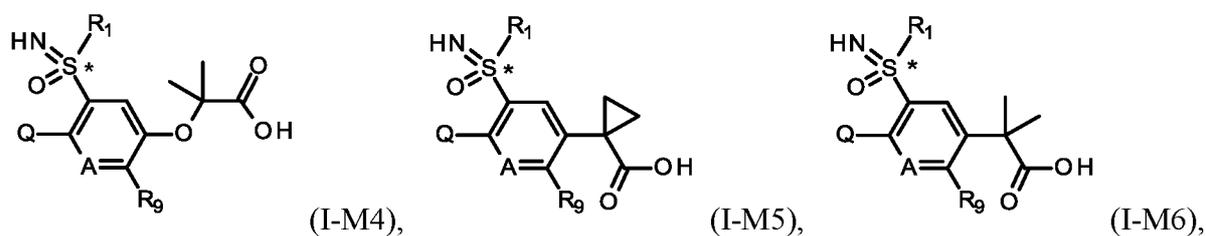
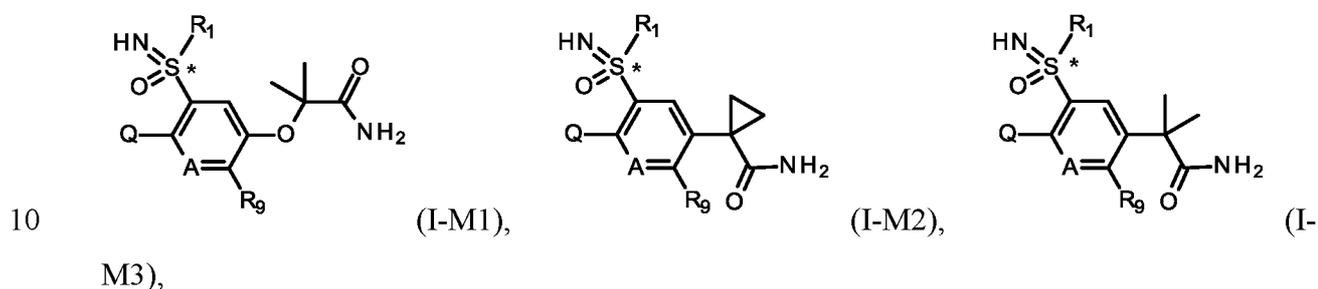
5 Соединения формулы (I) в соответствии с настоящим изобретением могут обладать любым рядом преимуществ, в том числе, среди прочего, преимущественными уровнями биологической активности для защиты растений от насекомых или превосходными свойствами для применения в качестве агрохимических активных ингредиентов (например, более высокой биологической активностью, различающейся биологической активностью энантиомера или энантиомерно обогащенной композиции и рацемата, различающейся биологической активностью (R)-энантиомера или (R)-энантиомерно обогащенной композиции и (S)-энантиомера или (S)-энантиомерно обогащенной композиции, преимущественным спектром активности, повышенным профилем безопасности, улучшенными физико-химическими свойствами или повышенной биоразлагаемостью или экологическим профилем). В частности, 10 неожиданно было обнаружено, что определенные соединения формулы (I) демонстрируют преимущественный профиль безопасности в отношении нецелевых организмов, например, нецелевых членистоногих, в частности, опылителей, таких как медоносные пчелы, одиночные пчелы и шмели. Наиболее конкретно, *Apis mellifera*.

20 В связи с этим некоторые соединения формулы (I) по настоящему изобретению могут отличаться от известных соединений за счет более высокой эффективности при низких нормах применения, что способен проверить специалист в данной области с использованием экспериментальных процедур, аналогичных тем или адаптированными из тех, которые указаны в биологических примерах, используя при необходимости 25 более низкие нормы применения, например, 50 ppm, 12,5 ppm, 6 ppm, 3 ppm, 1,5 ppm, 0,8 ppm или 0,2 ppm.

Дополнительно неожиданно было обнаружено, что соединения формулы (I) по настоящему изобретению демонстрируют преимущественные физико-химические свойства для применения в защите растений, в частности, сниженную точку плавления, 30 сниженную липофильность и повышенную растворимость в воде. Было обнаружено, что такие свойства являются преимущественными для поглощения растениями и системного распределения по их организму (см., например, A. Buchholz, S. Trapp, Pest

Manag Sci 2016; 72: 929-939) с целью контроля некоторых видов вредителей, перечисленных ниже.

Предполагаемые метаболиты соединений формулы I, которые могут образовываться во время осуществления настоящего изобретения на практике в сочетании с одним или несколькими из способов, вредителей, сельскохозяйственных культур и/или мишеней, описанных ниже, включают амидные соединения формул I-M1, I-M2, I-M3 и кислотные соединения формул I-M4, I-M5, I-M6, каждое из которых соответствует исходному нитрильному соединению формулы I,



15 где Q, R₁, R₂, R₃, R₄, R₉, X₁, G₁, G₂, S* и A определены для формулы I выше, или их агрохимически приемлемой соли, стереоизомеру, энантиомеру, таутомеру или N-оксиду. Среди конкретных предполагаемых метаболитов могут быть упомянуты: (1) амидное соединение формул I-M1, I-M2 или I-M3, которое соответствует исходному нитрилу, выбранному из группы, состоящей из соединений, описанных в таблицах A-20

20 1 - A-20, таблицах B-1 - B-20, таблице Y, таблице Z и таблице P(E); и (2) кислотное соединение формул I-M4, I-M5 или I-M6, соответствующее исходному нитрилу, выбранному из группы, состоящей из соединений, описанных в таблицах A-1 - A-20, таблицах B-1 - B-20, таблице Y, таблице Z и таблице P(E).

25 Примерами вышеупомянутых животных-вредителей являются следующие: из отряда *Acarina*, например,

Acalitus spp, Aculus spp, Acaricalus spp, Aceria spp, Acarus siro, Amblyomma spp., Argas spp., Boophilus spp., Brevipalpus spp., Bryobia spp, Calipitimerus spp., Chorioptes spp., Dermanyssus gallinae, Dermatophagoides spp, Eotetranychus spp, Eriophyes spp., Hemitarsonemus spp, Hyalomma spp., Ixodes spp., Olygonychus spp, Ornithodoros spp.,
 5 Polyphagotarsonne latus, Panonychus spp., Phyllocoptruta oleivora, Phytoneumus spp, Polyphagotarsonemus spp, Psoroptes spp., Rhipicephalus spp., Rhizoglyphus spp., Sarcoptes spp., Steneotarsonemus spp, Tarsonemus spp. и Tetranychus spp.;

из отряда *Anoplura*, например,

Haematorpinus spp., Linognathus spp., Pediculus spp., Pemphigus spp. и Phylloxera spp.;

10 из отряда *Coleoptera*, например,

Agriotes spp., Amphimallon majale, Anomala orientalis, Anthonomus spp., Aphodius spp, Astylus atromaculatus, Ataenius spp, Atomaria linearis, Chaetocnema tibialis, Cerotoma spp, Conoderus spp, Cosmopolites spp., Cotinis nitida, Curculio spp., Cyclocephala spp, Dermestes spp., Diabrotica spp., Diloboderus abderus, Epilachna spp., Eremnus spp.,
 15 Heteronychus arator, Hypothenemus hampei, Lagria vilosa, Leptinotarsa decemLineata, Lissorhoptrus spp., Liogenys spp, Maecolaspis spp, Maladera castanea, Megascelis spp, Melighetes aeneus, Melolontha spp., Myochrous armatus, Orycaophilus spp., Otiiorhynchus spp., Phyllophaga spp, Phlyctinus spp., Popillia spp., Psylliodes spp., Rhyssomatus aubtilis, Rhizopertha spp., Scarabeidae, Sitophilus spp., Sitotroga spp., Somaticus spp, Sphenophorus
 20 spp, Sternechus subsignatus, Tenebrio spp., Tribolium spp. и Trogoderma spp.;

из отряда *Diptera*, например,

Aedes spp., Anopheles spp, Antherigona soccata, Bactrocea oleae, Bibio hortulanus, Bradysia spp, Calliphora erythrocephala, Ceratitis spp., Chrysomyia spp., Culex spp., Cuterebra spp.,
 25 Dacus spp., Delia spp, Drosophila melanogaster, Fannia spp., Gastrophilus spp., Geomyza tripunctata, Glossina spp., Hypoderma spp., Hyppobosca spp., Liriomyza spp., Lucilia spp., Melanagromyza spp., Musca spp., Oestrus spp., Orseolia spp., Oscinella frit, Pegomyia hyoscyami, Phorbia spp., Rhagoletis spp, Rivelia quadrifasciata, Scatella spp, Sciara spp., Stomoxys spp., Tabanus spp., Tannia spp. и Tipula spp.;

из отряда *Hemiptera*, например,

30 Acanthocoris scabrator, Acrosternum spp, Adelphocoris lineolatus, Amblypelta nitida, Bathycoelia thalassina, Blissus spp, Cimex spp., Clavigralla tomentosicollis, Creontiades spp, Distantiella theobroma, Dichelops furcatus, Dysdercus spp., Edessa spp, Euschistus spp., Eurydema pulchrum, Eurygaster spp., Halyomorpha halys, Horcias nobilellus, Leptocoris

- spp., *Lygus* spp, *Margarodes* spp, *Murgantia histrionic*, *Neomegalotomus* spp, *Nesidiocoris tenuis*, *Nezara* spp., *Nysius simulans*, *Oebalus insularis*, *Piesma* spp., *Piezodorus* spp, *Rhodnius* spp., *Sahlbergella singularis*, *Scaptocoris castanea*, *Scotinophara* spp. , *Thyanta* spp , *Triatoma* spp., *Vatiga illudens*;
- 5 *Acyrtosium pisum*, *Adalges* spp, *Agalliana ensigera*, *Agonoscena targionii*, *Aleurodicus* spp, *Aleurocanthus* spp, *Aleurolobus barodensis*, *Aleurothrixus floccosus*, *Aleyrodes brassicae*, *Amarasca biguttula*, *Amritodus atkinsoni*, *Aonidiella* spp., *Aphididae*, *Aphis* spp., *Aspidiotus* spp., *Aulacorthum solani*, *Bactericera cockerelli*, *Bemisia* spp, *Brachycaudus* spp, *Brevicoryne brassicae*, *Cacopsylla* spp, *Cavariella aegopodii* Scop., *Ceroplaster* spp.,
- 10 *Chrysomphalus aonidium*, *Chrysomphalus dictyospermi*, *Cicadella* spp, *Cofana spectra*, *Cryptomyzus* spp, *Cicadulina* spp, *Coccus hesperidum*, *Dalbulus maidis*, *Dialeurodes* spp, *Diaphorina citri*, *Diuraphis noxia*, *Dysaphis* spp, *Empoasca* spp., *Eriosoma larigerum*, *Erythroneura* spp., *Gascardia* spp., *Glycaspis brimblecombei*, *Hyadaphis pseudobrassicae*, *Hyalopterus* spp, *Hyperomyzus pallidus*, *Idioscopus clypealis*, *Jacobiasca lybica*, *Laodelphax*
- 15 spp., *Lecanium corni*, *Lepidosaphes* spp., *Lopaphis erysimi*, *Lyogenys maidis*, *Macrosiphum* spp., *Mahanarva* spp, *Metcalfa pruinosa*, *Metopolophium dirhodum*, *Myndus crudus*, *Myzus* spp., *Neotoxoptera* sp, *Nephotettix* spp., *Nilaparvata* spp., *Nippolachnus piri* Mats, *Odonaspis ruthae*, *Oregma lanigera* Zehnter, *Parabemisia myricae*, *Paratrioza cockerelli*, *Parlatoria* spp., *Pemphigus* spp., *Peregrinus maidis*, *Perkinsiella* spp, *Phorodon humuli*, *Phylloxera* spp,
- 20 *Planococcus* spp., *Pseudaulacaspis* spp., *Pseudococcus* spp., *Pseudatomoscelis seriatus*, *Psylla* spp., *Pulvinaria aethiopica*, *Quadraspidiotus* spp., *Quesada gigas*, *Recilia dorsalis*, *Rhopalosiphum* spp., *Saissetia* spp., *Scaphoideus* spp., *Schizaphis* spp., *Sitobion* spp., *Sogatella furcifera*, *Spissistilus festinus*, *Tarophagus Proserpina*, *Toxoptera* spp, *Trialeurodes* spp, *Tridiscus sporoboli*, *Trionymus* spp, *Trioza erytrae* , *Unaspis citri*, *Zygina flammigera*,
- 25 *Zyginidia scutellaris* ;
из отряда *Hymenoptera*, например,
Acromyrmex, *Arge* spp, *Atta* spp., *Cephus* spp., *Diprion* spp., *Diprionidae*, *Gilpinia polytoma*, *Hoplocampa* spp., *Lasius* spp., *Monomorium pharaonis*, *Neodiprion* spp., *Pogonomyrmex* spp, *Slenopsis invicta*, *Solenopsis* spp. и *Vespa* spp.;
- 30 из отряда *Isoptera*, например,
Coptotermes spp, *Cornitermes cumulans*, *Incisitermes* spp, *Macrotermes* spp, *Mastotermes* spp, *Microtermes* spp, *Reticulitermes* spp.; *Solenopsis geminate*
из отряда *Lepidoptera*, например,

- Acleris spp., Adoxophyes spp., Aegeria spp., Agrotis spp., Alabama argillaceae, Amylois spp., Anticarsia gemmatalis, Archips spp., Argyresthia spp., Argyrotaenia spp., Autographa spp., Bucculatrix thurberiella, Busseola fusca, Cadra cautella, Carposina nipponensis, Chilo spp., Choristoneura spp., Chrysoteuchia topiaria, Clysia ambiguella, Cnaphalocrocis spp.,
 5 Cnephasia spp., Cochylis spp., Coleophora spp., Colias lesbia, Cosmophila flava, Crambus spp., Crocidolomia binotalis, Cryptophlebia leucotreta, Cydalima perspectalis, Cydia spp., Diaphania perspectalis, Diatraea spp., Diparopsis castanea, Earias spp., Eldana saccharina, Ephestia spp., Epinotia spp., Estigmene acrea, Etiella zinckinella, Eucosma spp., Eupoecilia ambiguella, Euproctis spp., Euxoa spp., Feltia jaculiferia, Grapholita spp., Hedya nubiferana,
 10 Heliothis spp., Hellula undalis, Herpetogramma spp., Hyphantria cunea, Keiferia lycopersicella, Lasmopalpus lignosellus, Leucoptera scitella, Lithocollethis spp., Lobesia botrana, Loxostege bifidalis, Lymantria spp., Lyonetia spp., Malacosoma spp., Mamestra brassicae, Manduca sexta, Mythimna spp., Noctua spp., Operophtera spp., Orniodes indica, Ostrinia nubilalis, Pammene spp., Pandemis spp., Panolis flammea, Papaipema nebris,
 15 Pectinophora gossypiella, Perileucoptera coffeella, Pseudaletia unipuncta, Phthorimaea operculella, Pieris rapae, Pieris spp., Plutella xylostella, Prays spp., Pseudoplusia spp., Rachiplusia nu, Richia albicosta, Scirpophaga spp., Sesamia spp., Sparganothis spp., Spodoptera spp., Sylepta derogate, Synanthedon spp., Thaumetopoea spp., Tortrix spp., Trichoplusia ni, Tuta absoluta и Yponomeuta spp.;
 20 из отряда *Mallophaga*, например, Damalinea spp. и Trichodectes spp.;
 из отряда *Orthoptera*, например, Blatta spp., Blattella spp., Gryllotalpa spp., Leucophaea maderae, Locusta spp., Neocurtilla hexadactyla, Periplaneta spp., Scapteriscus spp и Schistocerca spp.;
 25 из отряда *Psocoptera*, например, Liposcelis spp.;
 из отряда *Siphonaptera*, например, Ceratophyllus spp., Ctenocephalides spp. и Xenopsylla cheopis;
 из отряда *Thysanoptera*, например,
 30 Calliothrips phaseoli, Frankliniella spp., Heliothrips spp., Hercinothrips spp., Parthenothrips spp., Scirtothrips aurantii, Sericothrips variabilis, Taeniothrips spp., Thrips spp;
 из отряда *Thysanura*, например, Lepisma saccharina.

Активные ингредиенты согласно настоящему изобретению можно применять для контроля, т. е. сдерживания или уничтожения, вредителей вышеуказанного типа, которые встречаются, в частности, на растениях, особенно на полезных растениях и декоративных растениях в сельском хозяйстве, в садоводстве и в лесоводстве, или на
5 органах таких растений, таких как плоды, цветки, листья, стебли, клубни или корни, и в некоторых случаях даже органы растений, которые образуются в более поздний момент времени, остаются защищенными от данных вредителей.

Подходящими целевыми сельскохозяйственными культурами являются, в частности,
10 зерновые культуры, такие как пшеница, ячмень, рожь, овес, рис, маис или сорго; свекла, такая как сахарная свекла или кормовая свекла; плодовые культуры, например, семечковые, косточковые или ягодные культуры, такие как сорта яблони, груши, сливы, персика, миндаля, вишни или ягод, например, сорта земляники, малины или ежевики; бобовые культуры, такие как сорта бобов, чечевицы, гороха или сои;
15 масличные культуры, такие как масличный рапс, горчица, сорта мака, маслины, подсолнечника, кокосовая пальма, клещевина, какао или сорта арахиса; бахчевые культуры, такие как сорта тыквы, огурца или дыни; волокнистые растения, такие как хлопчатник, лен, конопля или джут; цитрусовые, такие как сорта апельсина, лимона, грейпфрут или сорта мандарина; овощи, такие как шпинат, салат-латук, спаржа, сорта
20 капусты, моркови, лука, томата, картофеля или болгарского перца; представители *Laugaseae*, такие как авокадо, *Cinnamomum* или камфорное дерево; а также табак, орехи, кофе, сорта баклажана, сахарный тростник, чай, перец, сорта культурного винограда, хмеля, представители семейства Подорожниковые и каучуконосные растения.

25 Композиции и/или способы по настоящему изобретению также можно применять по отношению к любым декоративным и/или овощным культурам, в том числе цветам, кустарникам, широколиственным деревьям и вечнозеленым растениям.

Например, настоящее изобретение можно применять по отношению к любому из
30 следующих видов декоративных растений: *Ageratum* spp., *Alonsoa* spp., *Anemone* spp., *Anisodonteia capsensis*, *Anthemis* spp., *Antirrhinum* spp., *Aster* spp., *Begonia* spp. (например, *B. elatior*, *B. semperflorens*, *B. tubéreux*), *Bougainvillea* spp., *Brachycome* spp., *Brassica* spp. (декоративный), *Calceolaria* spp., *Capsicum annuum*, *Catharanthus roseus*,

Canna spp., *Centaurea* spp., *Chrysanthemum* spp., *Cineraria* spp. (*C. maritime*), *Coreopsis* spp., *Crassula coccinea*, *Cuphea ignea*, *Dahlia* spp., *Delphinium* spp., *Dicentra spectabilis*, *Dorotheantus* spp., *Eustoma grandiflorum*, *Forsythia* spp., *Fuchsia* spp., *Geranium gnaphalium*, *Gerbera* spp., *Gomphrena globosa*, *Heliotropium* spp., *Helianthus* spp.,
 5 *Hibiscus* spp., *Hortensia* spp., *Hydrangea* spp., *Hypoestes phyllostachya*, *Impatiens* spp. (*I. Walleriana*), *Iresines* spp., *Kalanchoe* spp., *Lantana camara*, *Lavatera trimestris*, *Leonotis leomurus*, *Lilium* spp., *Mesembryanthemum* spp., *Mimulus* spp., *Monarda* spp., *Nemesia* spp., *Tagetes* spp., *Dianthus* spp. (гвоздика), *Canna* spp., *Oxalis* spp., *Bellis* spp., *Pelargonium* spp. (*P. peltatum*, *P. Zonale*), *Viola* spp. (анютины глазки), *Petunia* spp., *Phlox* spp.,
 10 *Plecthranthus* spp., *Poinsettia* spp., *Parthenocissus* spp. (*P. quinquefolia*, *P. tricuspidata*), *Primula* spp., *Ranunculus* spp., *Rhododendron* spp., *Rosa* spp. (роза), *Rudbeckia* spp., *Saintpaulia* spp., *Salvia* spp., *Scaevola aemola*, *Schizanthus wisetonensis*, *Sedum* spp., *Solanum* spp., *Surfinia* spp., *Tagetes* spp., *Nicotinia* spp., *Verbena* spp., *Zinnia* spp. и другие
 грядковые растения.

15 Например, настоящее изобретение можно применять по отношению к любому из следующих видов овощных культур: *Allium* spp. (*A. sativum*, *A. cepa*, *A. oschaninii*, *A. Porrum*, *A. ascalonicum*, *A. fistulosum*), *Anthriscus cerefolium*, *Apium graveolus*, *Asparagus officinalis*, *Beta vulgaris*, *Brassica* spp. (*B. Oleracea*, *B. Pekinensis*, *B. rapa*), *Capsicum annum*, *Cicer arietinum*, *Cichorium endivia*, *Cichorium* spp. (*C. intybus*, *C. endivia*),
 20 *Citrillus lanatus*, *Cucumis* spp. (*C. sativus*, *C. melo*), *Cucurbita* spp. (*C. pepo*, *C. maxima*), *Cyanara* spp. (*C. scolymus*, *C. cardunculus*), *Daucus carota*, *Foeniculum vulgare*, *Hypericum* spp., *Lactuca sativa*, *Lycopersicon* spp. (*L. esculentum*, *L. lycopersicum*), *Mentha* spp., *Ocimum basilicum*, *Petroselinum crispum*, *Phaseolus* spp. (*P. vulgaris*, *P. coccineus*), *Pisum sativum*, *Raphanus sativus*, *Rheum rhaponticum*, *Rosemarinus* spp., *Salvia* spp., *Scorzonera*
 25 *hispanica*, *Solanum melongena*, *Spinacea oleracea*, *Valerianella* spp. (*V. locusta*, *V. eriocarpa*) и *Vicia faba*.

Предпочтительные виды декоративных растений включают фиалку африканскую, *Begonia*, *Dahlia*, *Gerbera*, *Hydrangea*, *Verbena*, *Rosa*, *Kalanchoe*, *Poinsettia*, *Aster*, *Centaurea*, *Coreopsis*, *Delphinium*, *Monarda*, *Phlox*, *Rudbeckia*, *Sedum*, *Petunia*, *Viola*,
 30 *Impatiens*, *Geranium*, *Chrysanthemum*, *Ranunculus*, *Fuchsia*, *Salvia*, *Hortensia*, розмарин, шалфей, зверобой, мяту, перец сладкий, томат и огурец.

Активные ингредиенты согласно настоящему изобретению особенно подходят для контроля *Aphis craccivora*, *Diabrotica balteata*, *Heliothis virescens*, *Myzus persicae*, *Plutella*

xylostella и *Spodoptera littoralis* на хлопчатнике, овощных культурах, маисе, рисе и сое. Кроме того, активные ингредиенты согласно настоящему изобретению являются особенно подходящими для контроля *Mamestra* (предпочтительно на овощных культурах), *Cydia pomonella* (предпочтительно на сортах яблони), *Empoasca* (предпочтительно на овощных культурах, виноградниках), *Leptinotarsa* (предпочтительно на сортах картофеля) и *Chilo suppressalis* (предпочтительно на рисе).

Активные ингредиенты согласно настоящему изобретению особенно подходят для контроля *Aphis craccivora*, *Diabrotica balteata*, *Heliothis virescens*, *Myzus persicae*, *Plutella xylostella* и *Spodoptera littoralis* на хлопчатнике, овощных культурах, маисе, рисе и сое. Кроме того, активные ингредиенты согласно настоящему изобретению являются особенно подходящими для контроля *Mamestra* (предпочтительно на овощных культурах), *Cydia pomonella* (предпочтительно на сортах яблони), *Empoasca* (предпочтительно на овощных культурах, виноградниках), *Leptinotarsa* (предпочтительно на сортах картофеля) и *Chilo suppressalis* (предпочтительно на рисе).

В дополнительном аспекте настоящее изобретение может также относиться к способу контроля повреждения растения и его частей паразитирующими на растении нематодами (эндопаразитическими, полуэндопаразитическими и эктопаразитическими нематодами), в частности, паразитирующими на растении нематодами, такими как галловые нематоды, *Meloidogyne hapla*, *Meloidogyne incognita*, *Meloidogyne javanica*, *Meloidogyne arenaria* и другие виды *Meloidogyne*; цистообразующие нематоды, *Globodera rostochiensis* и другие виды *Globodera*; *Heterodera avenae*, *Heterodera glycines*, *Heterodera schachtii*, *Heterodera trifolii* и другие виды *Heterodera*; галловые нематоды семян, виды *Anguina*; стеблевые и листовые нематоды, виды *Aphelenchoides*; жалящие нематоды, *Belonolaimus longicaudatus* и другие виды *Belonolaimus*; нематоды хвойных, *Bursaphelenchus xylophilus* и другие виды *Bursaphelenchus*; кольцевые нематоды, виды *Criconema*, виды *Criconemella*, виды *Criconemoides*, виды *Mesocriconema*; стеблевые и луковичные нематоды, *Ditylenchus destructor*, *Ditylenchus dipsaci* и другие виды *Ditylenchus*; шилоносые нематоды, виды *Dolichodorus*; спиральные нематоды, *Helicotylenchus multicinctus* и другие виды *Helicotylenchus*; оболочковые и оболочкоподобные нематоды, виды *Hemicycliophora* и виды *Hemicriconemoides*; виды *Hirshmanniella*; ланцетоподобные нематоды, виды *Norloaimus*; ложные галловые

нематоды, виды *Nacobbus*; игольчатые нематоды, *Longidorus elongatus* и другие виды *Longidorus*; короткотельные нематоды, виды *Pratylenchus*; ранящие нематоды, *Pratylenchus neglectus*, *Pratylenchus penetrans*, *Pratylenchus curvatus*, *Pratylenchus goodeyi* и другие виды *Pratylenchus*; роющие нематоды, *Radopholus similis* и другие виды *Radopholus*; почковидные нематоды, *Rotylenchus robustus*, *Rotylenchus reniformis* и другие виды *Rotylenchus*; виды *Scutellonema*; короткие корневые нематоды, *Trichodorus primitivus* и другие виды *Trichodorus*, виды *Paratrichodorus*; карликовые нематоды, *Tylenchorhynchus claytoni*, *Tylenchorhynchus dubius* и другие виды *Tylenchorhynchus*; нематоды цитрусовых, виды *Tylenchulus*; кинжаловидные нематоды, виды *Xiphinema*; а также другие паразитирующие на растениях виды нематод, такие как *Subanguina* spp., *Hypsoperine* spp., *Macroposthonia* spp., *Melinius* spp., *Punctodera* spp. и *Quinisulcius* spp.

Соединения по настоящему изобретению также могут характеризоваться активностью в отношении моллюсков. Примеры данных моллюсков включают, например, *Ampullariidae*; *Arion* (*A. ater*, *A. circumscriptus*, *A. hortensis*, *A. rufus*); *Bradybaenidae* (*Bradybaena fruticum*); *Cepaea* (*C. hortensis*, *C. Nemoralis*); *Cochlodina*; *Deroceras* (*D. agrestis*, *D. empiricorum*, *D. laeve*, *D. reticulatum*); *Discus* (*D. rotundatus*); *Euomphalia*; *Galba* (*G. trunculata*); *Helicelia* (*H. itala*, *H. obvia*); *Helicidae* (*Helicigona arbustorum*); *Helicodiscus*; *Helix* (*H. aperta*); *Limax* (*L. cinereoniger*, *L. flavus*, *L. marginatus*, *L. maximus*, *L. tenellus*); *Lymnaea*; *Milax* (*M. gagates*, *M. marginatus*, *M. sowerbyi*); *Opeas*; *Pomacea* (*P. canaticulata*); *Vallonia* и *Zanitoides*.

Термин "сельскохозяйственные культуры" следует понимать как включающий также культурные растения, которые были трансформированы с помощью методик с применением рекомбинантных ДНК таким образом, что они приобрели способность к синтезу одного или нескольких токсинов избирательного действия, таких как известные, например, у продуцирующих токсины бактерий, в частности, бактерий рода *Bacillus*.

Токсины, которые могут экспрессироваться такими трансгенными растениями, включают, например, инсектицидные белки, например инсектицидные белки из *Bacillus cereus* или *Bacillus popilliae*; или инсектицидные белки из *Bacillus thuringiensis*, такие как δ -эндотоксины, например, *Cry1Ab*, *Cry1Ac*, *Cry1F*, *Cry1Fa2*, *Cry2Ab*, *Cry3A*,

Cry3Bb1 или Cry9C, или вегетативные инсектицидные белки (Vip), например, Vip1, Vip2, Vip3 или Vip3A; или инсектицидные белки бактерий, колонизирующих нематод, например, *Photorhabdus* spp. или *Xenorhabdus* spp., таких как *Photorhabdus luminescens*, *Xenorhabdus nematophilus*; токсины, продуцируемые животными, такие как токсины скорпионов, токсины паукообразных, токсины ос и другие специфические нейротоксины насекомых; токсины, продуцируемые грибами, такие как токсины *Streptomyces*, растительные лектины, такие как лектины гороха, лектины ячменя или лектины подснежника; агглютинины; ингибиторы протеиназы, такие как ингибиторы трипсина, ингибиторы сериновой протеазы, пататин, цистатин, ингибиторы папаина; белки, инактивирующие рибосому (RIP), такие как рицин, RIP кукурузы, абрин, люффин, сапорин или бриодин; ферменты метаболизма стероидов, такие как 3-гидроксистероидоксидаза, экдистероид-UDP-гликозилтрансфераза, холестериноксидазы, ингибиторы экдизона, HMG-CoA-редуктаза, блокаторы ионных каналов, такие как блокаторы натриевых или кальциевых каналов, эстераза ювенильного гормона, рецепторы диуретических гормонов, стильбенсинтаза, дибензилсинтаза, хитиназы и глюканазы.

В контексте настоящего изобретения под δ -эндотоксинами, например Cry1Ab, Cry1Ac, Cry1F, Cry1Fa2, Cry2Ab, Cry3A, Cry3Bb1 или Cry9C, или вегетативными инсектицидными белками (Vip), например Vip1, Vip2, Vip3 или Vip3A, следует понимать явным образом также гибридные токсины, усеченные токсины и модифицированные токсины. Гибридные токсины получают рекомбинантным способом за счет новой комбинации различных доменов таких белков (см., например, WO 02/15701). Известны усеченные токсины, например усеченный Cry1Ab. В случае модифицированных токсинов замены одна или несколько аминокислот токсина, встречающегося в природе. При таких аминокислотных заменах в токсин предпочтительно вводятся не присутствующие в природном токсине последовательности, распознаваемые протеазами, так, например, в случае Cry3A055 в токсин Cry3A вводится последовательность, распознаваемая катепсином G (см. WO 03/018810).

Примеры таких токсинов или трансгенных растений, способных синтезировать такие токсины, раскрыты, например, в EP-A-0374753, WO 93/07278, WO 95/34656, EP-A-0427529, EP-A-451878 и WO 03/052073.

Способы получения таких трансгенных растений в целом известны специалисту в данной области техники и описаны, например, в публикациях, упомянутых выше. Дезоксирибонуклеиновые кислоты CryI-типа и их получение известны, например, из WO 95/34656, EP-A-0367474, EP-A-0401979 и WO 90/13651.

5 Токсин, содержащийся в трансгенных растениях, придает растениям толерантность в отношении вредных насекомых. Такие насекомые могут принадлежать к любой таксономической группе насекомых, но особенно часто встречаются среди жуков (Coleoptera), двукрылых насекомых (Diptera) и мотыльков (Lepidoptera).

Известны трансгенные растения, содержащие один или несколько генов, которые кодируют устойчивость к насекомым и экспрессируют один или несколько токсинов, и некоторые из них являются коммерчески доступными. Примерами таких растений являются: YieldGard® (сорт маиса, экспрессирующий токсин Cry1Ab); YieldGard Rootworm® (сорт маиса, экспрессирующий токсин Cry3Bb1); YieldGard Plus® (сорт маиса, экспрессирующий токсин Cry1Ab и Cry3Bb1); Starlink® (сорт маиса, экспрессирующий токсин Cry9C); Herculex I® (сорт маиса, экспрессирующий токсин Cry1Fa2 и фермент фосфинотрицин-N-ацетилтрансферазу (PAT) с обеспечением толерантности к гербициду глюфосинату аммония); NuCOTN 33B® (сорт хлопчатника, экспрессирующий токсин Cry1Ac); Bollgard I® (сорт хлопчатника, экспрессирующий токсин Cry1Ac); Bollgard II® (сорт хлопчатника, экспрессирующий токсин Cry1Ac и Cry2Ab); VipCot® (сорт хлопчатника, экспрессирующий токсин Vip3A и Cry1Ab); NewLeaf® (сорт картофеля, экспрессирующий токсин Cry3A); NatureGard® Agrisure® GT Advantage (GA21 с признаком толерантности к глифосату), Agrisure® CB Advantage (Bt11 с признаком устойчивости к кукурузному мотыльку (CB)) и Protecta®..

Дополнительными примерами таких трансгенных сельскохозяйственных культур являются следующие.

1. **Маис Bt11** от Syngenta Seeds SAS, Chemin de l'Hobit 27, F-31 790 Сен-Совер, Франция, регистрационный номер C/FR/96/05/10. Генетически модифицированный *Zea mays*, которому придали устойчивость к поражению кукурузным мотыльком (*Ostrinia nubilalis* и *Sesamia nonagrioides*) за счет трансгенной экспрессии усеченного токсина Cry1Ab. Маис Bt11 также трансгенным образом экспрессирует фермент PAT с обеспечением толерантности к гербициду глюфосинату аммония.

2. **Маис Bt176** от Syngenta Seeds SAS, Chemin de l'Hobit 27, F-31 790 Сен-Совер, Франция, регистрационный номер C/FR/96/05/10. Генетически модифицированный *Zea*

mays, которому придали устойчивость к поражению кукурузным мотыльком (*Ostrinia nubilalis* и *Sesamia nonagrioides*) за счет трансгенной экспрессии токсина Cry1Ab. Маис Bt176 также трансгенным образом экспрессирует фермент PAT с обеспечением толерантности к гербициду глюфосинату аммония.

5 3. **Маис MIR604** от Syngenta Seeds SAS, Chemin de l'Hobit 27, F-31 790 Сен-Совер, Франция, регистрационный номер C/FR/96/05/10. Маис, которому придали устойчивость к насекомым за счет трансгенной экспрессии модифицированного токсина Cry3A. Данный токсин представляет собой Cry3A055, модифицированный путем вставки последовательности, распознаваемой протеазой катепсином G.
10 Получение таких трансгенных растений маиса описано в WO 03/018810.

4. **Маис MON 863** от Monsanto Europe S.A. 270-272 Авеню-Де-Тервюрен, В-1150 Брюссель, Бельгия, регистрационный номер C/DE/02/9. MON 863 экспрессирует токсин Cry3Bb1 и характеризуется устойчивостью к определенным насекомым из отряда Coleoptera.

15 5. **Хлопчатник IPC 531** от Monsanto Europe S.A. 270-272 Авеню-Де-Тервюрен, В-1150 Брюссель, Бельгия, регистрационный номер C/ES/96/02.

6. **Маис 1507** от Pioneer Overseas Corporation, Авеню-Тедеско, 7 В-1160 Брюссель, Бельгия, регистрационный номер C/NL/00/10. Маис, генетически модифицированный для экспрессии белка Cry1F, предназначенного для обеспечения устойчивости к
20 определенным насекомым из отряда Lepidoptera, и белка PAT, предназначенного для обеспечения толерантности к гербициду глюфосинату аммония.

7. **Маис NK603 × MON 810** от Monsanto Europe S.A. 270-272 Авеню-Де-Тервюрен, В-1150 Брюссель, Бельгия, регистрационный номер C/GB/02/M3/03. Состоит из гибридных сортов маиса, полученных традиционной селекцией при скрещивании
25 генетически модифицированных сортов NK603 и MON 810. Маис NK603 × MON 810 трансгенным образом экспрессирует белок CP4 EPSPS, полученный из штамма CP4 *Agrobacterium sp.*, который обеспечивает толерантность к гербициду Roundup® (содержит глифосат), а также токсин Cry1Ab, полученный из *Bacillus thuringiensis* подвид *kurstaki*, который обеспечивает толерантность к определенным представителям
30 отряда Lepidoptera, включая кукурузного мотылька.

Трансгенные сельскохозяйственные культуры устойчивых к насекомым растений также описаны в отчете BATS (Zentrum für Biosicherheit und Nachhaltigkeit, Zentrum BATS, Clarastrasse 13, 4058 Базель, Швейцария) (<http://bats.ch>) за 2003 год.

Термин "сельскохозяйственные культуры" следует понимать как включающий также культурные растения, которые были трансформированы с помощью методик с применением рекомбинантных ДНК таким образом, что они приобрели способность к синтезу антипатогенных веществ избирательного действия, таких как, например, так называемые "связанные с патогенезом белки" (PRP, см., например, EP-A-0392225).
5 Примеры таких антипатогенных веществ и трансгенных растений, способных синтезировать такие антипатогенные вещества, известны, например, из EP-A-0392225, WO 95/33818 и EP-A-0353191. Способы получения таких трансгенных растений общеизвестны специалисту в данной области и описаны, например, в публикациях,
10 упомянутых выше.

Сельскохозяйственные культуры также могут быть модифицированы для обеспечения повышенной устойчивости к грибковым (например, Fusarium, Anthracnose или Phytophthora), бактериальным (например, Pseudomonas) или вирусным (например,
15 вирус скручивания листьев картофеля, вирус пятнистой бронзовости томата, вирус мозаики огурца) патогенам.

Сельскохозяйственные культуры также включают культуры, характеризующиеся повышенной устойчивостью к нематодам, таким как соевая цистообразующая
20 нематода.

Сельскохозяйственные культуры, которые имеют толерантность по отношению к абиотическому стрессу, включают культуры, которые характеризуются повышенной толерантностью по отношению к засухе, высокому содержанию соли, высокой температуре, холоду, заморозкам или световому излучению, например, благодаря
25 экспрессии NF-YB или других белков, известных в данной области техники.

Антипатогенные вещества, которые могут экспрессироваться такими трансгенными растениями, включают, например, блокаторы ионных каналов, такие как блокаторы натриевых и кальциевых каналов, например, вирусные токсины KP1, KP4 или KP6;
30 стильбенсинтазы; бибензилсинтазы; хитиназы; глюканазы; так называемые "связанные с патогенезом белки" (PRP; см., например, EP-A-0392225); антипатогенные вещества, вырабатываемые микроорганизмами, например, пептидные антибиотики или гетероциклические антибиотики (см., например, WO 95/33818) или белковые или

полипептидные факторы, вовлеченные в защиту растения от патогенов (так называемые "гены устойчивости к заболеваниям растений", описанные в WO 03/000906).

5 Дополнительными областями применения композиций согласно настоящему изобретению являются защита хранящихся товаров и складских помещений и защита сырьевых материалов, таких как древесина, ткани, покрытия для пола или строительные материалы, а также применение в области санитарии, в частности защиты человека, домашних животных и продуктивного скота от вредителей
10 упомянутого типа.

В настоящем изобретении также предусмотрен способ контроля вредителей (таких как комары и другие переносчики заболеваний; см. также http://www.who.int/malaria/vector_control/irs/en/). В одном варианте осуществления
15 способ контроля вредителей включает применение композиций по настоящему изобретению по отношению к целевым вредителям, по отношению к их месту обитания или по отношению к поверхности или субстрату путем нанесения кистью, нанесения валиком, опрыскивания, нанесения методом распределения или погружения. В качестве примера в способе по настоящему изобретению предполагается IRS-применение
20 (опрыскивание пестицидами остаточного действия внутри помещений) по отношению к поверхности, такой как поверхность стены, потолка или пола. В другом варианте осуществления предполагается применение таких композиций по отношению к субстрату, такому как нетканый или тканый материал в виде (или который может применяться в изготовлении) сетки, одежды, постельных принадлежностей, занавесок и
25 палаток.

В одном варианте осуществления способ контроля таких вредителей включает применение пестицидно эффективного количества композиций по настоящему изобретению по отношению к целевым вредителям, по отношению к их месту обитания
30 или по отношению к поверхности или субстрату, за счет чего обеспечивается эффективный уровень активности пестицидов остаточного действия на поверхности или субстрате. Такое применение пестицидной композиции по настоящему изобретению можно осуществлять путем нанесения кистью, нанесения валиком,

опрыскивания, нанесения методом распределения или погружения. В качестве примера способ по настоящему изобретению предполагает IRS-применение по отношению к поверхности, такой как поверхность стены, потолка или пола, для обеспечения эффективной активности пестицидов остаточного действия на поверхности. В другом варианте осуществления предполагается применение таких композиций для контроля вредителей на субстрате, таком как тканый материал в виде (или который может применяться в изготовлении) сетки, одежды, постельных принадлежностей, занавесок и палаток, за счет остаточного действия.

Субстраты, включая подлежащие обработке нетканые материалы, тканые материалы или сетку, могут быть изготовленными из натуральных волокон, таких как хлопок, рафия, джут, лен, сизаль, мешковина или шерсть, или из синтетических волокон, таких как полиамид, сложный полиэфир, полипропилен, полиакрилонитрил и т. п. Сложные полиэфиры являются особенно подходящими. Способы обработки тканей известны, например, из WO 2008/151984, WO 2003/034823, US 5631072, WO 2005/64072, WO2006/128870, EP 1724392, WO 2005113886 или WO 2007/090739.

Другими областями применения композиций согласно настоящему изобретению являются сфера применения для инъекции в деревья/обработки стволов всех декоративных деревьев, а также всех сортов плодовых и ореховых деревьев.

В сфере введения в дерево/обработки ствола полиморфы в соответствии с настоящим изобретением являются особенно подходящими против насекомых-древоточцев из отряда *Lepidoptera*, упоминаемых выше, и из отряда *Coleoptera*, особенно против древоточцев, перечисленных в следующих таблицах А и В.

Таблица А. Примеры завезенных древоточцев, имеющих экономическое значение

Семейство	Вид	Хозяин или заражаемая культура
Buprestidae	<i>Agilus planipennis</i>	Ясень
Cerambycidae	<i>Anoplura glabripennis</i>	Лиственные породы
Scolytidae	<i>Xylosandrus crassiusculus</i>	Лиственные породы
	<i>X. mutilatus</i>	Лиственные породы
	<i>Tomicus piniperda</i>	Хвойные породы

Таблица В. Примеры местных древоточцев, имеющих экономическое значение

Семейство	Вид	Хозяин или заражаемая культура
Buprestidae	<i>Agrilus anxius</i>	Береза
	<i>Agrilus politus</i>	Ива, клен
	<i>Agrilus sayi</i>	Восковница, сладкокорень
	<i>Agrilus vittaticollis</i>	Яблоня, груша, клюквя, ирга колосистая, боярышник
	<i>Chrysobothris femorata</i>	Яблоня, абрикос, бук, клен ясенелистный, вишня, каштан, смородина, вяз, боярышник, каркас, гикори, конский каштан, липа, клен, рябина, дуб, пекан, груша, персик, хурма, слива, тополь, айва, церцис, ирга колосистая, платан, грецкий орех, ива
	<i>Texania campestris</i>	Липа, бук, клен, дуб, платан, ива, тюльпанное дерево
Cerambycidae	<i>Goes pulverulentus</i>	Бук, вяз, шпанка Нуттала, ива, дуб красильный, красный болотный дуб, дуб черный, платан
	<i>Goes tigrinus</i>	Дуб
	<i>Neoclytus acuminatus</i>	Ясень, гикори, дуб, грецкий орех, береза, бук, клен, хмелеграб восточный, кизил, хурма, церцис, остролист, каркас, робиния лжеакация, гледичия трехлопучковая, тюльпанное дерево, каштан, маклюра оранжевая, сассафрас лекарственный, сирень, береза вишневая, груша, вишня, слива, персик, яблоня, вяз, липа, амбровое дерево
	<i>Neoptychodes trilineatus</i>	Инжир, ольха, шелковица, ива, каркас сетчатый
	<i>Oberea ocellata</i>	Сумах, яблоня, персик, слива, груша, смородина, ежевика
	<i>Oberea tripunctata</i>	Кизил, калина, вяз, оксидендрум древовидный, голубика, рододендрон, азалия, лавр, тополь, ива, шелковица
	<i>Oncideres cingulata</i>	Гикори, пекан, хурма, вяз, оксидендрум древовидный, липа, гледичия трехлопучковая, кизил, эвкалипт, дуб, каркас, клен, плодовые деревья
<i>Saperda calcarata</i>	Тополь	
<i>Strophiona nitens</i>	Каштан, дуб, гикори, грецкий орех, бук, клен	
Scolytidae	<i>Corthylus columbianus</i>	Клен, дуб, тюльпанное дерево, бук, клен ясенелистный, платан, береза, липа, каштан, вяз
	<i>Dendroctonus frontalis</i>	Сосна
	<i>Dryocoetes betulae</i>	Береза, амбровое дерево, дикая вишня, бук, груша
	<i>Monarthrum fasciatum</i>	Дуб, клен, береза, каштан, амбровое дерево, эвкалипт скученный, тополь, гикори, мимоза, яблоня, персик, сосна
	<i>Phloeotribus liminaris</i>	Персик, вишня, слива, черешня, вяз, шелковица, рябина
<i>Pseudopityophthorus pruinosis</i>	Дуб, бук американский, черешня, слива узколистная, каштан, клен, гикори, граб, хмелеграб	
Sesiidae	<i>Paranthrene simulans</i>	Дуб, каштан американский
	<i>Sannina uroceriformis</i>	Хурма
	<i>Synanthedon exitiosa</i>	Персик, слива, нектарин, вишня, абрикос, миндаль, черешня
	<i>Synanthedon pictipes</i>	Персик, слива, вишня, бук, черешня
	<i>Synanthedon rubrofascia</i>	Нисса
	<i>Synanthedon scitula</i>	Кизил, пекан, гикори, дуб, каштан, бук, береза, черешня, вяз, рябина, калина, ива, яблоня, мушмула японская, пузыреплодник, восковница
<i>Vitacea polistiformis</i>	Виноград	

Настоящее изобретение также можно применять для контроля любых насекомых-вредителей, которые могут присутствовать в газонной траве, в том числе, например, жуков, гусениц, огненных муравьев, червецов, двупарноногих многоножек, мокриц, микроскопических клещей, медведок, щитовок, мучнистых червецов, иксодовых клещей, пенниц, южных земляных клопов и личинок хруща. Настоящее изобретение можно применять для контроля насекомых-вредителей на различных стадиях их жизненного цикла, в том числе на стадии яиц, личинок, нимф и взрослых особей.

В частности, настоящее изобретение можно применять для контроля насекомых-вредителей, которые питаются корнями газонной травы, в том числе личинок хруща (таких как *Cyclocephala spp.* (например, масковый хрущ, *C. lurida*), *Rhizotrogus spp.* (например, хрущ европейский, *R. majalis*), *Cotinus spp.* (например, хрущ блестящий зеленый, *C. nitida*), *Popillia spp.* (например, хрущик японский, *P. japonica*), *Phyllophaga spp.* (например, майский/июньский хрущ), *Ataenius spp.* (например, черный корневого жука рода *Ataenius*, *A. spretulus*), *Maladera spp.* (например, хрущик азиатский садовый *M. castanea*) и *Tomarus spp.*), червецы (*Margarodes spp.*), медведки (темно-желтая, южная и короткокрылая; *Scapteriscus spp.*, *Grylotalpa africana*) и личинок комаров-долгоножек (долгоножка болотная, *Tipula spp.*).

Настоящее изобретение также можно применять для контроля насекомых-вредителей газонной травы, которые обитают в солоmine, в том числе "походных червей" (таких как совка травяная *Spodoptera frugiperda* и совка луговая *Pseudaletia unipuncta*), гусениц озимой совки, долгоносики (*Sphenophorus spp.*, таких как *S. venatus verstitus* и *S. parvulus*) и луговых мотыльков (таких как *Crambus spp.* и тропические луговые мотыльки, *Herpetogramma phaeopteralis*).

Настоящее изобретение также можно применять для контроля насекомых-вредителей газонной травы, которые живут над землей и питаются листьями газонной травы, в том числе земляных клопов (таких как земляные клопы, *Blissus insularis*), клеща бермудской травы (*Eriophyes cynodoniensis*), мучнистого червеца родовой травы (*Antonina graminis*), пенницы двухполосой (*Prospapia bicincta*), цикадок, гусениц озимой совки (семейства *Noctuidae*) и тлей злаковых.

Настоящее изобретение также можно применять для контроля других вредителей газонной травы, таких как муравьи огненные импортные красные (*Solenopsis invicta*), которые создают муравейники на поверхности газона.

В области санитарии композиции согласно настоящему изобретению характеризуются активностью против эктопаразитов, таких как иксодовые клещи, аргазовые клещи, зудни чесоточные, краснотелковые клещи, мухи (жалящие и лижущие), личинки паразитических мух, вши, головные вши, пухоеды и блохи.

5 Примерами таких паразитов являются следующие.

Из отряда Anoplurida: *Haematopinus* spp., *Linognathus* spp., *Pediculus* spp. и *Phtirus* spp., *Solenopotes* spp..

10 Из отряда Mallophagida: *Trimenopon* spp., *Menopon* spp., *Trinoton* spp., *Bovicola* spp., *Werneckiella* spp., *Lepikentron* spp., *Damalina* spp., *Trichodectes* spp. и *Felicola* spp..

15 Из отряда Diptera и подотрядов Nematocera и Brachycera, например, *Aedes* spp., *Anopheles* spp., *Culex* spp., *Simulium* spp., *Eusimulium* spp., *Phlebotomus* spp., *Lutzomyia* spp., *Culicoides* spp., *Chrysops* spp., *Hybomitra* spp., *Atylotus* spp., *Tabanus* spp., *Haematopota* spp., *Philipomyia* spp., *Braula* spp., *Musca* spp., *Hydrotaea* spp., *Stomoxys* spp., *Haematobia* spp., *Morellia* spp., *Fannia* spp., *Glossina* spp., *Calliphora* spp., *Lucilia* spp., *Chrysomyia* spp., *Wohlfahrtia* spp., *Sarcophaga* spp., *Oestrus* spp., *Hypoderma* spp., *Gasterophilus* spp., *Hippobosca* spp., *Lipoptena* spp. и *Melophagus* spp.

20 Из отряда Siphonaptera, например, *Pulex* spp., *Ctenocephalides* spp., *Xenopsylla* spp., *Ceratophyllus* spp.

Из отряда Heteroptera, например, *Cimex* spp., *Triatoma* spp., *Rhodnius* spp., *Panstrongylus* spp.

25 Из отряда Blattaria, например, *Blatta orientalis*, *Periplaneta americana*, *Blattella germanica* и *Supella* spp.

30 Из подкласса Acaria (Acarida) и отрядов Meta- и Mesostigmata, например, *Argas* spp., *Ornithodoros* spp., *Otobius* spp., *Ixodes* spp., *Amblyomma* spp., *Boophilus* spp., *Dermacentor* spp., *Haemophysalis* spp., *Hyalomma* spp., *Rhipicephalus* spp., *Dermanyssus* spp., *Raillietia* spp., *Pneumonyssus* spp., *Sternostoma* spp. и *Varroa* spp.

Из отрядов Actinedida (Prostigmata) и Acaridida (Astigmata), например *Acarapis* spp., *Cheyletiella* spp., *Ornithocheyletia* spp., *Myobia* spp., *Psorergates* spp., *Demodex* spp., *Trombicula* spp., *Listrophorus* spp., *Acarus* spp., *Tyrophagus* spp., *Caloglyphus* spp., *Hypodectes* spp., *Pterolichus* spp., *Psoroptes* spp., *Chorioptes* spp., *Otodectes* spp., *Sarcoptes* spp., *Notoedres* spp., *Knemidocoptes* spp., *Cytodites* spp. и *Laminosioptes* spp.

Композиции согласно настоящему изобретения также подходят для защиты от заражения насекомыми в случае материалов, таких как древесина, ткани, пластики, адгезивы, виды клея, краски, бумага и картон, кожа, покрытия для пола и строительные материалы.

Композиции согласно настоящему изобретению можно применять, например, против следующих вредителей: жуков, таких как *Hylotrupes bajulus*, *Chlorophorus pilosis*, *Anobium punctatum*, *Xestobium rufovillosum*, *Ptilinuspecticornis*, *Dendrobium pertinex*, *Ernobius mollis*, *Priobium carpini*, *Lyctus brunneus*, *Lyctus africanus*, *Lyctus planicollis*, *Lyctus linearis*, *Lyctus pubescens*, *Trogoxylon aequale*, *Minthesrugicollis*, *Xyleborus* spec., *Tryptodendron* spec., *Apate monachus*, *Bostrychus capucins*, *Heterobostrychus brunneus*, *Sinoxylon* spec. и *Dinoderus minutus*, а также перепончатокрылых насекомых, таких как *Sirex juvencus*, *Urocerus gigas*, *Urocerus gigas taignus* и *Urocerus augur*, и термитов, таких как *Kaloterme flavicollis*, *Cryptoterme brevis*, *Heteroterme indicola*, *Reticuliterme flavipes*, *Reticuliterme santonensis*, *Reticuliterme lucifugus*, *Mastoterme darwiniensis*, *Zootermopsis nevadensis* и *Coptoterme formosanus*, и щетинохвосток, таких как *Lepisma saccharina*.

Соединения согласно настоящему изобретению можно применять в качестве пестицидных средств в немодифицированной форме, но обычно их составляют в композиции различными способами с применением вспомогательных веществ для составления, таких как носители, растворители и поверхностно-активные вещества. Составы могут быть представлены в различных физических формах, например, в форме распыляемых порошков, гелей, смачиваемых порошков, диспергируемых в воде гранул, диспергируемых в воде таблеток, шипучих драже, эмульгируемых концентратов, концентратов микроэмульсий, эмульсий типа "масло в воде", масляных текучих составов, водных дисперсий, масляных дисперсий, суспензий, капсульных

- суспензий, эмульгируемых гранул, растворимых жидкостей, водорастворимых концентратов (с водой или смешиваемым с водой органическим растворителем в качестве носителя), пропитанных полимерных пленок или в других формах, известных, например, из Manual on Development and Use of FAO and WHO Specifications for Pesticides, United Nations, First Edition, Second Revision (2010). Такие составы можно либо применять непосредственно, либо разбавлять перед применением. Разбавления можно осуществлять, например, с помощью воды, жидких удобрений, питательных микроэлементов, биологических организмов, масла или растворителей.
- 10 Составы можно получать, например, путем смешивания активного ингредиента со вспомогательными веществами для составления с получением композиций в форме тонкодисперсных твердых веществ, гранул, растворов, дисперсий или эмульсий. Активные ингредиенты также можно составлять с другими вспомогательными веществами, например, тонкодисперсными твердыми веществами, минеральными
- 15 маслами, маслами растительного или животного происхождения, модифицированными маслами растительного или животного происхождения, органическими растворителями, водой, поверхностно-активными веществами или их комбинациями. Активные ингредиенты также могут содержаться в очень мелких микрокапсулах. Микрокапсулы содержат активные ингредиенты в пористом носителе. Это
- 20 обеспечивает возможность высвобождения активных ингредиентов в окружающую среду в регулируемых количествах (например, медленного высвобождения). Микрокапсулы обычно имеют диаметр от 0,1 до 500 микрон. Они содержат активные ингредиенты в количестве от приблизительно 25 до 95% по весу от веса капсулы. Активные ингредиенты могут находиться в форме монолитного твердого вещества, в
- 25 форме мелких частиц в твердой или жидкой дисперсии или в форме подходящего раствора. Инкапсулирующие мембраны могут содержать, например, природные и синтетические каучуки, целлюлозу, сополимеры стирола и бутадиена, полиакрилонитрил, полиакрилат, сложные полиэфиры, полиамиды, полимочевины, полиуретан или химически модифицированные полимеры и ксантаты крахмала или
- 30 другие полимеры, которые известны специалисту в данной области техники. В качестве альтернативы можно получать очень мелкие микрокапсулы, в которых активный ингредиент содержится в виде мелкодисперсных частиц в твердой матрице основного вещества, однако микрокапсулы сами по себе не инкапсулированы.

Вспомогательные вещества для составления, которые подходят для получения композиций согласно настоящему изобретению, известны *per se*. В качестве жидких носителей можно применять воду, толуол, ксилол, петролейный эфир, растительные масла, ацетон, метилэтилкетон, циклогексанон, ангидриды кислот, ацетонитрил, ацетофенон, амилацетат, 2-бутанон, бутиленкарбонат, хлорбензол, циклогексан, циклогексанол, алкиловые эфиры уксусной кислоты, диацетоновый спирт, 1,2-дихлорпропан, диэтаноламин, п-диэтилбензол, диэтиленгликоль, абиетат диэтиленгликоля, диэтиленгликольбутиловый эфир, диэтиленгликольэтиловый эфир, диэтиленгликольметиловый эфир, *N,N*-диметилформамид, диметилсульфоксид, 1,4-диоксан, дипропиленгликоль, дипропиленгликольметиловый эфир, дибензоат дипропиленгликоля, дипрокситол, алкилпирролидон, этилацетат, 2-этилгексанол, этиленкарбонат, 1,1,1-трихлорэтан, 2-гептанон, альфа-пинен, d-лимонен, этиллактат, этиленгликоль, этиленгликольбутиловый эфир, этиленгликольметиловый эфир, гамма-бутиролактон, глицерин, ацетат глицерина, диацетат глицерина, триацетат глицерина, гексадекан, гексиленгликоль, изоамилацетат, изоборнилацетат, изооктан, изофорон, изопропилбензол, изопропилмиристат, молочную кислоту, лауриламин, мезитилоксид, метоксипропанол, метилизоамилкетон, метилизобутилкетон, метиллаурат, метилоктаноат, метилолеат, метиленхлорид, м-ксилол, *n*-гексан, *n*-октиламин, октадекановую кислоту, октиламинацетат, олеиновую кислоту, олеиламин, о-ксилол, фенол, полиэтиленгликоль, пропионовую кислоту, пропиллактат, пропиленкарбонат, пропиленгликоль, пропиленгликольметиловый эфир, п-ксилол, толуол, триэтилфосфат, триэтиленгликоль, ксилолсульфоновую кислоту, парафин, минеральное масло, трихлорэтилен, перхлорэтилен, этилацетат, амилацетат, бутилацетат, пропиленгликольметиловый эфир, диэтиленгликольметиловый эфир, метанол, этанол, изопропанол и высокомолекулярные спирты, такие как амиловый спирт, тетрагидрофурфуриловый спирт, гексанол, октанол, этиленгликоль, пропиленгликоль, глицерин, *N*-метил-2-пирролидон и т. п.

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

- Большое количество поверхностно-активных веществ можно успешно использовать как в твердых, так и в жидких составах, особенно в тех составах, которые можно разбавлять носителем перед применением. Поверхностно-активные вещества могут быть анионными, катионными, неионогенными или полимерными, и их можно
- 5 применять в качестве эмульгаторов, смачивающих средств или суспендирующих средств или для других целей. Типичные поверхностно-активные вещества включают, например, соли алкилсульфатов, такие как лаурилсульфат диэтаноламмония; соли алкиларилсульфонатов, такие как додецилбензолсульфонат кальция; продукты присоединения алкилфенола/алкиленоксида, такие как этилоксилат нонилфенола;
- 10 продукты присоединения спирта/алкиленоксида, такие как этоксилат тридецилового спирта; мыла, такие как стеарат натрия; соли алкилнафталинсульфонатов, такие как дибутилнафталинсульфонат натрия; сложные диалкиловые эфиры сульфосукцинатных солей, такие как ди(2-этилгексил)сульфосукцинат натрия; сложные эфиры сорбита, такие как сорбитолеат; четвертичные амины, такие как хлорид
- 15 лаурилтриметиламмония, сложные полиэтиленгликолевые эфиры жирных кислот, такие как стеарат полиэтиленгликоля; блок-сополимеры этиленоксида и пропиленоксида и соли моно- и диалкилфосфатных сложных эфиров; а также дополнительные вещества, описанные, например, в McCutcheon's Detergents and Emulsifiers Annual, MC Publishing Corp., Ridgewood New Jersey (1981).
- 20 Дополнительные вспомогательные вещества, которые можно использовать в пестицидных составах, включают ингибиторы кристаллизации, модификаторы вязкости, суспендирующие средства, красители, антиоксиданты, вспенивающие средства, поглотители света, вспомогательные средства для смешивания, противовспениватели, комплексообразующие средства, нейтрализующие или рН-
- 25 модифицирующие вещества и буферы, ингибиторы коррозии, отдушки, смачивающие средства, усилители поглощения, питательные микроэлементы, пластификаторы, вещества, способствующие скольжению, смазывающие вещества, диспергирующие вещества, загустители, антифризы, микробициды, а также жидкие и твердые удобрения.
- 30 Композиции согласно настоящему изобретению могут включать добавку, содержащую масло растительного или животного происхождения, минеральное масло, сложные алкиловые эфиры таких масел или смеси таких масел и производные масел. Количество масляной добавки в композиции согласно настоящему изобретению обычно составляет

от 0,01 до 10% в пересчете на смесь, подлежащую применению. Например, масляную добавку можно добавлять в резервуар опрыскивателя в необходимой концентрации после приготовления смеси для опрыскивания. Предпочтительные масляные добавки содержат минеральные масла или масло растительного происхождения, например, рапсовое масло, оливковое масло или подсолнечное масло, эмульгированное растительное масло, сложные алкиловые эфиры масел растительного происхождения, например метиловые производные, или масло животного происхождения, такое как рыбий жир или говяжий жир. Предпочтительные масляные добавки содержат сложные алкиловые эфиры C_8 - C_{22} жирных кислот, в частности, метиловые производные C_{12} - C_{18} жирных кислот, например, сложные метиловые эфиры лауриновой кислоты, пальмитиновой кислоты и олеиновой кислоты (метиллаурат, метилпальмитат и метилолеат соответственно). Многие производные масел известны из Compendium of Herbicide Adjuvants, 10th Edition, Southern Illinois University, 2010.

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

Нормы применения варьируются в широких пределах и зависят от свойств почвы, способа применения, культурного растения, вредителя, подлежащего контролю, преобладающих климатических условий и других факторов, определяемых способом применения, временем применения и целевой сельскохозяйственной культурой. В качестве общей рекомендации, соединения можно применять при норме от 1 до 2000 л/га, в частности от 10 до 1000 л/га.

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

Эмульгируемые концентраты:

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

Пылевидные препараты:

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

5

Суспензионные концентраты:

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

10

Смачиваемые порошки:

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

15

Гранулы:

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

20 Следующие примеры дополнительно иллюстрируют, но не ограничивают настоящее изобретение.

<u>Смачиваемые порошки</u>	a)	b)	c)
активные ингредиенты	25 %	50 %	75 %
лигносульфонат натрия	5 %	5 %	-
лаурилсульфат натрия	3 %	-	5 %
диизобутилнафталинсульфонат натрия	-	6 %	10 %
фенолполиэтиленгликолевый эфир (7-8 моль этиленоксида)	-	2 %	-
высокодисперсная кремниевая кислота	5 %	10 %	10 %
каолин	62 %	27 %	-

Комбинацию тщательно смешивают со вспомогательными веществами и смесь тщательно измельчают в подходящей мельнице с получением смачиваемых порошков,

которые можно разбавлять водой с получением суспензий с необходимой концентрацией.

<u>Порошки для сухой обработки семян</u>	a)	b)	c)
активные ингредиенты	25 %	50 %	75 %
легкое минеральное масло	5 %	5 %	5 %
высокодисперсная кремниевая кислота	5 %	5 %	-
каолин	65 %	40 %	-
тальк	-		20%

5 Комбинацию тщательно смешивают со вспомогательными веществами и тщательно измельчают смесь в подходящей мельнице с получением порошков, которые можно использовать непосредственно для обработки семян.

<u>Эмульгируемый концентрат</u>	
активные ингредиенты	10 %
октилфенолполиэтиленгликолевый эфир (4-5 моль этиленоксида)	3 %
додецилбензолсульфонат кальция	3 %
простой полигликолевый эфир касторового масла (35 моль этиленоксида)	4 %
циклогексанон	30 %
смесь ксилолов	50 %

Из этого концентрата путем разбавления водой можно получить эмульсии любого необходимого разбавления, которые можно применять для защиты растений.

<u>Пылевидные препараты</u>	a)	b)	c)
активные ингредиенты	5 %	6 %	4 %
тальк	95 %	-	-
каолин	-	94 %	-
минеральный наполнитель	-	-	96 %

Готовые к применению пылевидные препараты получают путем смешивания комбинации с носителем и измельчения смеси в подходящей мельнице. Такие порошки также можно применять для сухого протравливания семян.

<u>Экструдированные гранулы</u>	
активные ингредиенты	15 %
лигносульфонат натрия	2 %
карбоксиметилцеллюлоза	1 %
каолин	82 %

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

<u>Покрытые оболочкой гранулы</u>	
активные ингредиенты	8 %
полиэтиленгликоль (молекулярная масса 200)	3 %
каолин	89 %

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

Суспензионный концентрат

активные ингредиенты	40 %
пропиленгликоль	10 %
нонилфенолполиэтиленгликолевый эфир (15 моль этиленоксида)	6 %
лигносульфонат натрия	10 %
карбоксиметилцеллюлоза	1 %
силиконовое масло (в виде 75% эмульсии в воде)	1 %
вода	32 %

Тонкоизмельченную комбинацию тщательно смешивают со вспомогательными веществами с получением суспензионного концентрата, из которого путем разбавления

водой можно получать суспензии любого необходимого разбавления. С помощью таких разбавленных растворов можно обработать и защитить от заражения микроорганизмами живые растения, а также материал для размножения растений путем опрыскивания, полива или погружения.

5 Текущий концентрат для обработки семян

активные ингредиенты	40 %
пропиленгликоль	5 %
сополимер бутанола и РО/ЕО	2 %
тристиролфенол с 10-20 молями ЕО	2 %
1,2-бензизотиазолин-3-он (в виде 20% раствора в воде)	0,5 %
кальциевая соль моноазопигмента	5 %
силиконовое масло (в виде 75% эмульсии в воде)	0,2 %
вода	45,3 %

10 Тонкоизмельченную комбинацию тщательно смешивают со вспомогательными веществами с получением суспензионного концентрата, из которого путем разбавления водой можно получать суспензии любого необходимого разбавления. С помощью таких разбавленных растворов можно обработать и защитить от заражения микроорганизмами живые растения, а также материал для размножения растений путем опрыскивания, полива или погружения.

Капсульная суспензия с медленным высвобождением

15 Смешивают 28 частей комбинации с 2 частями ароматического растворителя и 7 частями смеси толуолдиизоцианат/полиметилен-полифенилизоцианат (8:1). Эту смесь эмульгируют в смеси из 1,2 части поливинилового спирта, 0,05 части пеногасителя и 51,6 части воды до получения частиц требуемого размера. К этой эмульсии добавляют смесь из 2,8 части 1,6-диаминогексана в 5,3 части воды. Смесь перемешивают до завершения реакции полимеризации. Полученную капсульную суспензию
20 стабилизируют путем добавления 0,25 части загустителя и 3 частей диспергирующего средства. Состав капсульной суспензии содержит 28% активных ингредиентов. Средний диаметр капсул составляет 8-15 микрон. Полученный состав применяют по отношению к семенам в виде водной суспензии в устройстве, подходящем для данной цели.

Типы составов включают эмульсионный концентрат (EC), суспензионный концентрат (SC), суспензию (SE), капсульную суспензию (CS), диспергируемую в воде гранулу (WG), эмульгируемую гранулу (EG), эмульсию типа "вода в масле" (EO), эмульсию типа "масло в воде" (EW), микроэмульсию (ME), масляную дисперсию (OD), смешиваемый с маслом текучий состав (OF), смешиваемую с маслом жидкость (OL), растворимый концентрат (SL), суспензию для внесения в ультрамалом объеме (SU), жидкость для внесения в ультрамалом объеме (UL), технический концентрат (TK), диспергируемый концентрат (DC), смачиваемый порошок (WP), растворимую гранулу (SG) или любой другой технически возможный состав в комбинации с приемлемыми для сельскохозяйственного применения вспомогательными веществами.

Примеры получения

"Т. пл" означает температуру плавления в °С. Свободные радикалы представляют собой метильные группы. ¹H ЯМР-измерения регистрировали на спектрометре Bruker 400 МГц, химические сдвиги приведены в ppm согласно стандарту TMS. Спектры измеряли в указанных дейтерированных растворителях. Для определения характеристик соединений применяли любой из приведенных ниже способов LCMS. Характеристические значения LCMS, полученные для каждого соединения, представляли собой время удерживания ("Rt", регистрируемое в минутах) и измеренное содержание молекулярного иона (M+H)⁺ или (M-H)⁻. Удельное вращение [α]: образцы измеряли на поляриметре Autopol IV от Rudolph Research Analytical.

Способы LCMS.

Способ 1.

Спектры регистрировали на масс-спектрометре от Waters (одноквадрупольный масс-спектрометр ZQ), оснащенном источником электрораспыления (полярность: положительные или отрицательные ионы, напряжение на капилляре: 3,00 кВ, диапазон напряжений на конусе: 30-60 В, напряжение на экстракторе: 2,00 В, температура источника: 150°C, температура десольватации: 350°C, расход газа в конусе: 0 л/ч., расход газа для десольватации: 650 л/ч., диапазон масс: от 100 до 900 Да), и Acquity UPLC от Waters: насос для двухкомпонентных смесей, нагреваемое отделение для колонки и детектор на диодной матрице. Дегазатор растворителя, насос для двухкомпонентных смесей, нагреваемое отделение для колонки и детектор на диодной

матрице. Колонка: UPLC HSS T3, 1,8 мкм, 30 × 2,1 мм от Waters, температура: 60°C, диапазон значений длины волны DAD (нм): от 210 до 500, градиент растворителя: А = вода + 5% MeOH + 0,05% HCOOH, В = ацетонитрил + 0,05% HCOOH; градиент: 0 мин. 0% В, 100% А; 1,2-1,5 мин. 100% В; поток (мл/мин.) 0,85.

5 Способ 2

Спектры регистрировали на масс-спектрометре от Waters (одноквадрупольный масс-спектрометр SQD, SQDII), оснащенном источником электрораспыления (полярность: положительные и отрицательные ионы, напряжение на капилляре: 3,00 кВ, диапазон напряжений на конусе: 30 В, напряжение на экстракторе: 2,00 В, температура источника: 150°C, температура десольватации: 350°C, расход газа в конусе: 50 л/ч., расход газа для десольватации: 650 л/ч., диапазон масс: от 100 до 900 Да), и Acquity UPLC от Waters: насос для двухкомпонентных смесей, нагреваемое отделение для колонки, детектор на диодной матрице и детектор ELSD. Колонка: UPLC HSS T3, 1,8 мкм, 30 × 2,1 мм от Waters, температура: 60°C, диапазон значений длины волны DAD (нм): от 210 до 500, градиент растворителя: А = вода + 5% MeOH + 0,05% HCOOH, В = ацетонитрил + 0,05% HCOOH; градиент: 10-100% В за 1,2 мин.; поток (мл/мин.) 0,85.

Способ 3

Спектры регистрировали на масс-спектрометре от Agilent Technologies (трехквадрупольный масс-спектрометр 6410), оснащенном источником электрораспыления (полярность: переключатель положительной и отрицательной полярности, напряжение на капилляре: 4,00 кВ, напряжение на фрагменторе: 100,00 В, температура газа: 350°C, расход газа: 11 л/мин., газ-распылитель: 45 фунтов/кв. дюйм, диапазон масс: 110-1000 Да, диапазон значений длины волны DAD: 210-400 нм). Колонка: KINETEX EVO C18, длина 50 мм, диаметр 4,6 мм, размер частиц 2,6 мкм. Температура термостата колонки: 40°C. Градиент растворителя: А = вода с 0,1% муравьиной кислоты: ацетонитрил (95:5 об./об.). В = ацетонитрил с 0,1% муравьиной кислоты. Градиент = 0 мин. 90% А, 10% В; от 0,9 до 1,8 мин. 0% А, 100% В, от 2,2 до 2,5 мин. 90% А, 10% В. Скорость потока: 1,8 мл/мин.

30 Способ 4

Спектры регистрировали на масс-спектрометре от Waters (масс-спектрометр Acquity SDS), оснащенном источником электрораспыления (полярность: переключатель положительной и отрицательной полярности, напряжение на капилляре: 3,00 кВ,

напряжение на конусе: 41,00 В, температура источника: 150°C, расход газа для десольватации: 1000 л/ч., температура десольватации: 500°C, расход газа в конусе: 50 л/ч., диапазон масс: 110-800 Да, диапазон значений длины волны PDA: 210-400 нм. Колонка: Acquity UPLC HSS T3 C18, длина 30 мм, диаметр 2,1 мм, размер частиц 1,8 мкм. Температура термостата колонки: 40°C. Градиент растворителя: А = вода с 0,1% муравьиной кислоты: ацетонитрил (95:5 об./об.). В = ацетонитрил с 0,05% муравьиной кислоты. Градиент = 0 мин. 90% А, 10% В; 0,2 мин. 50% А, 50% В; от 0,7 до 1,3 мин. 0% А, 100% В; от 1,4 до 1,6 мин. 90% А, 10% В. Скорость потока: 0,8 мл/мин.

10 Способ 5

Спектры регистрировали на масс-спектрометре от Waters (масс-спектрометр Acquity SDS), оснащенном источником электрораспыления (полярность: переключатель положительной и отрицательной полярности, напряжение на капилляре: 3,00 кВ, напряжение на конусе: 41,00 В, температура источника: 150°C, расход газа для десольватации: 1000 л/ч., температура десольватации: 500°C, расход газа в конусе: 50 л/ч., диапазон масс: 110-800 Да, диапазон значений длины волны PDA: 210-400 нм. Колонка: Acquity UPLC HSS T3 C18, длина 30 мм, диаметр 2,1 мм, размер частиц 1,8 мкм. Температура термостата колонки 40°C. Градиент растворителя: А = вода с 0,1% муравьиной кислоты: ацетонитрил (95:5 об./об.). В = ацетонитрил с 0,05% муравьиной кислоты. Градиент = 0 мин. 90% А, 10% В; 0,2 мин. 50% А, 50% В; от 0,7 до 1,3 мин. 0% А, 100% В; от 1,4 до 1,6 мин. 90% А, 10% В. Скорость потока: 0,6 мл/мин.

Способ 6

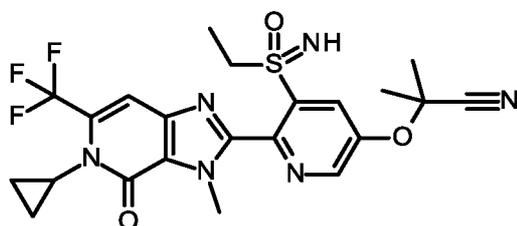
Спектры регистрировали на масс-спектрометре от Waters (одноквадрупольный масс-спектрометр SQD, SQDII), оснащенном источником электрораспыления (полярность: положительные и отрицательные ионы), напряжение на капилляре: 3,00 кВ, диапазон напряжений на конусе: 30 В, напряжение на экстракторе: 2,00 В, температура источника: 150°C, температура десольватации: 350°C, расход газа в конусе: 50 л/ч., расход газа для десольватации: 650 л/ч., диапазон масс: от 100 до 900 Да), и Acquity UPLC от Waters: насос для двухкомпонентных смесей, нагреваемое отделение для колонки, детектор на диодной матрице и детектор ELSD. Колонка: UPLC HSS T3, 1,8 мкм, 30 × 2,1 мм от Waters, температура: 60°C, диапазон значений длины волны DAD (нм): от 210 до 500, градиент растворителя: А = вода + 5% MeOH + 0,05%

НСООН, В = ацетонитрил + 0,05% НСООН; градиент: 10-100% В за 2,7 мин.; поток (мл/мин.) 0,85.

Получение примеров соединений формулы (I)

5

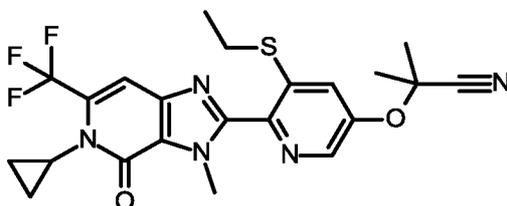
ПРИМЕР P1. Получение рацемического 2-[[6-[5-циклопропил-3-метил-4-оксо-6-(трифторметил)имидазо[4,5-с]пиридин-2-ил]-5-(этилсульфонимидоил)-3-пиридил]окси]-2-метилпропаннитрила (соединение P1) и его отдельных энантимеров (соединения P1-A и P1-B)



(P1)

10

Стадия 1. Получение 2-[[6-[5-циклопропил-3-метил-4-оксо-6-(трифторметил)имидазо[4,5-с]пиридин-2-ил]-5-этилсульфанил-3-пиридил]окси]-2-метилпропаннитрила

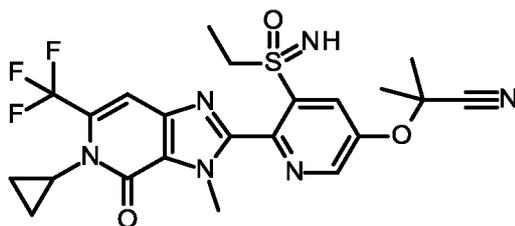


15 Данное соединение получали аналогично способам, описанным в WO2020/084075.

LCMS (способ 3): масса/заряд 478 [M+H]⁺; время удерживания: 1,54 мин.

Стадия 2. Получение рацемического 2-[[6-[5-циклопропил-3-метил-4-оксо-6-(трифторметил)имидазо[4,5-с]пиридин-2-ил]-5-(этилсульфонимидоил)-3-пиридил]окси]-2-метилпропаннитрила (соединение P1)

20



(P1)

2-[[6-[5-Циклопропил-3-метил-4-оксо-6-(трифторметил)имидазо[4,5-с]пиридин-2-ил]-5-этилсульфанил-3-пиридил]окси]-2-метилпропаннитрил (полученный, как описано выше) обрабатывали в условиях, аналогичных описанным на стадии 2 примера P12, и аналогично способам, описанным в WO2020/084075, с получением требуемого соединения P1. LCMS (способ 4): масса/заряд 509 [M+H]⁺; время удерживания: 0,92 мин.

Стадия 3. Получение соединений P1-A и P1-B, представляющих собой отдельные энантиомеры

10 Рацемическую смесь 2-[[6-[5-циклопропил-3-метил-4-оксо-6-(трифторметил)имидазо[4,5-с]пиридин-2-ил]-5-(этилсульфонимидоил)-3-пиридил]окси]-2-метилпропаннитрил (соединение P1) подвергали хиральному разделению посредством препаративной SFC с применением условий, указанных далее в данном документе.

15

Способ аналитической SFC

SFC: Waters Acquity UPC²/QDa

Детектор PDA Waters Acquity UPC²

Колонка: Daicel SFC CHIRALPAK[®] IA, 3 мкм, 0,3 см x 10 см, 40°C

20 Подвижная фаза: А: CO₂ В: iPrOH изократический режим: 20% В за 4,8 мин.

ABPR: 1800 фунтов/кв. дюйм

Скорость потока: 2,0 мл/мин.

Обнаружение: при 220 нм

Концентрация образца: 1 мг/мл

25 Объем впрыска: 1 мкл

Способ препаративной SFC

Sepiatec Prep SFC 100

Колонка: Daicel CHIRALPAK[®] IA, 5 мкм, 2,0 см x 25 см

30 Подвижная фаза: А: CO₂ В: iPrOH изократический режим: 20% В за 14 мин.

Противодавление: 150 бар

Скорость потока: 60 мл/мин.

Насос GLS: 2 мл MeOH

Обнаружение: в УФ при 220 нм

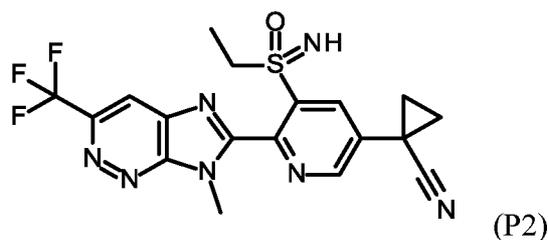
Образец: в MeOH/DCM

Результаты

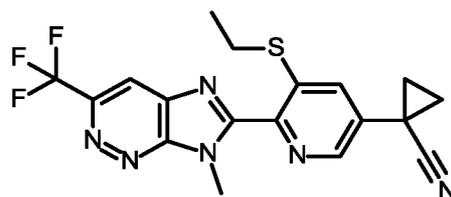
Энантиомер P1-A, который элюируется первым	Энантиомер P1-B, который элюируется вторым
Время удерживания (мин.) ~1,81	Время удерживания (мин.) ~3,75
Химическая чистота (% площади при 220 нм) 99	Химическая чистота (% площади при 220 нм) 99
Энантиомерный избыток (%) >99	Энантиомерный избыток (%) >99

5

ПРИМЕР P2. Получение рацемического 1-[5-(этилсульфонимидоил)-6-[7-метил-3-(трифторметил)имидазо[4,5-с]пиридазин-6-ил]-3-пиридил]циклопропанкарбонитрила (соединение P2) и его отдельных энантиомеров (соединения P2-A и P2-B)



10 Стадия 1. Получение 1-[5-этилсульфанил-6-[7-метил-3-(трифторметил)имидазо[4,5-с]пиридазин-6-ил]-3-пиридил]циклопропанкарбонитрила

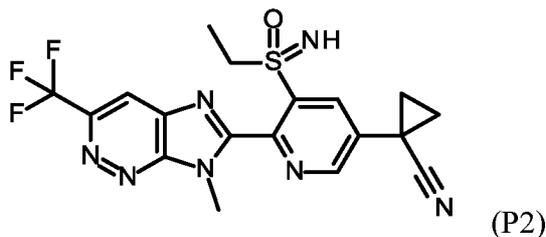


Данное соединение получали аналогично способам, описанным в WO2019/234158.

LCMS (способ 6): масса/заряд 405 [M+H]⁺; время удерживания: 1,05 мин.

15

Стадия 2. Получение рацемического 1-[5-(этилсульфонимидоил)-6-[7-метил-3-(трифторметил)имидазо[4,5-с]пиридазин-6-ил]-3-пиридил]циклопропанкарбонитрила (соединение P2)



1-[5-Этилсульфанил-6-[7-метил-3-(трифторметил)имидазо[4,5-с]пиридазин-6-ил]-3-пиридил]циклопропанкарбонитрил (полученный, как описано выше) обрабатывали в условиях, аналогичных описанным на стадии 2 примера P12, и аналогично способам, описанным в WO2019/234158, с получением требуемого соединения P2. LCMS (способ 5): масса/заряд 436 [M+H]⁺; время удерживания: 0,82 мин.

Стадия 3. Получение соединений P2-A и P2-B, представляющих собой отдельные энантиомеры

10 Рацемическую смесь 1-[5-(этилсульфонимидоил)-6-[7-метил-3-(трифторметил)имидазо[4,5-с]пиридазин-6-ил]-3-пиридил]циклопропанкарбонитрила (соединение P2) подвергали хиральному разделению посредством препаративной SFC с применением условий, указанных далее в данном документе.

15 Способ аналитической SFC

SFC: Waters Acquity UPC²/QDa

Детектор PDA Waters Acquity UPC²

Колонка: Daicel SFC CHIRALPAK[®] IC, 3 мкм, 0,46 см x 10 см, 40°C

Подвижная фаза: А: CO₂ В: EtOH изократический режим: 20% В за 4,8 мин.

20 АВРР: 1800 фунтов/кв. дюйм

Скорость потока: 2,0 мл/мин.

Обнаружение: при 265 нм

Концентрация образца: 1 мг/мл

Объем впрыска: 1 мл

25

Способ препаративной SFC

Sepiatec Prep SFC 100

Колонка: Daicel CHIRALPAK[®] IC, 5 мкм, 2,0 см x 25 см

Подвижная фаза: А: CO₂ В: EtOH изократический режим: 25% В

Противодавление: 150 бар

Скорость потока: 75 мл/мин.

Насос GLS: -

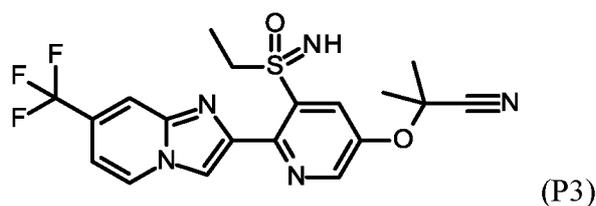
Обнаружение: в УФ при 265 нм

5 Образец: в DCM/ACN

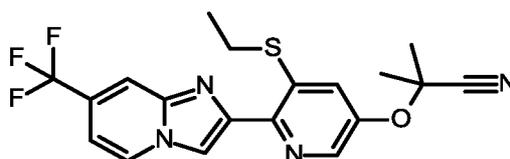
Результаты

Энантиомер Р2-А, который элюируется первым	Энантиомер Р2-В, который элюируется вторым
Время удерживания (мин.) ~1,36	Время удерживания (мин.) ~3,54
Химическая чистота (% площади при 265 нм) >99	Химическая чистота (% площади при 265 нм) >99
Энантиомерный избыток (%) >99	Энантиомерный избыток (%) >99

10 **ПРИМЕР Р3.** Получение рацемического 2-[[5-(этилсульфонимидоил)-6-[7-(трифторметил)имидазо[1,2-а]пиридин-2-ил]-3-пиридил]окси]-2-метилпропаннитрила (соединение Р3) и его отдельных энантиомеров (соединения Р3-А и Р3-В)



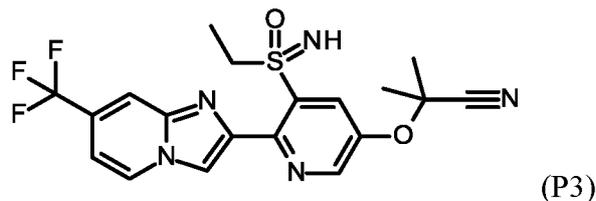
Стадия 1. Получение 2-[[5-этилсульфанил-6-[7-(трифторметил)имидазо[1,2-а]пиридин-2-ил]-3-пиридил]окси]-2-метилпропаннитрила



15 Данное соединение получали аналогично способам, описанным в WO2020/084075.

¹H ЯМР (400 МГц, хлороформ-d) δ ppm 1,44 (t, J=7,34Hz, 3H) 1,81(s, 6H) 3,04 (q, J=7,34Hz, 2H) 7,02 (dd, J1=7,34; J2=1,65Hz, 1H) 7,65 (d, J=2,57Hz, 1H) 8,06 (s, 1H) 8,29 (d, J=7,34Hz, 1H) 8,32 (d, J=2,57Hz, 1H) 8,37 (d, J=1,65Hz, 1H).

20 Стадия 2. Получение рацемического 2-[[5-(этилсульфонимидоил)-6-[7-(трифторметил)имидазо[1,2-а]пиридин-2-ил]-3-пиридил]окси]-2-метилпропаннитрила (соединение Р3)



2-[[5-Этилсульфанил-6-[7-(трифторметил)имидазо[1,2-а]пиридин-2-ил]-3-пиридил]окси]-2-метилпропаннитрил (полученный, как описано выше) обрабатывали в условиях, аналогичных описанным на стадии 2 примера P12, и аналогично способам, описанным в WO2020/084075, с получением требуемого соединения P3. LCMS (способ 1): масса/заряд 438 [M+H]⁺; время удерживания: 0,88 мин.

Стадия 3. Получение соединений P3-А и P3-В, представляющих собой отдельные энантиомеры

10 Рацемическую смесь 2-[[5-(этилсульфонимидоил)-6-[7-(трифторметил)имидазо[1,2-а]пиридин-2-ил]-3-пиридил]окси]-2-метилпропаннитрила (соединение P3) подвергали хиральному разделению посредством препаративной SFC с применением условий, указанных далее в данном документе.

15 Способ аналитической SFC

SFC: Waters Acquity UPC²/QDa

Детектор PDA Waters Acquity UPC²

Колонка: Daicel SFC CHIRALPAK[®] IC, 3 мкм, 0,3 см x 10 см, 40°C

Подвижная фаза: А: CO₂ В: MeOH изократический режим: 20% В за 4,8 мин.

20 АВРР: 1800 фунтов/кв. дюйм

Скорость потока: 2,0 мл/мин.

Обнаружение: при 250 нм

Концентрация образца: 1 мг/мл

Объем впрыска: 1 мкл

25

Способ препаративной SFC

Sepiatec Prep SFC 100

Колонка: Daicel CHIRALPAK[®] IC, 5 мкм, 2,0 см x 25 см

Подвижная фаза: А: CO₂ В: MeOH изократический режим: 20% В за 14 мин.

30 Противодавление: 150 бар

Скорость потока: 60 мл/мин.

Насос GLS: 2 мл MeOH

Обнаружение: в УФ при 250 нм

Образец: в MeOH/DCM

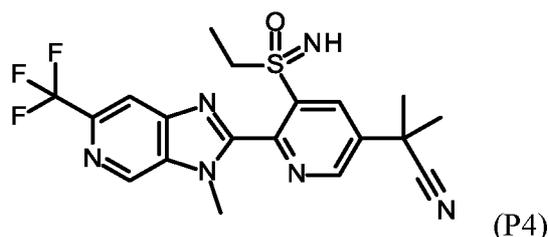
5

Результаты

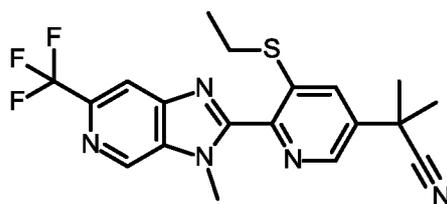
Энантиомер РЗ-А, который элюируется первым	Энантиомер РЗ-В, который элюируется вторым
Время удерживания (мин.) ~1,97	Время удерживания (мин.) ~3,19
Химическая чистота (% площади при 240 нм) 99	Химическая чистота (% площади при 240 нм) 99
Энантиомерный избыток (%) >99	Энантиомерный избыток (%) >99

ПРИМЕР Р4. Получение рацемического 2-[5-(этилсульфонимидоил)-6-[3-метил-6-(трифторметил)имидазо[4,5-с]пиридин-2-ил]-3-пиридил]-2-метилпропаннитрила (соединение Р4) и его отдельных энантиомеров (соединения Р4-А и Р4-В)

10



Стадия 1. Получение 2-[5-этилсульфанил-6-[3-метил-6-(трифторметил)имидазо[4,5-с]пиридин-2-ил]-3-пиридил]-2-метилпропаннитрила

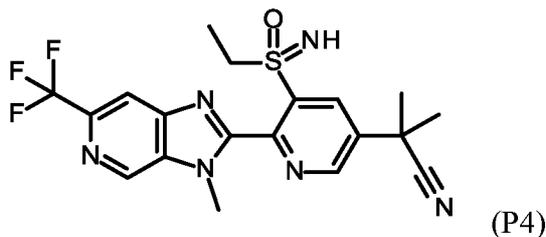


15 Данное соединение получали аналогично способам, описанным в WO2018/153778.

LCMS (способ 2): масса/заряд 406 [M+H]⁺; время удерживания: 1,02 мин.

Стадия 2. Получение рацемического 2-[5-(этилсульфонимидоил)-6-[3-метил-6-(трифторметил)имидазо[4,5-с]пиридин-2-ил]-3-пиридил]-2-метилпропаннитрила (соединение Р4)

20



2-[5-Этилсульфанил-6-[3-метил-6-(трифторметил)имидазо[4,5-с]пиридин-2-ил]-3-пиридил]-2-метилпропаннитрил (полученный, как описано выше) обрабатывали в условиях, аналогичных описанным на стадии 2 примера P12, и аналогично способам, описанным в WO2019/234158, с получением требуемого соединения P4. LCMS (способ 2): масса/заряд 437 [M+H]⁺; время удерживания: 0,83 мин.

Стадия 3. Получение соединений P4-A и P4-B, представляющих собой отдельные энантиомеры

10 Рацемическую смесь 2-[5-(этилсульфонимидоил)-6-[3-метил-6-(трифторметил)имидазо[4,5-с]пиридин-2-ил]-3-пиридил]-2-метилпропаннитрила (соединение P4) подвергали хиральному разделению посредством препаративной SFC с применением условий, указанных далее в данном документе.

15 Способ аналитической SFC

SFC: Waters Acquity UPC²/QDa

Детектор PDA Waters Acquity UPC²

Колонка: Daicel SFC CHIRALPAK[®] IG, 3 мкм, 0,46 см x 10 см, 40°C

Подвижная фаза: А: CO₂ В: MeOH изократический режим: 30% В за 4,8 мин.

20 АВРР: 1800 фунтов/кв. дюйм

Скорость потока: 2,0 мл/мин.

Обнаружение: при 265 нм

Концентрация образца: 1 мг/мл

Объем впрыска: 1 мкл

25

Способ препаративной SFC

Sepiatec Prep SFC 100

Колонка: Daicel CHIRALPAK[®] IG, 5 мкм, 2,0 см x 25 см

Подвижная фаза: А: CO₂ В: MeOH изократический режим: 30% В

Противодавление: 150 бар

Скорость потока: 60 мл/мин.

Насос GLS: -

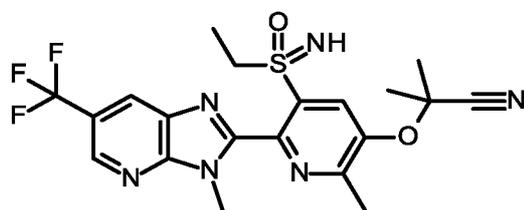
Обнаружение: в УФ при 265 нм

5 Образец: в DCM/MeOH

Результаты

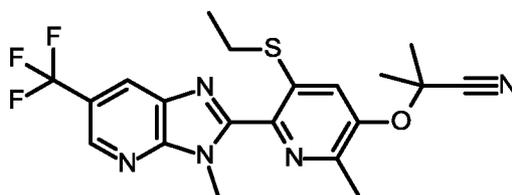
Энантиомер Р4-А, который элюируется первым	Энантиомер Р4-В, который элюируется вторым
Время удерживания (мин.) ~1,76	Время удерживания (мин.) ~2,82
Химическая чистота (% площади при 265 нм) >99	Химическая чистота (% площади при 265 нм) >99
Энантиомерный избыток (%) >99	Энантиомерный избыток (%) >98,6

10 **ПРИМЕР P5.** Получение рацемического 2-[[5-(этилсульфонимидоил)-2-метил-6-[3-метил-6-(трифторметил)имидазо[4,5-*b*]пиридин-2-ил]-3-пиридил]окси]-2-метилпропаннитрила (соединение P5) и его отдельных энантиомеров (соединения P5-А и P5-В)



(P5)

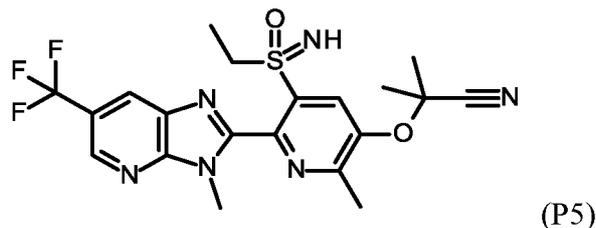
15 Стадия 1. Получение 2-[[5-этилсульфанил-2-метил-6-[3-метил-6-(трифторметил)имидазо[4,5-*b*]пиридин-2-ил]-3-пиридил]окси]-2-метилпропаннитрила



Данное соединение получали аналогично способам, описанным в WO2020/084075.

LCMS (способ 1): масса/заряд 436 [M+H]⁺; время удерживания: 1,16 мин.

20 Стадия 2. Получение рацемического 2-[[5-(этилсульфонимидоил)-2-метил-6-[3-метил-6-(трифторметил)имидазо[4,5-*b*]пиридин-2-ил]-3-пиридил]окси]-2-метилпропаннитрила (соединение P5)



2-[[5-Этилсульфанил-2-метил-6-[3-метил-6-(трифторметил)имидазо[4,5-b]пиридин-2-ил]-3-пиридил]окси]-2-метилпропаннитрил (полученный, как описано выше) обрабатывали в условиях, аналогичных описанным на стадии 2 примера P12, и

5 аналогично способам, описанным в WO2020/084075, с получением требуемого соединения P5. LCMS (способ 1): масса/заряд 467 [M+H]⁺; время удерживания: 0,97 мин.

10 Стадия 3. Получение соединений P5-A и P5-B, представляющих собой отдельные энантиомеры

Рацемическую смесь 2-[[5-(этилсульфонимидоил)-2-метил-6-[3-метил-6-(трифторметил)имидазо[4,5-b]пиридин-2-ил]-3-пиридил]окси]-2-метилпропаннитрила (соединение P5) подвергали хиральному разделению посредством препаративной SFC с применением условий, указанных далее в данном документе.

15

Способ аналитической SFC

SFC: Waters Acquity UPC²/QDa

Детектор PDA Waters Acquity UPC²

Колонка: Daicel SFC CHIRALPAK[®] IG, 3 мкм, 0,3 см x 10 см, 40°C

20 Подвижная фаза: А: CO₂ В: MeOH изократический режим: 15% В за 4,8 мин.

ABPR: 1800 фунтов/кв. дюйм

Скорость потока: 2,0 мл/мин.

Обнаружение: при 280 нм

Концентрация образца: 1 мг/мл

25 Объем впрыска: 1 мкл

Способ препаративной SFC

Sepiatec Prep SFC 100

Колонка: Daicel CHIRALPAK[®] IG, 5 мкм, 2,0 см x 25 см

Подвижная фаза: А: CO₂ В: MeOH изократический режим: 15% В за 14 мин.

Противодавление: 150 бар

Скорость потока: 60 мл/мин.

Насос GLS: 5 мл

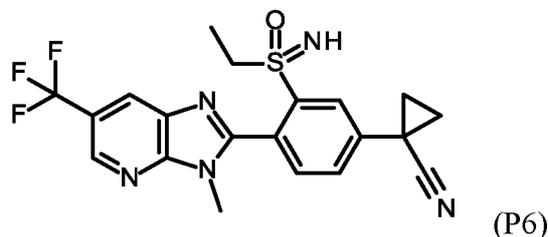
5 Обнаружение: в УФ при 280 нм

Образец: в MeOH/DCM

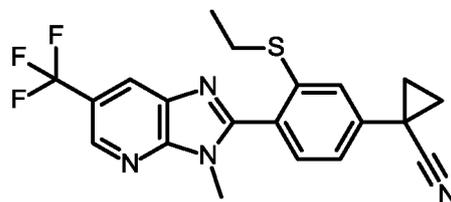
Результаты

Энантиомер Р5-А, который элюируется первым	Энантиомер Р5-В, который элюируется вторым
Время удерживания (мин.) ~1,92	Время удерживания (мин.) ~3,12
Химическая чистота (% площади при 280 нм) 99	Химическая чистота (% площади при 280 нм) 99
Энантиомерный избыток (%) >99	Энантиомерный избыток (%) >99

10 **ПРИМЕР Р6.** Получение рацемического 1-[3-(этилсульфонимидоил)-4-[3-метил-6-(трифторметил)имидазо[4,5-*b*]пиридин-2-ил]фенил]циклопропанкарбонитрила (соединение Р6) и его отдельных энантиомеров (соединения Р6-А и Р6-В)



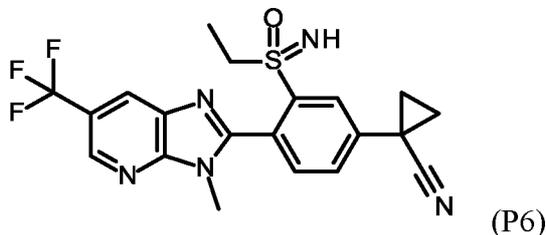
15 Стадия 1. Получение 1-[3-этилсульфанил-4-[3-метил-6-(трифторметил)имидазо[4,5-*b*]пиридин-2-ил]фенил]циклопропанкарбонитрила



Данное соединение получали аналогично способам, описанным в WO2019/234158.

LCMS (способ 6): масса/заряд 403 [M+H]⁺; время удерживания: 1,18 мин.

Стадия 2. Получение рацемического 1-[3-(этилсульфонимидоил)-4-[3-метил-6-(трифторметил)имидазо[4,5-b]пиридин-2-ил]фенил]циклопропанкарбонитрила (соединение Р6)



- 5 1-[3-Этилсульфанил-4-[3-метил-6-(трифторметил)имидазо[4,5-b]пиридин-2-ил]фенил]циклопропанкарбонитрил (полученный, как описано выше) обрабатывали в условиях, аналогичных описанным на стадии 2 примера P12, и аналогично способам, описанным в WO2019/234158, с получением требуемого соединения P6. LCMS (способ 2): масса/заряд 434 [M+H]⁺; время удерживания: 0,88 мин.

10

Стадия 3. Получение соединений P6-A и P6-B, представляющих собой отдельные энантиомеры

Рацемическую смесь 1-[3-(этилсульфонимидоил)-4-[3-метил-6-(трифторметил)имидазо[4,5-b]пиридин-2-ил]фенил]циклопропанкарбонитрила

- 15 (соединение P6) подвергали хиральному разделению посредством препаративной SFC с применением условий, указанных далее в данном документе.

Способ аналитической SFC

SFC: Waters Acquity UPC²/QDa

- 20 Детектор PDA Waters Acquity UPC²

Колонка: Daicel SFC CHIRALPAK[®] IG, 3 мкм, 0,46 см x 10 см, 40°C

Подвижная фаза: А: CO₂ В: iPrOH изократический режим: 35% В за 4,8 мин.

ABPR: 1800 фунтов/кв. дюйм

Скорость потока: 2,0 мл/мин.

- 25 Обнаружение: при 290 нм

Концентрация образца: 1 мг/мл

Объем впрыска: 1 мл

Способ препаративной SFC

Sepiatec Prep SFC 100

Колонка: Daicel CHIRALPAK® IG, 5 мкм, 2,0 см x 25 см

Подвижная фаза: А: CO₂ В: iPrOH изократический режим: 35% В

Противодавление: 150 бар

5 Скорость потока: 60 мл/мин.

Насос GLS: -

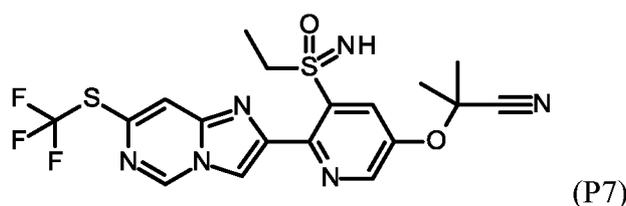
Обнаружение: в УФ при 290 нм

Образец: в DCM/ACN

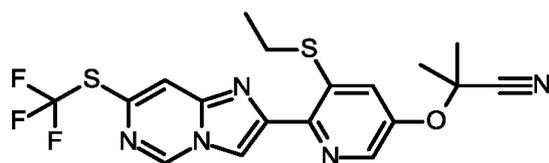
10 Результаты

Энантиомер Р6-А, который элюируется первым	Энантиомер Р6-В, который элюируется вторым
Время удерживания (мин.) ~2,34	Время удерживания (мин.) ~3,99
Химическая чистота (% площади при 290 нм) >99	Химическая чистота (% площади при 290 нм) >99
Энантиомерный избыток (%) >99	Энантиомерный избыток (%) >99

ПРИМЕР Р7. Получение рацемического 2-[[5-(этилсульфонимидоил)-6-[7-(трифторметилсульфанил)имидазо[1,2-с]пиримидин-2-ил]-3-пиридил]окси]-2-метилпропаннитрила (соединение Р7) и его отдельных энантиомеров (соединения Р7-А и Р7-В)



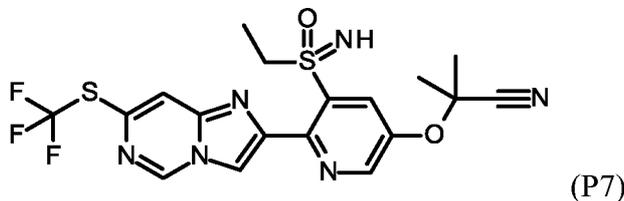
Стадия 1. Получение 2-[[5-этилсульфанил-6-[7-(трифторметилсульфанил)имидазо[1,2-с]пиримидин-2-ил]-3-пиридил]окси]-2-метилпропаннитрила



20 Данное соединение получали аналогично способам, описанным в WO2020/084075.

¹H ЯМР (400 МГц, хлороформ-d) δ ppm 1,44 (m, 3H) 1,82 (s, 6H) 3,05 (m, 2H) 7,66 (d, J=2,20Hz, 1H) 8,02 (s, 1H) 8,34 (d, J=2,20Hz, 1H) 8,39 (s, 1H) 9,10 (s, 1H).

Стадия 2. Получение рацемического 2-[[5-(этилсульфонимидоил)-6-[7-(трифторметилсульфанил)имидазо[1,2-с]пиримидин-2-ил]-3-пиридил]окси]-2-метилпропаннитрила (соединение P7)



- 5 2-[[5-Этилсульфанил-6-[7-(трифторметилсульфанил)имидазо[1,2-с]пиримидин-2-ил]-3-пиридил]окси]-2-метилпропаннитрил (полученный, как описано выше) обрабатывали в условиях, аналогичных описанным на стадии 2 примера P12, и аналогично способам, описанным в WO2020/084075, с получением требуемого соединения P7. LCMS (способ 1): масса/заряд 471 [M+H]⁺; время удерживания: 0,89 мин.

10

Стадия 3. Получение соединений P7-A и P7-B, представляющих собой отдельные энантиомеры

Рацемическую смесь 2-[[5-(этилсульфонимидоил)-6-[7-(трифторметилсульфанил)имидазо[1,2-с]пиримидин-2-ил]-3-пиридил]окси]-2-

- 15 метилпропаннитрила (соединение P7) подвергали хиральному разделению посредством препаративной SFC с применением условий, указанных далее в данном документе.

Способ аналитической SFC

SFC: Waters Acquity UPC²/QDa

- 20 Детектор PDA Waters Acquity UPC²

Колонка: Daicel SFC CHIRALPAK[®] IC, 3 мкм, 0,3 см x 10 см, 40°C

Подвижная фаза: А: CO₂ В: MeOH изократический режим: 30% В за 4,8 мин.

ABPR: 1800 фунтов/кв. дюйм

Скорость потока: 2,0 мл/мин.

- 25 Обнаружение: при 250 нм

Концентрация образца: 1 мг/мл

Объем впрыска: 1 мкл

Способ препаративной SFC

- 30 Sepiatec Prep SFC 100

Колонка: Daicel CHIRALPAK® IC, 5 мкм, 2,0 см x 25 см

Подвижная фаза: А: CO₂ В: MeOH изократический режим: 30% В за 14 мин.

Противодавление: 150 бар

Скорость потока: 60 мл/мин.

5 Насос GLS: 2 мл MeOH

Обнаружение: в УФ при 250 нм

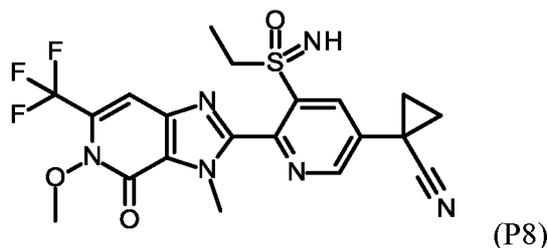
Образец: в MeOH/DCM

Результаты

Энантиомер Р7-А, который элюируется первым	Энантиомер Р7-В, который элюируется вторым
Время удерживания (мин.) ~1,28	Время удерживания (мин.) ~3,63
Химическая чистота (% площади при 250 нм) 99	Химическая чистота (% площади при 250 нм) 99
Энантиомерный избыток (%) >99	Энантиомерный избыток (%) >99

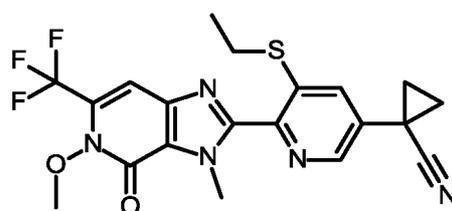
10

ПРИМЕР P8. Получение рацемического 1-[5-(этилсульфонимидоил)-6-[5-метокси-3-метил-4-оксо-6-(трифторметил)имидазо[4,5-с]пиридин-2-ил]-3-пиридил]циклопропанкарбонитрила (соединение P8) и его отдельных энантиомеров (соединения P8-А и P8-В)



15

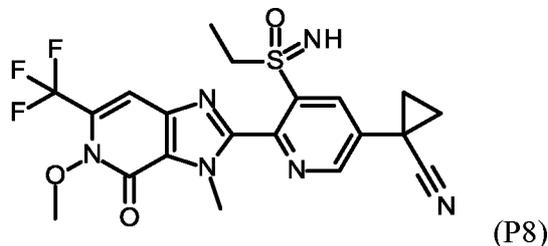
Стадия 1. Получение 1-[5-этилсульфанил-6-[5-метокси-3-метил-4-оксо-6-(трифторметил)имидазо[4,5-с]пиридин-2-ил]-3-пиридил]циклопропанкарбонитрила



Данное соединение получали аналогично способам, описанным в WO2019/234158.

20 LCMS (способ 5): масса/заряд 450 [M+H]⁺; время удерживания: 1,03 мин.

Стадия 2. Получение рацемического 1-[5-(этилсульфонимидоил)-6-[5-метокси-3-метил-4-оксо-6-(трифторметил)имидазо[4,5-с]пиридин-2-ил]-3-пиридил]циклопропанкарбонитрила (соединение P8)



- 5 1-[5-Этилсульфанил-6-[5-метокси-3-метил-4-оксо-6-(трифторметил)имидазо[4,5-
с]пиридин-2-ил]-3-пиридил]циклопропанкарбонитрил (полученный, как описано выше)
обрабатывали в условиях, аналогичных описанным на стадии 2 примера P12, и
аналогично способам, описанным в WO2019/234158, с получением требуемого
соединения P8. LCMS (способ 5): масса/заряд 481 [M+H]⁺; время удерживания:
10 0,85 мин.

Стадия 3. Получение соединений P8-A и P8-B, представляющих собой отдельные энантиомеры

- 15 Рацемическую смесь 1-[5-(этилсульфонимидоил)-6-[5-метокси-3-метил-4-оксо-6-
(трифторметил)имидазо[4,5-с]пиридин-2-ил]-3-пиридил]циклопропанкарбонитрила
(соединение P8) подвергали хиральному разделению посредством препаративной SFC с
применением условий, указанных далее в данном документе.

Способ аналитической SFC

- 20 SFC: Waters Acquity UPC²/QDa
Детектор PDA Waters Acquity UPC²
Колонка: Daicel SFC CHIRALPAK[®] IA, 3 мкм, 0,46 см x 10 см, 40°C
Подвижная фаза: А: CO₂ В: iPrOH изократический режим: 25% В за 4,8 мин.
ABPR: 1800 фунтов/кв. дюйм
25 Скорость потока: 2,0 мл/мин.
Обнаружение: при 220 нм
Концентрация образца: 1 мг/мл
Объем впрыска: 1 мл

Способ препаративной SFC

Sepiatec Prep SFC 100

Колонка: Daicel CHIRALPAK® IA, 5 мкм, 2,0 см x 25 см

Подвижная фаза: А: CO₂ В: iPrOH изократический режим: 25% В

5 Противодавление: 150 бар

Скорость потока: 60 мл/мин.

Насос GLS: -

Обнаружение: в УФ при 220 нм

Образец: в DCM/ACN

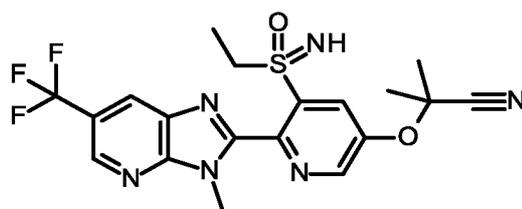
10

Результаты

Энантиомер Р8-А, который элюируется первым	Энантиомер Р8-В, который элюируется вторым
Время удерживания (мин.) ~1,73	Время удерживания (мин.) ~3,15
Химическая чистота (% площади при 220 нм) 98,8	Химическая чистота (% площади при 220 нм) >99
Энантиомерный избыток (%) >99	Энантиомерный избыток (%) >99

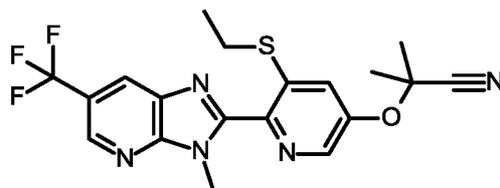
ПРИМЕР Р9. Получение рацемического 2-[[5-(этилсульфонимидоил)-6-[3-метил-6-(трифторметил)имидазо[4,5-*b*]пиридин-2-ил]-3-пиридил]окси]-2-метилпропаннитрила (соединение Р9) и его отдельных энантиомеров (соединения Р9-А и Р9-В)

15



(P9)

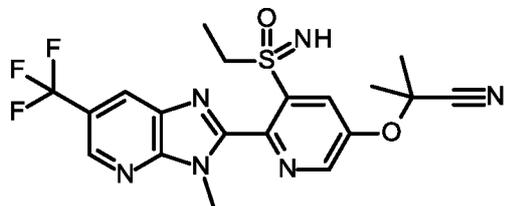
Стадия 1. Получение 2-[[5-этилсульфанил-6-[3-метил-6-(трифторметил)имидазо[4,5-*b*]пиридин-2-ил]-3-пиридил]окси]-2-метилпропаннитрила



20 Данное соединение получали аналогично способам, описанным в WO2020/084075.

LCMS (способ 1): масса/заряд 422 [M+H]⁺; время удерживания: 1,11 мин.

Стадия 2. Получение рацемического 2-[[5-(этилсульфонимидоил)-6-[3-метил-6-(трифторметил)имидазо[4,5-b]пиридин-2-ил]-3-пиридил]окси]-2-метилпропаннитрила (соединение P9)



(P9)

- 5 2-[[5-Этилсульфанил-6-[3-метил-6-(трифторметил)имидазо[4,5-b]пиридин-2-ил]-3-пиридил]окси]-2-метилпропаннитрил (полученный, как описано выше) обрабатывали в условиях, аналогичных описанным на стадии 2 примера P12, и аналогично способам, описанным в WO2020/084075, с получением требуемого соединения P9. LCMS (способ 1): масса/заряд 453 [M+H]⁺; время удерживания: 0,93 мин.

10

Стадия 3. Получение соединений P9-A и P9-B, представляющих собой отдельные энантиомеры

- Рацемическую смесь 2-[[5-(этилсульфонимидоил)-6-[3-метил-6-(трифторметил)имидазо[4,5-b]пиридин-2-ил]-3-пиридил]окси]-2-метилпропаннитрила (соединение P9) подвергали хиральному разделению посредством препаративной SFC с применением условий, указанных далее в данном документе.

Способ аналитической SFC

SFC: Waters Acquity UPC²/QDa

- 20 Детектор PDA Waters Acquity UPC²

Колонка: Daicel SFC CHIRALPAK[®] IA, 3 мкм, 0,3 см x 10 см, 40°C

Подвижная фаза: А: CO₂ В: EtOH изократический режим: 10% В за 4,8 мин.

ABPR: 1800 фунтов/кв. дюйм

Скорость потока: 2,0 мл/мин.

- 25 Обнаружение: при 290 нм

Концентрация образца: 1 мг/мл

Объем впрыска: 1 мкл

Способ препаративной SFC

Sepiatec Prep SFC 100

Колонка: Daicel CHIRALPAK® IG, 5 мкм, 2,0 см x 25 см

Подвижная фаза: А: CO₂ В: EtOH изократический режим: 25% В за 14 мин.

Противодавление: 150 бар

5 Скорость потока: 60 мл/мин.

Насос GLS: 3 мл

Обнаружение: в УФ при 290 нм

Образец: в MeOH/ACN

10 Результаты

Энантиомер Р9-А, который элюируется первым	Энантиомер Р9-В, который элюируется вторым
Время удерживания (мин.) ~1,49	Время удерживания (мин.) ~2,01
Химическая чистота (% площади при 290 нм) 99	Химическая чистота (% площади при 290 нм) 99
Энантиомерный избыток (%) >99	Энантиомерный избыток (%) >99

Образец соединения Р9-В, представляющего собой энантиомер, который элюируется вторым, (кристаллы из этанола, полученные согласно стадии 3 примера Р9, с химической чистотой 99% ($\lambda = 290$ нм) и энантиомерным избытком >99%), подвергли анализу с помощью рентгеновской дифракции монокристаллов. Данные интенсивности для монокристалла собирали на Rigaku Oxford Diffraction Supernova X-ray Generator с применением излучения Cu-K α при длине волны 1,54184 Å со сбором при 100К с разрешением 0,81 Å.

15 Набор данных оптимизировали и сводили с применением программного обеспечения для сбора и обработки данных CrysAlisPro, разрешение структур выполняли с применением SIR92 (Altomare A, Cascarano G, Giacovazzo C, Guagliardi A, Burla MC, Polidori G and Camalli M, J. Appl. Cryst. 27: 435 (1994)) и уточнение структуры осуществляли с применением пакета программного обеспечения CRYSTALS (Betteridge PW, Carruthers JR, Cooper RI, Prout K and Watkin DJ, J. Appl. Cryst. 36:1487 (2003)).

25 Соединение Р9-В, представляющее собой отдельный энантиомер, кристаллизовалось в виде моноклинной пространственной группы C2. Параметры элементарной ячейки для анализа монокристаллов показаны в таблице 1.

Таблица 1. Структурные параметры кристалла[#]

Химическая формула	C ₁₉ H ₁₉ F ₃ N ₆ O ₂ S
Кристаллическая система	Моноклинная
Пространственная группа	C2
Показатели длины ячейки (Å)	a = 27,2791, b = 11,79482, c = 12,4992
Значения углов ячейки (°)	α = 90, β = 93,0334, γ = 90
Объем элементарной ячейки (Å ³)	4016,00
Z	8

[#] В таблице 1: a, b, c = длина ребер элементарной ячейки; α, β, γ = значения углов элементарной ячейки;

5 и Z = число молекул на ячейку.

Кристаллическая структура соединения P9-B согласно рентгеноструктурному анализу изображена на фигуре 1. Стереохимия была однозначно определена, стереогенный атом серы (обозначенный S1 на фигуре 1) находится в S-конфигурации (указано обозначением (S) на фигуре 1). По техническим причинам схема нумерации, используемая в структуре на фигуре 1, не соответствует систематической номенклатуре.

15 Поэтому с помощью рентгеноструктурного анализа было доказано, что энантиомер P9-B, который элюируется вторым, представлял собой (S)-2-[[5-(этилсульфонимидоил)-6-[3-метил-6-(трифторметил)имидазо[4,5-b]пиридин-2-ил]-3-пиридил]окси]-2-метилпропаннитрил, соответствующий соединению (S)-P9 (таблица Y), полученному посредством энантиоселективного синтеза (пример E2 ниже).

$[\alpha]_D^{20} = +13,7^\circ$ (MeOH, C = 0,88).

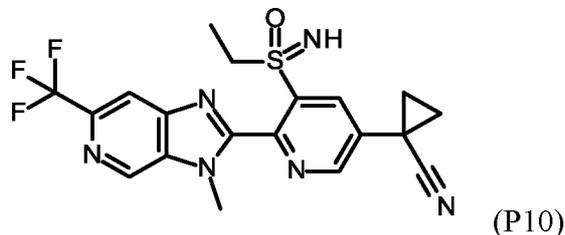
20

Аналогично с помощью рентгеноструктурного анализа было доказано, что энантиомер P9-A, который элюируется первым, представлял собой (R)-2-[[5-(этилсульфонимидоил)-6-[3-метил-6-(трифторметил)имидазо[4,5-b]пиридин-2-ил]-3-пиридил]окси]-2-метилпропаннитрил, соответствующий соединению (R)-P9 (таблица Y), полученному посредством энантиоселективного синтеза (пример E1 ниже).

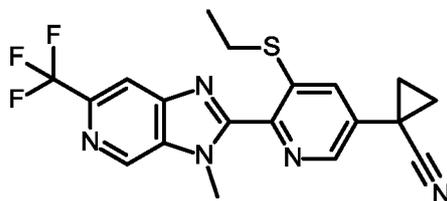
25

$[\alpha]_D^{20} = -13,2^\circ$ (MeOH, C = 0,87).

ПРИМЕР P10. Получение рацемического 1-[5-(этилсульфонимидоил)-6-[3-метил-6-(трифторметил)имидазо[4,5-с]пиридин-2-ил]-3-пиридил]циклопропанкарбонитрила (соединение P10) и его отдельных энантиомеров (соединения P10-A и P10-B)



5 Стадия 1. Получение 1-[5-этилсульфанил-6-[3-метил-6-(трифторметил)имидазо[4,5-с]пиридин-2-ил]-3-пиридил]циклопропанкарбонитрила

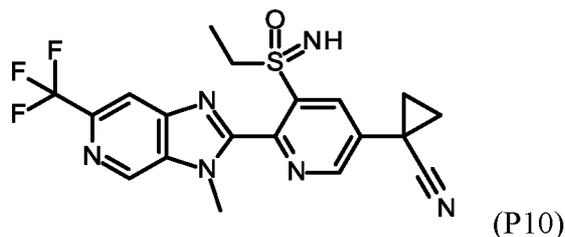


Данное соединение получали аналогично способам, описанным в WO2019/234158.

LCMS (способ 1): масса/заряд 404 [M+H]⁺; время удерживания: 0,98 мин.

10

Стадия 2. Получение рацемического 1-[5-(этилсульфонимидоил)-6-[3-метил-6-(трифторметил)имидазо[4,5-с]пиридин-2-ил]-3-пиридил]циклопропанкарбонитрила (соединение P10)



15 1-[5-Этилсульфанил-6-[3-метил-6-(трифторметил)имидазо[4,5-с]пиридин-2-ил]-3-пиридил]циклопропанкарбонитрил (полученный, как описано выше) обрабатывали в условиях, аналогичных описанным на стадии 2 примера P12, и аналогично способам, описанным в WO2019/234158, с получением требуемого соединения P10. LCMS (способ 1): масса/заряд 435 [M+H]⁺; время удерживания: 0,82 мин.

20

Стадия 3. Получение соединений P10-A и P10-B, представляющих собой отдельные энантиомеры

Рацемическую смесь 1-[5-(этилсульфонимидоил)-6-[3-метил-6-(трифторметил)имидазо[4,5-с]пиридин-2-ил]-3-пиридил]циклопропанкарбонитрила (соединение P10) подвергали хиральному разделению посредством препаративной SFC с применением условий, указанных далее в данном документе.

5

Способ аналитической SFC

SFC: Waters Acquity UPC²/QDa

Детектор PDA Waters Acquity UPC²

Колонка: Daicel SFC CHIRALPAK[®] IG, 3 мкм, 0,46 см x 10 см, 40°C

10 Подвижная фаза: А: CO₂ В: MeOH изократический режим: 40% В за 4,8 мин.

ABPR: 1800 фунтов/кв. дюйм

Скорость потока: 2,0 мл/мин.

Обнаружение: при 250 нм

Концентрация образца: 1 мг/мл

15 Объем впрыска: 1 мкл

Способ препаративной SFC

Seriatec Prep SFC 100

Колонка: Daicel CHIRALPAK[®] IG, 5 мкм, 2,0 см x 25 см

20 Подвижная фаза: А: CO₂ В: MeOH изократический режим: 40% В

Противодавление: 150 бар

Скорость потока: 60 мл/мин.

Насос GLS: -

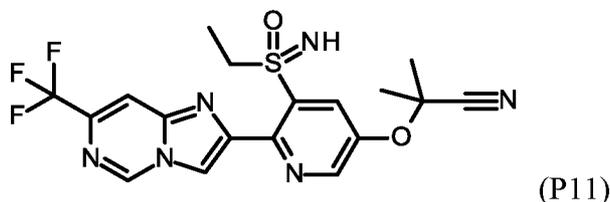
Обнаружение: в УФ при 270 нм

25 Образец: в MeOH/DCM/ACN

Результаты

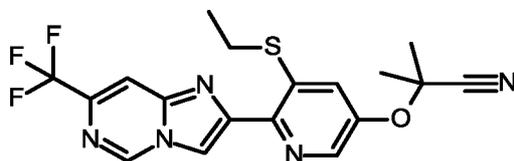
Энантиомер P10-А, который элюируется первым	Энантиомер P10-В, который элюируется вторым
Время удерживания (мин.) ~1,68	Время удерживания (мин.) ~2,99
Химическая чистота (% площади при 270 нм) >99	Химическая чистота (% площади при 270 нм) >99
Энантиомерный избыток (%) >99	Энантиомерный избыток (%) >99

ПРИМЕР P11. Получение рацемического 2-[[5-(этилсульфонимидоил)-6-[7-(трифторметил)имидазо[1,2-с]пиримидин-2-ил]-3-пиридил]окси]-2-метилпропаннитрила (соединение P11) и его отдельных энантиомеров (соединения P11-A и P11-B)



5

Стадия 1. Получение 2-[[5-этилсульфанил-6-[7-(трифторметил)имидазо[1,2-с]пиримидин-2-ил]-3-пиридил]окси]-2-метилпропаннитрила



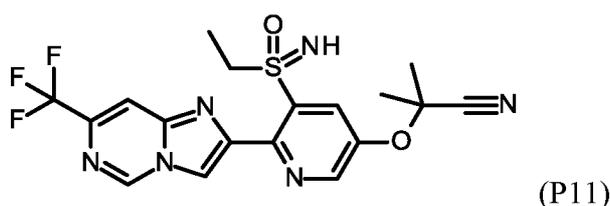
Данное соединение получали аналогично способам, описанным в WO2020/084075.

^1H ЯМР (400 МГц, хлороформ-d) δ ppm 1,44 (t, $J=7,34\text{Hz}$, 3H) 1,81 (s, 6H) 3,04 (q, $J=7,34\text{Hz}$, 2H) 7,67 (s, 1H) 8,05 (s, 1H) 8,34 (s, 1H) 8,45 (s, 1H) 9,18 (s, 1H).

10

Стадия 2. Получение рацемического 2-[[5-(этилсульфонимидоил)-6-[7-(трифторметил)имидазо[1,2-с]пиримидин-2-ил]-3-пиридил]окси]-2-метилпропаннитрила (соединение P11)

15



2-[[5-Этилсульфанил-6-[7-(трифторметил)имидазо[1,2-с]пиримидин-2-ил]-3-пиридил]окси]-2-метилпропаннитрил (полученный, как описано выше) обрабатывали в условиях, аналогичных описанным на стадии 2 примера P12, и аналогично способам, описанным в WO2020/084075, с получением требуемого соединения P11. LCMS (способ 1): масса/заряд 439 $[\text{M}+\text{H}]^+$; время удерживания: 0,84 мин.

20

Стадия 3. Получение соединений P11-A и P11-B, представляющих собой отдельные энантиомеры

Рацемическую смесь 2-[[5-(этилсульфонимидоил)-6-[7-(трифторметил)имидазо[1,2-с]пиримидин-2-ил]-3-пиридил]окси]-2-метилпропаннитрила (соединение P11) подвергали хиральному разделению посредством препаративной SFC с применением условий, указанных далее в данном документе.

5

Способ аналитической SFC

SFC: Waters Acquity UPC²/QDa

Детектор PDA Waters Acquity UPC²

Колонка: Daicel SFC CHIRALPAK[®] IC, 3 мкм, 0,3 см x 10 см, 40°C

10 Подвижная фаза: А: CO₂ В: MeOH изократический режим: 30% В за 4,8 мин.

ABPR: 1800 фунтов/кв. дюйм

Скорость потока: 2,0 мл/мин.

Обнаружение: при 240 нм

Концентрация образца: 1 мг/мл

15 Объем впрыска: 1 мкл

Способ препаративной SFC

Seriatec Prep SFC 100

Колонка: Daicel CHIRALPAK[®] IC, 5 мкм, 2,0 см x 25 см

20 Подвижная фаза: А: CO₂ В: MeOH изократический режим: 30% В за 14 мин.

Противодавление: 150 бар

Скорость потока: 60 мл/мин.

Насос GLS: 2 мл MeOH

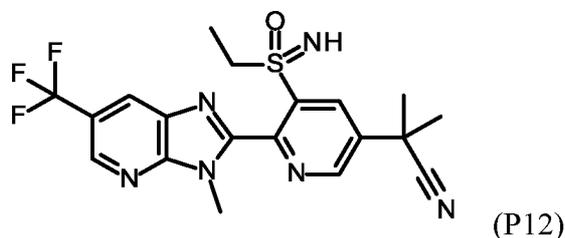
Обнаружение: в УФ при 250 нм

25 Образец: в MeOH/DCM

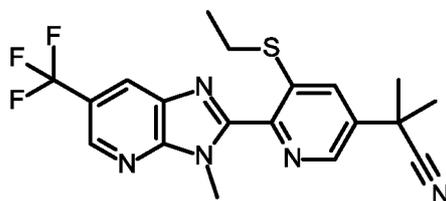
Результаты

Энантиомер P11-А, который элюируется первым	Энантиомер P11-В, который элюируется вторым
Время удерживания (мин.) ~1,08	Время удерживания (мин.) ~2,78
Химическая чистота (% площади при 240 нм) 99	Химическая чистота (% площади при 240 нм) 99
Энантиомерный избыток (%) >99	Энантиомерный избыток (%) >99

ПРИМЕР P12. Получение рацемического 2-[5-(этилсульфонимидоил)-6-[3-метил-6-(трифторметил)имидазо[4,5-b]пиридин-2-ил]-3-пиридил]-2-метилпропаннитрила (соединение P12) и его отдельных энантиомеров (соединения P12-A и P12-B)



5 Стадия 1. Получение 2-[5-этилсульфанил-6-[3-метил-6-(трифторметил)имидазо[4,5-b]пиридин-2-ил]-3-пиридил]-2-метилпропаннитрила

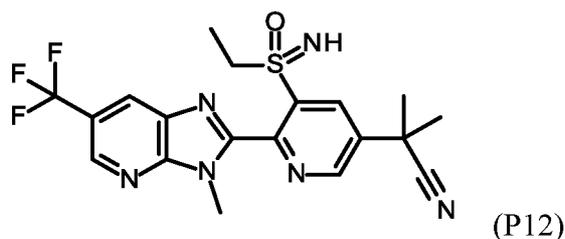


Данное соединение получали аналогично способам, описанным в WO2018/153778.

LCMS (способ 2): масса/заряд 406 [M+H]⁺; время удерживания: 1,09 мин.

10

Стадия 2. Получение рацемического 2-[5-(этилсульфонимидоил)-6-[3-метил-6-(трифторметил)имидазо[4,5-b]пиридин-2-ил]-3-пиридил]-2-метилпропаннитрила (соединение P12)



15 Раствор 2-[5-этилсульфанил-6-[3-метил-6-(трифторметил)имидазо[4,5-b]пиридин-2-ил]-3-пиридил]-2-метилпропаннитрила (полученного, как описано выше) (300 мг, 0,74 ммоль) в метаноле (5 мл) добавляли при комнатной температуре в раствор диацетоксидбензола (596 мг, 1,85 ммоль) и карбамата аммония (116 мг, 1,48 ммоль) в метаноле (4 мл). После перемешивания в течение 90 минут при комнатной температуре

20 реакцию смесь выпаривали и остаток разбавляли дихлорметаном. Органическую фазу дважды промывали водой, высушивали над безводным сульфатом натрия, фильтровали и концентрировали под вакуумом. Неочищенный продукт очищали

посредством флеш-хроматографии на силикагеле (этилацетат в циклогексане) с получением требуемого соединения P12.

LCMS (способ 2): масса/заряд 437 [M+H]⁺; время удерживания: 0,91 мин.

5 Стадия 3. Получение соединений P12-А и P12-В, представляющих собой отдельные энантиомеры

10 Рацемическую смесь 2-[5-(этилсульфонимидоил)-6-[3-метил-6-(трифторметил)имидазо[4,5-*b*]пиридин-2-ил]-3-пиридил]-2-метилпропаннитрила (соединение P12) подвергали хиральному разделению посредством препаративной SFC с применением условий, указанных далее в данном документе.

Способ аналитической SFC

SFC: Waters Acquity UPC²/QDa

Детектор PDA Waters Acquity UPC²

15 Колонка: Daicel SFC CHIRALPAK[®] IG, 3 мкм, 0,46 см x 10 см, 40°C

Подвижная фаза: А: CO₂ В: EtOH изократический режим: 20% В за 4,8 мин.

ABPR: 1800 фунтов/кв. дюйм

Скорость потока: 2,0 мл/мин.

Обнаружение: при 220 нм

20 Концентрация образца: 1 мг/мл

Объем впрыска: 1 мл

Способ препаративной SFC

Seriatec Prep SFC 100

25 Колонка: Daicel CHIRALPAK[®] IG, 5 мкм, 2,0 см x 25 см

Подвижная фаза: А: CO₂ В: EtOH изократический режим: 20% В

Противодавление: 150 бар

Скорость потока: 60 мл/мин.

Насос GLS: -

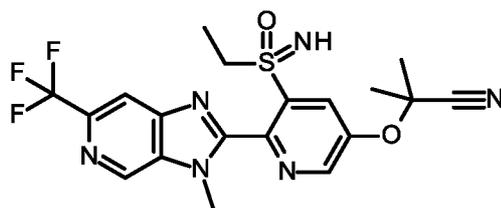
30 Обнаружение: в УФ при 220 нм

Образец: в DCM/ACN

Результаты

Энантиомер P12-A, который элюируется первым	Энантиомер P12-B, который элюируется вторым
Время удерживания (мин.) ~2,42	Время удерживания (мин.) ~3,17
Химическая чистота (% площади при 220 нм) >99	Химическая чистота (% площади при 220 нм) >99
Энантиомерная чистота (%) >99	Энантиомерная чистота (%) >99

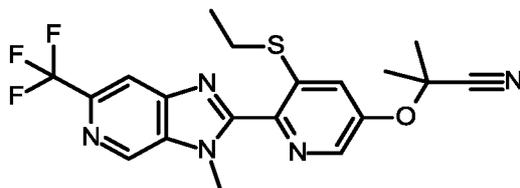
ПРИМЕР P13. Получение рацемического 2-[[5-(этилсульфонимидоил)-6-[3-метил-6-(трифторметил)имидазо[4,5-с]пиридин-2-ил]-3-пиридил]окси]-2-метилпропаннитрила (соединение P13) и его отдельных энантиомеров (соединения P13-A и P13-B)



(P13)

5

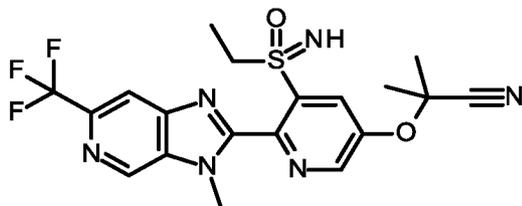
Стадия 1. Получение 2-[[5-этилсульфанил-6-[3-метил-6-(трифторметил)имидазо[4,5-с]пиридин-2-ил]-3-пиридил]окси]-2-метилпропаннитрила



Данное соединение получали аналогично способам, описанным в WO2020/084075.

10 LCMS (способ 1): масса/заряд 422 [M+H]⁺; время удерживания: 1,02 мин.

Стадия 2. Получение рацемического 2-[[5-(этилсульфонимидоил)-6-[3-метил-6-(трифторметил)имидазо[4,5-с]пиридин-2-ил]-3-пиридил]окси]-2-метилпропаннитрила (соединение P13)



(P13)

15

2-[[5-Этилсульфанил-6-[3-метил-6-(трифторметил)имидазо[4,5-с]пиридин-2-ил]-3-пиридил]окси]-2-метилпропаннитрил (полученный, как описано выше) обрабатывали в условиях, аналогичных описанным в стадии 2 примера P12, и аналогично способам,

описанным в WO2020/084075, с получением требуемого соединения P13. LCMS (способ 1): масса/заряд 453 [M+H]⁺; время удерживания: 0,86 мин.

Стадия 3. Получение соединений P13-A и P13-B, представляющих собой отдельные

5 энантиомеры

Рацемическую смесь 2-[[5-(этилсульфонимидоил)-6-[3-метил-6-(трифторметил)имидазо[4,5-с]пиридин-2-ил]-3-пиридил]окси]-2-метилпропаннитрила (соединение P13) подвергали хиральному разделению посредством препаративной SFC с применением условий, указанных далее в данном документе.

10

Способ аналитической SFC

SFC: Waters Acquity UPC²/QDa

Детектор PDA Waters Acquity UPC²

Колонка: Daicel SFC CHIRALPAK[®] IG, 3 мкм, 0,3 см x 10 см, 40°C

15 Подвижная фаза: А: CO₂ В: MeOH изократический режим: 30% В за 4,8 мин.

ABPR: 1800 фунтов/кв. дюйм

Скорость потока: 2,0 мл/мин.

Обнаружение: при 270 нм

Концентрация образца: 1 мг/мл

20 Объем впрыска: 1 мкл

Способ препаративной SFC

Seriatec Prep SFC 100

Колонка: Daicel CHIRALPAK[®] IG, 5 мкм, 2,0 см x 25 см

25 Подвижная фаза: А: CO₂ В: MeOH изократический режим: 30% В за 14 мин.

Противодавление: 150 бар

Скорость потока: 60 мл/мин.

Насос GLS: 3 мл

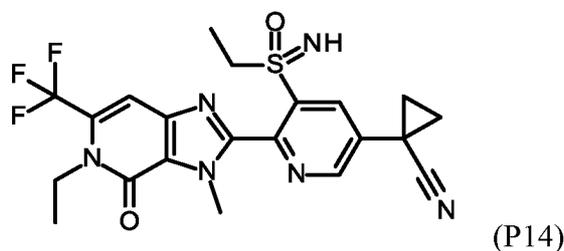
Обнаружение: в УФ при 270 нм

30 Образец: в EtOH

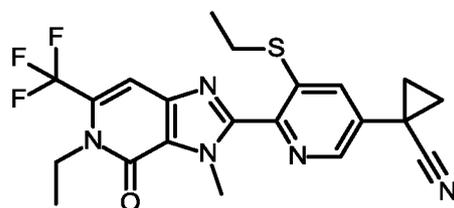
Результаты

Энантиомер Р13-А, который элюируется первым	Энантиомер Р13-В, который элюируется вторым
Время удерживания (мин.) ~1,70	Время удерживания (мин.) ~3,89
Химическая чистота (% площади при 270 нм) 99	Химическая чистота (% площади при 270 нм) 99
Энантиомерный избыток (%) >99	Энантиомерный избыток (%) >99

ПРИМЕР Р14. Получение рацемического 1-[6-[5-этил-3-метил-4-оксо-6-(трифторметил)имидазо[4,5-с]пиридин-2-ил]-5-(этилсульфонимидоил)-3-пиридил]циклопропанкарбонитрила (соединение Р14) и его отдельных энантиомеров (соединения Р14-А и Р14-В)

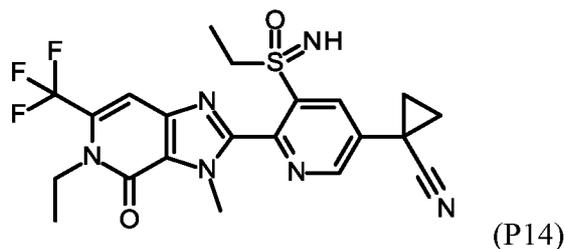


Стадия 1. Получение 1-[6-[5-этил-3-метил-4-оксо-6-(трифторметил)имидазо[4,5-с]пиридин-2-ил]-5-этилсульфанил-3-пиридил]циклопропанкарбонитрила



10 Данное соединение получали аналогично способам, описанным в WO2019/234158.
LCMS (способ 5): масса/заряд 448 [M+H]⁺; время удерживания: 1,13 мин.

15 Стадия 2. Получение рацемического 1-[6-[5-этил-3-метил-4-оксо-6-(трифторметил)имидазо[4,5-с]пиридин-2-ил]-5-(этилсульфонимидоил)-3-пиридил]циклопропанкарбонитрила (соединение Р14)



1-[6-[5-Этил-3-метил-4-оксо-6-(трифторметил)имидазо[4,5-с]пиридин-2-ил]-5-этилсульфанил-3-пиридил]циклопропанкарбонитрил (полученный, как описано выше) обрабатывали в условиях, аналогичных описанным на стадии 2 примера P12, и аналогично способам, описанным в WO2019/234158, с получением требуемого соединения P14. LCMS (способ 5): масса/заряд 479 [M+H]⁺; время удерживания: 0,92 мин.

Стадия 3. Получение соединений P14-A и P14-B, представляющих собой отдельные энантиомеры

10 Рацемическую смесь 1-[6-[5-этил-3-метил-4-оксо-6-(трифторметил)имидазо[4,5-с]пиридин-2-ил]-5-(этилсульфонимидоил)-3-пиридил]циклопропанкарбонитрила (соединение P14) подвергали хиральному разделению посредством препаративной SFC с применением условий, указанных далее в данном документе.

15 Способ аналитической SFC

SFC: Waters Acquity UPC²/QDa

Детектор PDA Waters Acquity UPC²

Колонка: Daicel SFC CHIRALPAK[®] IG, 3 мкм, 0,46 см x 10 см, 40°C

Подвижная фаза: А: CO₂ В: iPrOH изократический режим: 35% В за 4,8 мин.

20 АВРР: 1800 фунтов/кв. дюйм

Скорость потока: 2,0 мл/мин.

Обнаружение: при 220 нм

Концентрация образца: 1 мг/мл

Объем впрыска: 1 мл

25

Способ препаративной SFC

Sepiatec Prep SFC 100

Колонка: Daicel CHIRALPAK[®] IG, 5 мкм, 2,0 см x 25 см

Подвижная фаза: А: CO₂ В: iPrOH изократический режим: 35% В

30 Противодавление: 150 бар

Скорость потока: 60 мл/мин.

Насос GLS: -

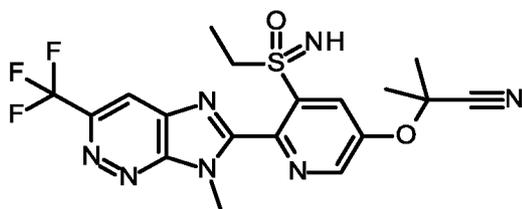
Обнаружение: в УФ при 220 нм

Образец: в DCM/ACN

Результаты

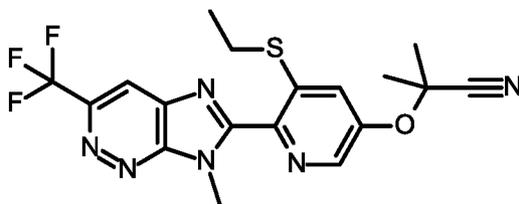
Энантиомер P14-A, который элюируется первым	Энантиомер P14-B, который элюируется вторым
Время удерживания (мин.) ~2,92	Время удерживания (мин.) ~4,06
Химическая чистота (% площади при 220 нм) >99	Химическая чистота (% площади при 220 нм) >99
Энантиомерный избыток (%) >99	Энантиомерный избыток (%) >99

- 5 **ПРИМЕР P15.** Получение рацемического 2-[[5-(этилсульфонимидоил)-6-[7-метил-3-(трифторметил)имидазо[4,5-с]пиридазин-6-ил]-3-пиридил]окси]-2-метилпропаннитрила (соединение P15) и его отдельных энантиомеров (соединения P15-A и P15-B)



(P15)

- 10 Стадия 1. Получение 2-[[5-этилсульфанил-6-[7-метил-3-(трифторметил)имидазо[4,5-с]пиридазин-6-ил]-3-пиридил]окси]-2-метилпропаннитрила

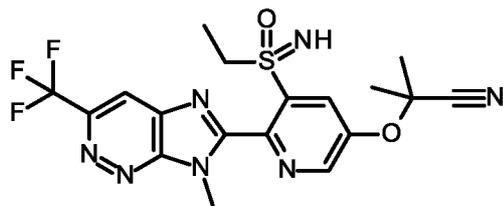


Данное соединение получали аналогично способам, описанным в WO2020/084075.

¹H ЯМР (400 МГц, хлороформ-d) δ ppm 1,42 (t, J=7,34Hz, 3H) 1,88 (s, 6H) 3,03 (q, J=7,34Hz, 2H) 4,31 (s, 3H) 7,72 (d, J=2,57Hz, 1H) 8,26 (s, 1H) 8,39 (d, J=2,57Hz, 1H).

15

- Стадия 2. Получение рацемического 2-[[5-(этилсульфонимидоил)-6-[7-метил-3-(трифторметил)имидазо[4,5-с]пиридазин-6-ил]-3-пиридил]окси]-2-метилпропаннитрила (соединение P15)



(P15)

2-[[5-Этилсульфанил-6-[7-метил-3-(трифторметил)имидазо[4,5-с]пиридазин-6-ил]-3-пиридил]окси]-2-метилпропаннитрил (полученный, как описано выше) обрабатывали в условиях, аналогичных описанным на стадии 2 примера P12, и аналогично способам, описанным в WO2020/084075, с получением требуемого соединения P15. LCMS (способ 1): масса/заряд 454 [M+H]⁺; время удерживания: 0,89 мин.

Стадия 3. Получение соединений P15-A и P15-B, представляющих собой отдельные энантиомеры

10 Рацемическую смесь 2-[[5-(этилсульфонимидоил)-6-[7-метил-3-(трифторметил)имидазо[4,5-с]пиридазин-6-ил]-3-пиридил]окси]-2-метилпропаннитрила (соединение P15) подвергали хиральному разделению посредством препаративной SFC с применением условий, указанных далее в данном документе.

15 Способ аналитической SFC

SFC: Waters Acquity UPC²/QDa

Детектор PDA Waters Acquity UPC²

Колонка: Daicel SFC CHIRALPAK[®] IC, 3 мкм, 0,3 см x 10 см, 40°C

Подвижная фаза: А: CO₂ В: EtOH изократический режим: 15% В за 4,8 мин.

20 АВРР: 1800 фунтов/кв. дюйм

Скорость потока: 2,0 мл/мин.

Обнаружение: при 270 нм

Концентрация образца: 1 мг/мл

Объем впрыска: 1 мкл

25

Способ препаративной SFC

Sepiatec Prep SFC 100

Колонка: Daicel CHIRALPAK[®] IC, 5 мкм, 2,0 см x 25 см

Подвижная фаза: А: CO₂ В: EtOH изократический режим: 15% В за 14 мин.

Противодавление: 150 бар

Скорость потока: 60 мл/мин.

Насос GLS: 3 мл MeOH

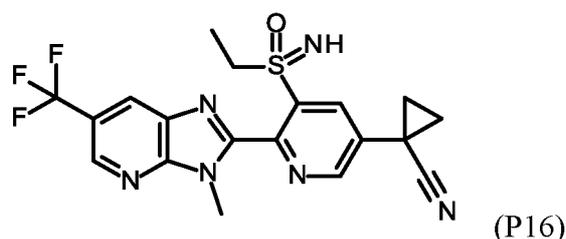
Обнаружение: в УФ при 250 нм

5 Образец: в MeOH/DCM

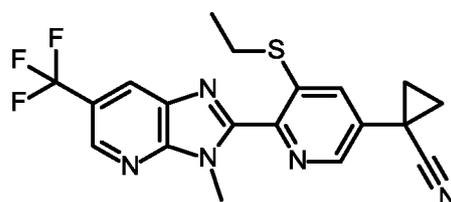
Результаты

Энантиомер P15-A, который элюируется первым	Энантиомер P15-B, который элюируется вторым
Время удерживания (мин.) ~1,32	Время удерживания (мин.) ~3,86
Химическая чистота (% площади при 267 нм) 99	Химическая чистота (% площади при 267 нм) 99
Энантиомерный избыток (%) >99	Энантиомерный избыток (%) >99

10 **ПРИМЕР P16.** Получение рацемического 1-[5-(этилсульфонимидоил)-6-[3-метил-6-(трифторметил)имидазо[4,5-b]пиридин-2-ил]-3-пиридил]циклопропанкарбонитрила (соединение P16) и его отдельных энантиомеров (соединения P16-A и P16-B)



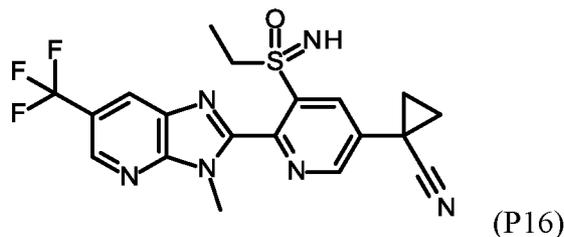
15 Стадия 1. Получение 1-[5-этилсульфанил-6-[3-метил-6-(трифторметил)имидазо[4,5-b]пиридин-2-ил]-3-пиридил]циклопропанкарбонитрила



Данное соединение получали аналогично способам, описанным в WO2019/234158.

LCMS (способ 2): масса/заряд 404 [M+H]⁺; время удерживания: 1,07 мин.

20 Стадия 2. Получение рацемического 1-[5-(этилсульфонимидоил)-6-[3-метил-6-(трифторметил)имидазо[4,5-b]пиридин-2-ил]-3-пиридил]циклопропанкарбонитрила (соединение P16)



1-[5-Этилсульфанил-6-[3-метил-6-(трифторметил)имидазо[4,5-*b*]пиридин-2-ил]-3-пиридил]циклопропанкарбонитрил (полученный, как описано выше) обрабатывали в условиях, аналогичных описанным на стадии 2 примера P12, и аналогично способам, описанным в WO2019/234158, с получением требуемого соединения P16. LCMS (способ 2): масса/заряд 435 [M+H]⁺; время удерживания: 0,87 мин.

Стадия 3. Получение соединений P16-A и P16-B, представляющих собой отдельные энантиомеры

10 Рацемическую смесь 1-[5-(этилсульфонимидоил)-6-[3-метил-6-(трифторметил)имидазо[4,5-*b*]пиридин-2-ил]-3-пиридил]циклопропанкарбонитрила (соединение P16) подвергали хиральному разделению посредством препаративной SFC с применением условий, указанных далее в данном документе.

15 Способ аналитической SFC

SFC: Waters Acquity UPC²/QDa

Детектор PDA Waters Acquity UPC²

Колонка: Daicel SFC CHIRALPAK[®] IG, 3 мкм, 0,46 см x 10 см, 40°C

Подвижная фаза: А: CO₂ В: MeOH изократический режим: 25% В за 4,8 мин.

20 АВРР: 1800 фунтов/кв. дюйм

Скорость потока: 2,0 мл/мин.

Обнаружение: при 290 нм

Концентрация образца: 1 мг/мл

Объем впрыска: 1 мкл

25

Способ препаративной SFC

Sepiatec Prep SFC 100

Колонка: Daicel CHIRALPAK[®] IG, 5 мкм, 2,0 см x 25 см

Подвижная фаза: А: CO₂ В: MeOH изократический режим: 17% В

Противодавление: 150 бар

Скорость потока: 60 мл/мин.

Насос GLS: -

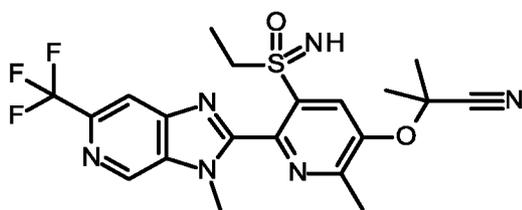
Обнаружение: в УФ при 290 нм

5 Образец: в MeOH/DCM

Результаты

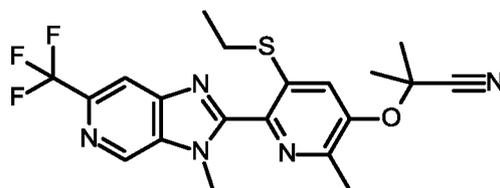
Энантиомер P16-A, который элюируется первым	Энантиомер P16-B, который элюируется вторым
Время удерживания (мин.) ~2,35	Время удерживания (мин.) ~3,37
Химическая чистота (% площади при 290 нм) >99	Химическая чистота (% площади при 290 нм) >99
Энантиомерный избыток (%) >99	Энантиомерный избыток (%) 99

10 **ПРИМЕР P17.** Получение рацемического 2-[[5-(этилсульфонимидоил)-2-метил-6-[3-метил-6-(трифторметил)имидазо[4,5-с]пиридин-2-ил]-3-пиридил]окси]-2-метилпропаннитрила (соединение P17) и его отдельных энантиомеров (соединения P17-A и P17-B)



(P17)

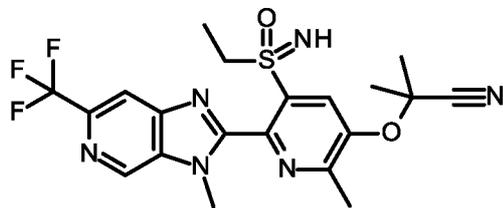
15 Стадия 1. Получение 2-[[5-этилсульфанил-2-метил-6-[3-метил-6-(трифторметил)имидазо[4,5-с]пиридин-2-ил]-3-пиридил]окси]-2-метилпропаннитрила



Данное соединение получали аналогично способам, описанным в WO2020/084075.

LCMS (способ 1): масса/заряд 436 [M+H]⁺; время удерживания: 1,06 мин.

Стадия 2. Получение рацемического 2-[[5-(этилсульфонимидоил)-2-метил-6-[3-метил-6-(трифторметил)имидазо[4,5-с]пиридин-2-ил]-3-пиридил]окси]-2-метилпропаннитрила (соединение P17)



(P17)

- 5 2-[[5-Этилсульфанил-2-метил-6-[3-метил-6-(трифторметил)имидазо[4,5-с]пиридин-2-ил]-3-пиридил]окси]-2-метилпропаннитрил (полученный, как описано выше) обрабатывали в условиях, аналогичных описанным на стадии 2 примера P12, и аналогично способам, описанным в WO2020/084075, с получением требуемого соединения P17. LCMS (способ 1): масса/заряд 467 [M+H]⁺; время удерживания:
- 10 0,91 мин.

Стадия 3. Получение соединений P17-A и P17-B, представляющих собой отдельные энантиомеры

- 15 Рацемическую смесь 2-[[5-(этилсульфонимидоил)-2-метил-6-[3-метил-6-(трифторметил)имидазо[4,5-с]пиридин-2-ил]-3-пиридил]окси]-2-метилпропаннитрила (соединение P17) подвергали хиральному разделению посредством препаративной SFC с применением условий, указанных далее в данном документе.

Способ аналитической SFC

- 20 SFC: Waters Acquity UPC²/QDa
 Детектор PDA Waters Acquity UPC²
 Колонка: Daicel SFC CHIRALPAK[®] IG, 3 мкм, 0,3 см x 10 см, 40°C
 Подвижная фаза: А: CO₂ В: MeOH изократический режим: 30% В за 4,8 мин.
 АВPR: 1800 фунтов/кв. дюйм
- 25 Скорость потока: 2,0 мл/мин.
 Обнаружение: при 270 нм
 Концентрация образца: 1 мг/мл
 Объем впрыска: 1 мкл

Способ препаративной SFC

Sepiatec Prep SFC 100

Колонка: Daicel CHIRALPAK® IG, 5 мкм, 2,0 см x 25 см

Подвижная фаза: А: CO₂ В: MeOH изократический режим: 30% В за 14 мин.

5 Противодавление: 150 бар

Скорость потока: 60 мл/мин.

Насос GLS: 3 мл

Обнаружение: в УФ при 270 нм

Образец: в MeOH/DCM

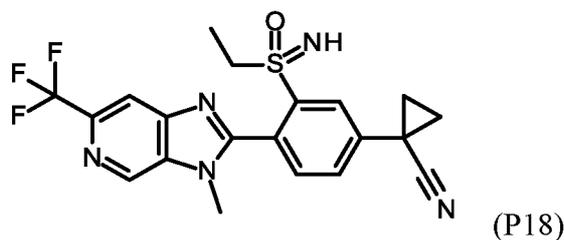
10

Результаты

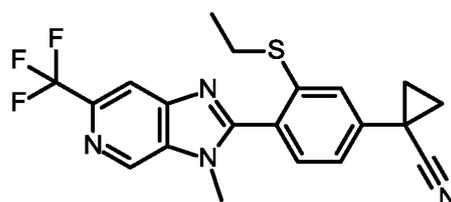
Энантиомер P17-A, который элюируется первым	Энантиомер P17-B, который элюируется вторым
Время удерживания (мин.) ~1,23	Время удерживания (мин.) ~2,36
Химическая чистота (% площади при 270 нм) 99	Химическая чистота (% площади при 270 нм) 99
Энантиомерный избыток (%) >99	Энантиомерный избыток (%) >99

15

ПРИМЕР P18. Получение рацемического 1-[3-(этилсульфонимидоил)-4-[3-метил-6-(трифторметил)имидазо[4,5-с]пиридин-2-ил]фенил]циклопропанкарбонитрила (соединение P18) и его отдельных энантиомеров (соединения P18-A и P18-B)



Стадия 1. Получение 1-[3-этилсульфанил-4-[3-метил-6-(трифторметил)имидазо[4,5-с]пиридин-2-ил]фенил]циклопропанкарбонитрила

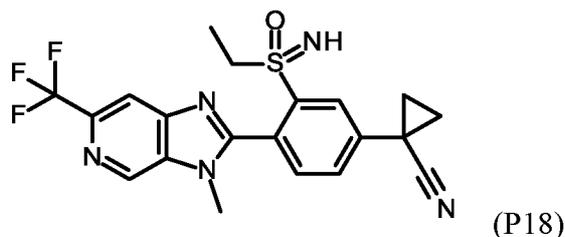


20

Данное соединение получали аналогично способам, описанным в WO2019/234158.

LCMS (способ 2): масса/заряд 403 $[M+H]^+$; время удерживания: 1,00 мин.

5 Стадия 2. Получение рацемического 1-[3-(этилсульфонимидоил)-4-[3-метил-6-(трифторметил)имидазо[4,5-с]пиридин-2-ил]фенил]циклопропанкарбонитрила (соединение P18)



10 1-[3-Этилсульфанил-4-[3-метил-6-(трифторметил)имидазо[4,5-с]пиридин-2-ил]фенил]циклопропанкарбонитрил (полученный, как описано выше) обрабатывали в условиях, аналогичных описанным на стадии 2 примера P12, и аналогично способам, описанным в WO2019/234158, с получением требуемого соединения P18. LCMS (способ 2): масса/заряд 434 $[M+H]^+$; время удерживания: 0,83 мин.

15 Стадия 3. Получение соединений P18-A и P18-B, представляющих собой отдельные энантиомеры

Рацемическую смесь 1-[3-(этилсульфонимидоил)-4-[3-метил-6-(трифторметил)имидазо[4,5-с]пиридин-2-ил]фенил]циклопропанкарбонитрила (соединение P18) подвергали хиральному разделению посредством препаративной SFC с применением условий, указанных далее в данном документе.

20

Способ аналитической SFC

SFC: Waters Acquity UPC²/QDa

Детектор PDA Waters Acquity UPC²

Колонка: Daicel SFC CHIRALPAK[®] IC, 3 мкм, 0,3 см x 10 см, 40°C

25 Подвижная фаза: А: CO₂ В: EtOH изократический режим: 15% В за 4,8 мин.

ABPR: 1800 фунтов/кв. дюйм

Скорость потока: 2,0 мл/мин.

Обнаружение: при 230 нм

Концентрация образца: 1 мг/мл

Объем впрыска: 1 мкл

Способ препаративной SFC

Seriatec Prep SFC 100

5 Колонка: Daicel CHIRALPAK[®] IC, 5 мкм, 2,0 см x 25 см

Подвижная фаза: А: CO₂ В: EtOH изократический режим: 15% В за 15 мин.

Противодавление: 150 бар

Скорость потока: 60 мл/мин.

Насос GLS: 5 мл EtOH

10 Обнаружение: в УФ при 230 нм

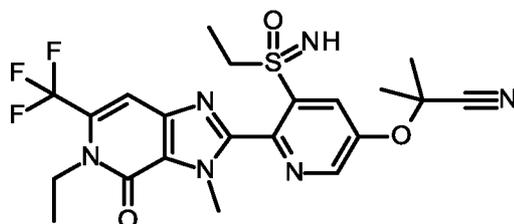
Образец: в MeOH

Результаты

Энантиомер Р18-А, который элюируется первым	Энантиомер Р18-В, который элюируется вторым
Время удерживания (мин.) ~2,74	Время удерживания (мин.) ~3,99
Химическая чистота (% площади при 230 нм) >99	Химическая чистота (% площади при 230 нм) >99
Энантиомерный избыток (%) >99	Энантиомерный избыток (%) >99

15

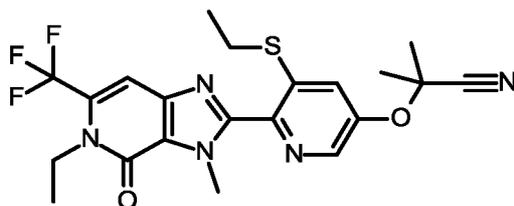
ПРИМЕР Р19. Получение рацемического 2-[[6-[5-этил-3-метил-4-оксо-6-(трифторметил)имидазо[4,5-с]пиридин-2-ил]-5-(этилсульфонимидоил)-3-пиридил]окси]-2-метилпропаннитрила (соединение Р19) и его отдельных энантиомеров (соединения Р19-А и Р19-В)



(P19)

20

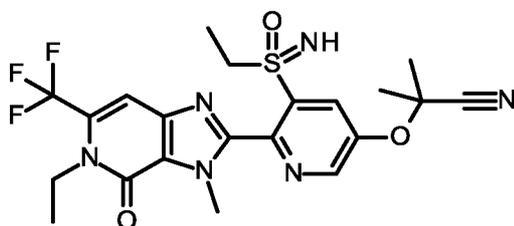
Стадия 1. Получение 2-[[6-[5-этил-3-метил-4-оксо-6-(трифторметил)имидазо[4,5-с]пиридин-2-ил]-5-этилсульфанил-3-пиридил]окси]-2-метилпропаннитрила



Данное соединение получали аналогично способам, описанным в WO2020/084075.

LCMS (способ 4): масса/заряд 466 $[M+H]^+$; время удерживания: 1,10 мин.

- 5 Стадия 2. Получение рацемического 2-[[6-[5-этил-3-метил-4-оксо-6-(трифторметил)имидазо[4,5-с]пиридин-2-ил]-5-(этилсульфонимидоил)-3-пиридил]окси]-2-метилпропаннитрила (соединение P19)



(P19)

- 10 2-[[6-[5-Этил-3-метил-4-оксо-6-(трифторметил)имидазо[4,5-с]пиридин-2-ил]-5-этилсульфанил-3-пиридил]окси]-2-метилпропаннитрил (полученный, как описано выше) обрабатывали в условиях, аналогичных описанным на стадии 2 примера P12, и аналогично способам, описанным в WO2020/084075, с получением требуемого соединения P19. LCMS (способ 4): масса/заряд 497 $[M+H]^+$; время удерживания: 0,93 мин.

- 15 Стадия 3. Получение соединений P19-A и P19-B, представляющих собой отдельные энантиомеры

- 20 Рацемическую смесь 2-[[6-[5-этил-3-метил-4-оксо-6-(трифторметил)имидазо[4,5-с]пиридин-2-ил]-5-(этилсульфонимидоил)-3-пиридил]окси]-2-метилпропаннитрила (соединение P19) подвергали хиральному разделению посредством препаративной SFC с применением условий, указанных далее в данном документе.

Способ аналитической SFC

SFC: Waters Acquity UPC²/QDa

- 25 Детектор PDA Waters Acquity UPC²

Колонка: Daicel SFC CHIRALPAK® IA, 3 мкм, 0,3 см x 10 см, 40°C

Подвижная фаза: А: CO₂ В: iPrOH изократический режим: 20% В за 4,8 мин.

ABPR: 1800 фунтов/кв. дюйм

Скорость потока: 2,0 мл/мин.

5 Обнаружение: при 220 нм

Концентрация образца: 1 мг/мл

Объем впрыска: 1 мкл

Способ препаративной SFC

10 Sepiatec Prep SFC 100

Колонка: Daicel CHIRALPAK® IA, 5 мкм, 2,0 см x 25 см

Подвижная фаза: А: CO₂ В: iPrOH изократический режим: 20% В за 14 мин.

Противодавление: 150 бар

Скорость потока: 60 мл/мин.

15 Насос GLS: 2 мл MeOH

Обнаружение: в УФ при 220 нм

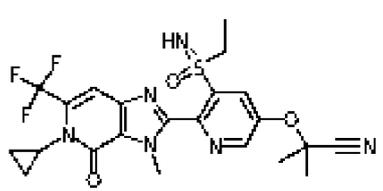
Образец: в MeOH/DCM

Результаты

Энантиомер Р19-А, который элюируется первым	Энантиомер Р19-В, который элюируется вторым
Время удерживания (мин.) ~1,18	Время удерживания (мин.) ~2,18
Химическая чистота (% площади при 220 нм) 99	Химическая чистота (% площади при 220 нм) 99
Энантиомерный избыток (%) >99	Энантиомерный избыток (%) >99

20

Таблица Р. Примеры рацемической смеси соединений формулы (I)

№	Название согласно ИУПАС	Структуры	LCMS		
			R _t (мин.)	[M+H] ⁺ (измеренное)	Способ
P1	2-[[6-[5-циклопропил-3-метил-4-оксо-6-(трифторметил)имидазо[4,5-с]пиридин-2-ил]-5-(этилсульфонимидоил)-3-пиридил]окси]-2-метилпропаннитрил		0,92	509	4

№	Название согласно IUPAC	Структуры	LCMS		
			R _t (мин.)	[M+H] ⁺ (измеренное)	Способ
P2	1-[5-(этилсульфонимидоил)-6-[7-метил-3-(трифторметил)имидазо[4,5-с]пиридазин-6-ил]-3-пиридил]циклопропанкарбонитрил		0,82	436	5
P3	2-[[5-(этилсульфонимидоил)-6-[7-(трифторметил)имидазо[1,2-а]пиридин-2-ил]-3-пиридил]окси]-2-метилпропаннитрил		0,88	438	1
P4	2-[5-(этилсульфонимидоил)-6-[3-метил-6-(трифторметил)имидазо[4,5-с]пиридин-2-ил]-3-пиридил]-2-метилпропаннитрил		0,83	437	2
P5	2-[[5-(этилсульфонимидоил)-2-метил-6-[3-метил-6-(трифторметил)имидазо[4,5-б]пиридин-2-ил]-3-пиридил]окси]-2-метилпропаннитрил		0,97	467	1
P6	1-[3-(этилсульфонимидоил)-4-[3-метил-6-(трифторметил)имидазо[4,5-б]пиридин-2-ил]фенил]циклопропанкарбонитрил		0,88	434	2
P7	2-[[5-(этилсульфонимидоил)-6-[7-(трифторметилсульфанил)имидазо[1,2-с]пиримидин-2-ил]-3-пиридил]окси]-2-метилпропаннитрил		0,89	471	1
P8	1-[5-(этилсульфонимидоил)-6-[5-метокси-3-метил-4-оксо-6-(трифторметил)имидазо[4,5-с]пиридин-2-ил]-3-пиридил]циклопропанкарбонитрил		0,85	481	5

№	Название согласно IUPAC	Структуры	LCMS		
			R _t (мин.)	[M+H] ⁺ (измеренное)	Способ
	рбонитрил				
P9	2-[[5-(этилсульфонимидоил)-6-[3-метил-6-(трифторметил)имидазо[4,5- <i>b</i>]пиридин-2-ил]-3-пиридил]окси]-2-метилпропаннитрил		0,93	453	1
P10	1-[5-(этилсульфонимидоил)-6-[3-метил-6-(трифторметил)имидазо[4,5- <i>c</i>]пиридин-2-ил]-3-пиридил]циклопропанкарбонитрил		0,82	435	1
P11	2-[[5-(этилсульфонимидоил)-6-[7-(трифторметил)имидазо[1,2- <i>c</i>]пиримидин-2-ил]-3-пиридил]окси]-2-метилпропаннитрил		0,84	439	1
P12	2-[5-(этилсульфонимидоил)-6-[3-метил-6-(трифторметил)имидазо[4,5- <i>b</i>]пиридин-2-ил]-3-пиридил]-2-метилпропаннитрил		0,91	437	2
P13	2-[[5-(этилсульфонимидоил)-6-[3-метил-6-(трифторметил)имидазо[4,5- <i>c</i>]пиридин-2-ил]-3-пиридил]окси]-2-метилпропаннитрил		0,86	453	1
P14	1-[6-[5-этил-3-метил-4-оксо-6-(трифторметил)имидазо[4,5- <i>c</i>]пиридин-2-ил]-5-(этилсульфонимидоил)-3-пиридил]циклопропанкарбонитрил		0,92	479	5
P15	2-[[5-(этилсульфонимидоил)-6-[7-метил-3-(трифторметил)имидазо[4,5- <i>c</i>]пиридазин-6-ил]-3-пиридил]окси]-2-метилпропаннитрил		0,89	454	1

№	Название согласно IUPAC	Структуры	LCMS		
			R _t (мин.)	[M+H] ⁺ (измеренное)	Способ
P16	1-[5-(этилсульфонимидоил)-6-[3-метил-6-(трифторметил)имидазо[4,5-b]пиридин-2-ил]-3-пиридил]циклопропанкарбонитрил		0,87	435	2
P17	2-[[5-(этилсульфонимидоил)-2-метил-6-[3-метил-6-(трифторметил)имидазо[4,5-c]пиридин-2-ил]-3-пиридил]окси]-2-метилпропаннитрил		0,91	467	1
P18	1-[3-(этилсульфонимидоил)-4-[3-метил-6-(трифторметил)имидазо[4,5-c]пиридин-2-ил]фенил]циклопропанкарбонитрил		0,83	434	2
P19	2-[[6-[5-этил-3-метил-4-оксо-6-(трифторметил)имидазо[4,5-c]пиридин-2-ил]-5-(этилсульфонимидоил)-3-пиридил]окси]-2-метилпропаннитрил		0,93	497	4

Таблица P(E). Примеры соединений формулы (I) в виде отдельных энантиомеров

№	Название рацемата согласно IUPAC	Энантиомер	R _t (мин.)	[M+H] ⁺ (измеренное)	Способ
P1-A	2-[[6-[5-циклопропил-3-метил-4-оксо-6-(трифторметил)имидазо[4,5-c]пиридин-2-ил]-5-(этилсульфонимидоил)-3-пиридил]окси]-2-метилпропаннитрил	Элюируется первым	1,81	509	SFC: Waters Acquity UPC ² /QDa Детектор PDA Waters Acquity UPC ² Колонка: Daicel SFC CHIRALPAK® IA, 3 мкм, 0,3 см x 10 см, 40°C Подвижная фаза: А: CO ₂ В: iPrOH изократический режим: 20% В за 4,8 мин. АВPR: 1800 фунтов/кв. дюйм Скорость потока: 2,0 мл/мин. Обнаружение: при 220 нм Концентрация образца: 1 мг/мл Объем впрыска: 1 мкл
P1-B		Элюируется вторым	3,75	509	

№	Название рацемата согласно IUPAC	Энантиомер	R _t (мин.)	[M+H] ⁺ (измеренное)	Способ
P2-A	1-[5-(этилсульфонимидил)-6-[7-метил-3-(трифторметил)имидазо[4,5-с]пиридазин-6-ил]-3-пиридил]циклопропанкарбонитрил	Элюируется первым	1,36	436	SFC: Waters Acquity UPC ² /QDa Детектор PDA Waters Acquity UPC ² Колонка: Daicel SFC CHIRALPAK [®] IC, 3 мкм, 0,3 см x 10 см, 40°C Подвижная фаза: А: CO ₂ В: EtOH изократический режим: 20% В за 4,8 мин. ABPR: 1800 фунтов/кв. дюйм Скорость потока: 2,0 мл/мин. Обнаружение: при 265 нм Концентрация образца: 1 мг/мл Объем впрыска: 1 мл
P2-B		Элюируется вторым	3,54	436	
P3-A	2-[[5-(этилсульфонимидил)-6-[7-(трифторметил)имидазо[1,2-а]пиридин-2-ил]-3-пиридил]окси]-2-метилпропаннитрил	Элюируется первым	1,97	438	SFC: Waters Acquity UPC ² /QDa Детектор PDA Waters Acquity UPC ² Колонка: Daicel SFC CHIRALPAK [®] IC, 3 мкм, 0,3 см x 10 см, 40°C Подвижная фаза: А: CO ₂ В: MeOH изократический режим: 20% В за 4,8 мин. ABPR: 1800 фунтов/кв. дюйм Скорость потока: 2,0 мл/мин. Обнаружение: при 250 нм Концентрация образца: 1 мг/мл Объем впрыска: 1 мкл
P3-B		Элюируется вторым	3,19	438	
P4-A	2-[5-(этилсульфонимидил)-6-[3-метил-6-(трифторметил)имидазо[4,5-с]пиридин-2-ил]-3-пиридил]-2-метилпропаннитрил	Элюируется первым	1,76	437	SFC: Waters Acquity UPC ² /QDa Детектор PDA Waters Acquity UPC ² Колонка: Daicel SFC CHIRALPAK [®] IG, 3 мкм, 0,46 см x 10 см, 40°C Подвижная фаза: А: CO ₂ В: MeOH изократический режим: 30% В за 4,8 мин. ABPR: 1800 фунтов/кв. дюйм Скорость потока: 2,0 мл/мин. Обнаружение: при 265 нм Концентрация образца: 1 мг/мл Объем впрыска: 1 мл
P4-B		Элюируется вторым	2,82	437	
P5-A	2-[[5-(этилсульфонимидил)-2-метил-6-[3-метил-6-(трифторметил)имидазо[4,5-б]пиридин-2-ил]-3-	Элюируется первым	1,92	467	SFC: Waters Acquity UPC ² /QDa Детектор PDA Waters Acquity UPC ² Колонка: Daicel SFC CHIRALPAK [®] IG, 3 мкм, 0,3 см x 10 см, 40°C Подвижная фаза: А: CO ₂ В: MeOH изократический режим: 15% В за 4,8 мин.

№	Название рацемата согласно IUPAC	Энантиомер	R _t (мин.)	[M+H] ⁺ (измеренное)	Способ
P5-B	пиридил]окси]-2-метилпропаннитрил	Элюируется вторым	3,12	467	ABPR: 1800 фунтов/кв. дюйм Скорость потока: 2,0 мл/мин. Обнаружение: при 280 нм Концентрация образца: 1 мг/мл Объем впрыска: 1 мкл
P6-A	1-[3-(этилсульфонимидоил)-4-[3-метил-6-(трифторметил)имидазо[4,5-b]пиридин-2-ил]фенил]циклопропанкарбонитрил	Элюируется первым	2,34	434	SFC: Waters Acquity UPC ² /QDa Детектор PDA Waters Acquity UPC ² Колонка: Daicel SFC CHIRALPAK [®] IG, 3 мкм, 0,46 см x 10 см, 40°C Подвижная фаза: А: CO ₂ В: iPrOH изократический режим: 35% В за 4,8 мин. ABPR: 1800 фунтов/кв. дюйм Скорость потока: 2,0 мл/мин. Обнаружение: при 290 нм Концентрация образца: 1 мг/мл Объем впрыска: 1 мл
P6-B	1-[3-(этилсульфонимидоил)-4-[3-метил-6-(трифторметил)имидазо[4,5-b]пиридин-2-ил]фенил]циклопропанкарбонитрил	Элюируется вторым	3,99	434	ABPR: 1800 фунтов/кв. дюйм Скорость потока: 2,0 мл/мин. Обнаружение: при 290 нм Концентрация образца: 1 мг/мл Объем впрыска: 1 мл
P7-A	2-[[5-(этилсульфонимидоил)-6-[7-(трифторметилсульфанил)имидазо[1,2-с]пиримидин-2-ил]-3-пиридил]окси]-2-метилпропаннитрил	Элюируется первым	1,28	471	SFC: Waters Acquity UPC ² /QDa Детектор PDA Waters Acquity UPC ² Колонка: Daicel SFC CHIRALPAK [®] IC, 3 мкм, 0,3 см x 10 см, 40°C Подвижная фаза: А: CO ₂ В: MeOH изократический режим: 30% В за 4,8 мин. ABPR: 1800 фунтов/кв. дюйм Скорость потока: 2,0 мл/мин. Обнаружение: при 250 нм Концентрация образца: 1 мг/мл Объем впрыска: 1 мкл
P7-B	2-[[5-(этилсульфонимидоил)-6-[7-(трифторметилсульфанил)имидазо[1,2-с]пиримидин-2-ил]-3-пиридил]окси]-2-метилпропаннитрил	Элюируется вторым	3,63	471	ABPR: 1800 фунтов/кв. дюйм Скорость потока: 2,0 мл/мин. Обнаружение: при 250 нм Концентрация образца: 1 мг/мл Объем впрыска: 1 мкл
P8-A	1-[5-(этилсульфонимидоил)-6-[5-метокси-3-метил-4-оксо-6-(трифторметил)имидазо[4,5-с]пиридин-2-ил]-3-пиридил]циклопропанкарбонитрил	Элюируется первым	1,73	481	SFC: Waters Acquity UPC ² /QDa Детектор PDA Waters Acquity UPC ² Колонка: Daicel SFC CHIRALPAK [®] IA, 3 мкм, 0,3 см x 10 см, 40°C Подвижная фаза: А: CO ₂ В: iPrOH изократический режим: 25% В за 4,8 мин. ABPR: 1800 фунтов/кв. дюйм Скорость потока: 2,0 мл/мин. Обнаружение: при 220 нм Концентрация образца: 1 мг/мл Объем впрыска: 1 мл
P8-B	1-[5-(этилсульфонимидоил)-6-[5-метокси-3-метил-4-оксо-6-(трифторметил)имидазо[4,5-с]пиридин-2-ил]-3-пиридил]циклопропанкарбонитрил	Элюируется вторым	3,15	481	ABPR: 1800 фунтов/кв. дюйм Скорость потока: 2,0 мл/мин. Обнаружение: при 220 нм Концентрация образца: 1 мг/мл Объем впрыска: 1 мл

№	Название рацемата согласно IUPAC	Энантиомер	R _t (мин.)	[M+H] ⁺ (измеренное)	Способ
P9-A	2-[[5-(этилсульфонимидоил)-6-[3-метил-6-(трифторметил)имидазо[4,5-b]пиридин-2-ил]-3-пиридил]окси]-2-метилпропаннитрил	Элюируется первым	1,49	453	SFC: Waters Acquity UPC ² /QDa Детектор PDA Waters Acquity UPC ² Колонка: Daicel SFC CHIRALPAK [®] IA, 3 мкм, 0,3 см x 10 см, 40°C Подвижная фаза: А: CO ₂ В: EtOH изократический режим: 10% В за 4,8 мин. ABPR: 1800 фунтов/кв. дюйм Скорость потока: 2,0 мл/мин. Обнаружение: при 290 нм Концентрация образца: 1 мг/мл Объем впрыска: 1 мкл
P9-B	2-[[5-(этилсульфонимидоил)-6-[3-метил-6-(трифторметил)имидазо[4,5-b]пиридин-2-ил]-3-пиридил]окси]-2-метилпропаннитрил	Элюируется вторым	2,01	453	SFC: Waters Acquity UPC ² /QDa Детектор PDA Waters Acquity UPC ² Колонка: Daicel SFC CHIRALPAK [®] IG, 3 мкм, 0,46 см x 10 см, 40°C Подвижная фаза: А: CO ₂ В: MeOH изократический режим: 40% В за 4,8 мин. ABPR: 1800 фунтов/кв. дюйм Скорость потока: 2,0 мл/мин. Обнаружение: при 250 нм Концентрация образца: 1 мг/мл Объем впрыска: 1 мл
P10-A	1-[5-(этилсульфонимидоил)-6-[3-метил-6-(трифторметил)имидазо[4,5-c]пиридин-2-ил]-3-пиридил]циклопропанкарбонитрил	Элюируется первым	1,68	435	SFC: Waters Acquity UPC ² /QDa Детектор PDA Waters Acquity UPC ² Колонка: Daicel SFC CHIRALPAK [®] IC, 3 мкм, 0,3 см x 10 см, 40°C Подвижная фаза: А: CO ₂ В: MeOH изократический режим: 30% В за 4,8 мин. ABPR: 1800 фунтов/кв. дюйм Скорость потока: 2,0 мл/мин. Обнаружение: при 240 нм Концентрация образца: 1 мг/мл Объем впрыска: 1 мкл
P10-B	1-[5-(этилсульфонимидоил)-6-[3-метил-6-(трифторметил)имидазо[4,5-c]пиридин-2-ил]-3-пиридил]циклопропанкарбонитрил	Элюируется вторым	2,99	435	SFC: Waters Acquity UPC ² /QDa Детектор PDA Waters Acquity UPC ² Колонка: Daicel SFC CHIRALPAK [®] IC, 3 мкм, 0,3 см x 10 см, 40°C Подвижная фаза: А: CO ₂ В: MeOH изократический режим: 30% В за 4,8 мин. ABPR: 1800 фунтов/кв. дюйм Скорость потока: 2,0 мл/мин. Обнаружение: при 240 нм Концентрация образца: 1 мг/мл Объем впрыска: 1 мкл
P11-A	2-[[5-(этилсульфонимидоил)-6-[7-(трифторметил)имидазо[1,2-c]пиримидин-2-ил]-3-пиридил]окси]-2-метилпропаннитрил	Элюируется первым	1,08	439	SFC: Waters Acquity UPC ² /QDa Детектор PDA Waters Acquity UPC ² Колонка: Daicel SFC CHIRALPAK [®] IC, 3 мкм, 0,3 см x 10 см, 40°C Подвижная фаза: А: CO ₂ В: MeOH изократический режим: 30% В за 4,8 мин. ABPR: 1800 фунтов/кв. дюйм Скорость потока: 2,0 мл/мин. Обнаружение: при 240 нм Концентрация образца: 1 мг/мл Объем впрыска: 1 мкл
P11-B	2-[[5-(этилсульфонимидоил)-6-[7-(трифторметил)имидазо[1,2-c]пиримидин-2-ил]-3-пиридил]окси]-2-метилпропаннитрил	Элюируется вторым	2,78	439	SFC: Waters Acquity UPC ² /QDa Детектор PDA Waters Acquity UPC ² Колонка: Daicel SFC CHIRALPAK [®] IG, 3 мкм, 0,46 см x 10 см, 40°C Подвижная фаза: А: CO ₂ В: EtOH изократический режим: 20% В за 4,8 мин. ABPR: 1800 фунтов/кв. дюйм Скорость потока: 2,0 мл/мин.
P12-A	2-[5-(этилсульфонимидоил)-6-[3-метил-6-(трифторметил)имидазо[4,5-b]пиридин-2-ил]-3-пиридил]-2-метилпропаннитрил	Элюируется первым	2,42	437	SFC: Waters Acquity UPC ² /QDa Детектор PDA Waters Acquity UPC ² Колонка: Daicel SFC CHIRALPAK [®] IG, 3 мкм, 0,46 см x 10 см, 40°C Подвижная фаза: А: CO ₂ В: EtOH изократический режим: 20% В за 4,8 мин. ABPR: 1800 фунтов/кв. дюйм Скорость потока: 2,0 мл/мин.

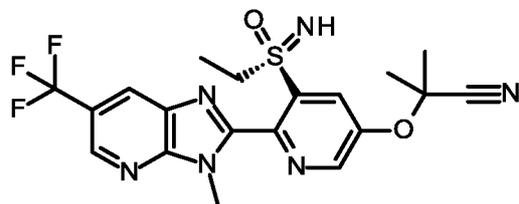
№	Название рацемата согласно IUPAC	Энантиомер	R _t (мин.)	[M+H] ⁺ (измеренное)	Способ
P12-B		Элюируется вторым	3,17	437	Обнаружение: при 220 нм Концентрация образца: 1 мг/мл Объем впрыска: 1 мл
P13-A	2-[[5-(этилсульфонимидоил)-6-[3-метил-6-(трифторметил)имидазо[4,5-с]пиридин-2-ил]-3-пиридил]окси]-2-метилпропаннитрил	Элюируется первым	1,70	453	SFC: Waters Acquity UPC ² /QDa Детектор PDA Waters Acquity UPC ² Колонка: Daicel SFC CHIRALPAK® IG, 3 мкм, 0,3 см x 10 см, 40°C Подвижная фаза: А: CO ₂ В: MeOH изократический режим: 30% В за 4,8 мин. ABPR: 1800 фунтов/кв. дюйм Скорость потока: 2,0 мл/мин. Обнаружение: при 270 нм Концентрация образца: 1 мг/мл Объем впрыска: 1 мкл
P13-B		Элюируется вторым	3,89	453	
P14-A	1-[6-[5-этил-3-метил-4-оксо-6-(трифторметил)имидазо[4,5-с]пиридин-2-ил]-5-(этилсульфонимидоил)-3-пиридил]циклопропанкарбонитрил	Элюируется первым	2,92	479	SFC: Waters Acquity UPC ² /QDa Детектор PDA Waters Acquity UPC ² Колонка: Daicel SFC CHIRALPAK® IG, 3 мкм, 0,46 см x 10 см, 40°C Подвижная фаза: А: CO ₂ В: iPrOH изократический режим: 35% В за 4,8 мин. ABPR: 1800 фунтов/кв. дюйм Скорость потока: 2,0 мл/мин. Обнаружение: при 220 нм Концентрация образца: 1 мг/мл Объем впрыска: 1 мл
P14-B		Элюируется вторым	4,06	479	
P15-A	2-[[5-(этилсульфонимидоил)-6-[7-метил-3-(трифторметил)имидазо[4,5-с]пиридазин-6-ил]-3-пиридил]окси]-2-метилпропаннитрил	Элюируется первым	1,32	454	SFC: Waters Acquity UPC ² /QDa Детектор PDA Waters Acquity UPC ² Колонка: Daicel SFC CHIRALPAK® IC, 3 мкм, 0,3 см x 10 см, 40°C Подвижная фаза: А: CO ₂ В: EtOH изократический режим: 15% В за 4,8 мин. ABPR: 1800 фунтов/кв. дюйм Скорость потока: 2,0 мл/мин. Обнаружение: при 270 нм Концентрация образца: 1 мг/мл Объем впрыска: 1 мкл
P15-B		Элюируется вторым	3,86	454	

№	Название рацемата согласно IUPAC	Энантиомер	R _t (мин.)	[M+H] ⁺ (измеренное)	Способ
P16-A	1-[5-(этилсульфонимидоил)-6-[3-метил-6-(трифторметил)имидазо[4,5-b]пиридин-2-ил]-3-пиридил]циклопропанкарбонитрил	Элюируется первым	2,35	435	SFC: Waters Acquity UPC ² /QDa Детектор PDA Waters Acquity UPC ² Колонка: Daicel SFC CHIRALPAK [®] IG, 3 мкм, 0,46 см x 10 см, 40°C Подвижная фаза: А: CO ₂ В: MeOH изократический режим: 25% В за 4,8 мин. ABPR: 1800 фунтов/кв. дюйм Скорость потока: 2,0 мл/мин. Обнаружение: при 290 нм Концентрация образца: 1 мг/мл Объем впрыска: 1 мл
P16-B		Элюируется вторым	3,37	435	
P17-A	2-[[5-(этилсульфонимидоил)-2-метил-6-[3-метил-6-(трифторметил)имидазо[4,5-с]пиридин-2-ил]-3-пиридил]окси]-2-метилпропаннитрил	Элюируется первым	1,23	467	SFC: Waters Acquity UPC ² /QDa Детектор PDA Waters Acquity UPC ² Колонка: Daicel SFC CHIRALPAK [®] IG, 3 мкм, 0,3 см x 10 см, 40°C Подвижная фаза: А: CO ₂ В: MeOH изократический режим: 30% В за 4,8 мин. ABPR: 1800 фунтов/кв. дюйм Скорость потока: 2,0 мл/мин. Обнаружение: при 270 нм Концентрация образца: 1 мг/мл Объем впрыска: 1 мл
P17-B		Элюируется вторым	2,36	467	
P18-A	1-[3-(этилсульфонимидоил)-4-[3-метил-6-(трифторметил)имидазо[4,5-с]пиридин-2-ил]фенил]циклопропанкарбонитрил	Элюируется первым	2,74	434	SFC: Waters Acquity UPC ² /QDa Детектор PDA Waters Acquity UPC ² Колонка: Daicel SFC CHIRALPAK [®] IC, 3 мкм, 0,3 см x 10 см, 40°C Подвижная фаза: А: CO ₂ В: EtOH изократический режим: 15% В за 4,8 мин. ABPR: 1800 фунтов/кв. дюйм Скорость потока: 2,0 мл/мин. Обнаружение: при 230 нм Концентрация образца: 1 мг/мл Объем впрыска: 1 мл
P18-B		Элюируется вторым	3,99	434	
P19-A	2-[[6-[5-этил-3-метил-4-оксо-6-(трифторметил)имидазо[4,5-с]пиридин-2-ил]-5-(этилсульфонимидоил)-3-пиридил]окси]-2-	Элюируется первым	1,18	497	SFC: Waters Acquity UPC ² /QDa Детектор PDA Waters Acquity UPC ² Колонка: Daicel SFC CHIRALPAK [®] IA, 3 мкм, 0,3 см x 10 см, 40°C Подвижная фаза: А: CO ₂ В: iPrOH изократический режим: 20% В за 4,8 мин. ABPR: 1800 фунтов/кв. дюйм Скорость потока: 2,0 мл/мин.

№	Название рацемата согласно IUPAC	Энантиомер	R _t (мин.)	[M+H] ⁺ (измеренное)	Способ
P19-B	метилпропаннитрил	Элюируется вторым	2,18	497	Обнаружение: при 220 нм Концентрация образца: 1 мг/мл Объем впрыска: 1 мкл

Измеренные характеристические значения молекулярных ионов (M+H)⁺ в таблице P(E) регистрировали на масс-спектрометре от Waters (QDa) (полярность: положительные и отрицательные ионы), коэффициент усиления детектора 1, температурный зонд: 500°C, напряжение на конусе: 10V, положительное напряжение на капилляре ESI 0,8 – отрицательное напряжение 0,8, частота забора измерений 5 Гц, диапазон масс: от 100 до 850 Да.

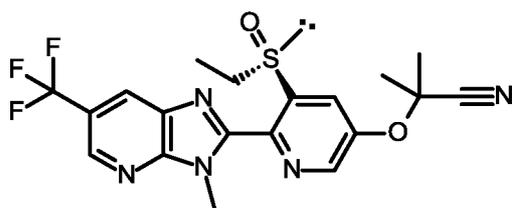
ПРИМЕР E1. Получение (R)-2-[[5-(этилсульфонимидоил)-6-[3-метил-6-(трифторметил)имидазо[4,5-b]пиридин-2-ил]-3-пиридил]окси]-2-метилпропаннитрила (соединение (R)-P9)



(Соединение (R)-P9)

Соединение (R)-P9 в энантиомерно обогащенной форме (основной (R)-стереоизомер с абсолютной конфигурацией, изображенной на рисунке) получали в две стадии из 2-[[5-этилсульфанил-6-[3-метил-6-(трифторметил)]имидазо[4,5-b]пиридин-2-ил]-3-пиридил]окси]-2-метилпропаннитрила способами стереоселективного окисления с последующей реакцией стереоспецифического иминирования.

Стадия 1. Получение энантиообогащенного 2-[[5-[(R)-этилсульфинил]-6-[3-метил-6-(трифторметил)имидазо[4,5-b]пиридин-2-ил]-3-пиридил]окси]-2-метилпропаннитрила (соединение (R)-SO9)



(Соединение (R)-SO9)

2-[[5-Этилсульфанил-6-[3-метил-6-(трифторметил)имидазо[4,5-*b*]пиридин-2-ил]-3-
 пиридил]окси]-2-метилпропаннитрил (полученный, как описано выше в примере P9,
 стадия 1) (300 мг, 0,680 ммоль), ацетилацетонат железа(III) (12,2 мг, 0,035 ммоль), 2-
 5 [(E)-[(1R)-1-(гидроксиметил)-2,2-диметилпропил]иминометил]-4,6-дифенол
 (полученный согласно Chem Eur J 2005, 11, 1086-1092) (37,1 мг, 0,068 ммоль) и 4-
 метоксибензойную кислоту (2,6 мг, 0,017 ммоль) растворяли в толуоле (2,7 мл).
 Раствор охлаждали до 0°C и добавляли пероксид водорода (30% водный раствор,
 0,139 мл, 1,36 ммоль). Реакционную смесь перемешивали при 0°C в течение 30 минут,
 10 затем нагревали до 10°C и перемешивали в течение ночи, после чего нагревали до
 комнатной температуры и перемешивали в течение дополнительных 6 часов. Затем
 реакцию смесь выливали в смесь этилацетата и водного раствора тиосульфата
 натрия, разделяли слои и экстрагировали водную фазу этилацетатом. Объединенные
 органические фазы промывали водой и 0,5 М водным раствором хлористоводородной
 15 кислоты, высушивали над сульфатом натрия и концентрировали *in vacuo*. Остаток
 очищали посредством колоночной флэш-хроматографии (диоксид кремния, этилацетат
 в циклогексане) с получением указанного в заголовке соединения.

LCMS (способ 6): масса/заряд 438 [M+H]⁺; время удерживания: 1,86 мин.

20 Энантиомерный избыток измеряли в соответствии со следующим способом.

Способ аналитической SFC

SFC: Waters Acquity UPC²/QDa

Детектор PDA Waters Acquity UPC²

Колонка: Daicel SFC CHIRALPAK[®] IG, 3 мкм, 0,46 см x 10 см, 40°C

25 Подвижная фаза: А: CO₂ В: EtOH изократический режим: 20% В за 4,8 мин.

ABPR: 1800 фунтов/кв. дюйм

Скорость потока: 2,0 мл/мин.

Обнаружение: при 310 нм

Концентрация образца: 1 мг/мл в MeOH/ACN 50/50

Объем впрыска: 1 мкл

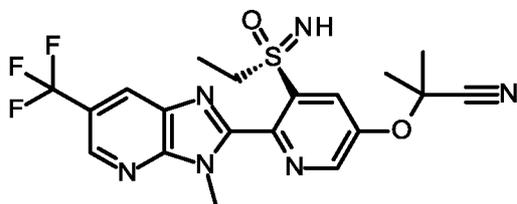
Результаты

Энантиомер (R)-SO9, который элюируется первым	Энантиомер (R)-SO9, который элюируется вторым
Время удерживания (мин.) ~2,37	Время удерживания (мин.) ~3,54
Химическая чистота (% площади при 310 нм) 92,4	Химическая чистота (% площади при 310 нм) 7,6
Энантиомерный избыток (%) 84,8	

- 5 Все хиральные сульфинильные соединения (R)-SO1 - (R)-SO19 с (R)-энантиомерной конфигурацией при атоме серы в таблице P(SO) или в энантиомерно обогащенной, или вплоть до чистой формы могут быть получены аналогично путем применения примера получения E1, стадии 1 (или его адаптации, известной специалисту в данной области) в отношении соответствующих сульфаниловых субстратов.

10

Стадия 2. Получение энантиообогащенного (R)-2-[[5-(этилсульфонимидоил)-6-[3-метил-6-(трифторметил)имидазо[4,5-b]пиридин-2-ил]-3-пиридил]окси]-2-метилпропаннитрила (соединение (R)-P9)



(Соединение (R)-P9)

- 15 Энантиообогащенный 2-[[5-[(R)-этилсульфинил]-6-[3-метил-6-(трифторметил)имидазо[4,5-b]пиридин-2-ил]-3-пиридил]окси]-2-метилпропаннитрил (соединение (R)-SO9, полученное, как описано выше) (219 мг, 0,482 ммоль) и фталоцианин железа(II) (6,39 мг, 0,011 ммоль) растворяли в дихлорметане (2 мл). Добавляли *O*-(4-нитробензоил)гидроксиламинтрифлатную кислоту (полученную
- 20 согласно Chem Eur J 2017,23 ,563-567) (326 мг, 0,981 ммоль) и смесь перемешивали при комнатной температуре в течение 1 часа. Добавляли этилацетат и 2 М водную хлористоводородную кислоту и реакционную смесь фильтровали через слой целита. Фильтрат разбавляли водой и экстрагировали этилацетатом. Органическую фазу промывали раствором бикарбоната натрия и соевым раствором, высушивали над

сульфатом натрия и концентрировали *in vacuo* с получением указанного в заголовке соединения.

LCMS (способ 6): масса/заряд 453 [M+H]⁺; время удерживания: 1,39 мин.

5 Энантиомерный избыток измеряли в соответствии со следующим способом.

Аналитическая SFC

SFC: Waters Acquity UPC²/QDa

Детектор PDA Waters Acquity UPC²

Колонка: Daicel SFC CHIRALPAK[®] IA, 3 мкм, 0,3 см x 10 см, 40°C

10 Подвижная фаза: А: CO₂ В: EtOH изократический режим: 10% В за 4,8 мин.

ABPR: 1800 фунтов/кв. дюйм

Скорость потока: 2,0 мл/мин.

Обнаружение: при 290 нм

Концентрация образца: 1 мг/мл в ACN

15 Объем впрыска: 1 мкл

Результаты

Энантиомер (R)-P9, который элюируется первым	Энантиомер (R)-P9, который элюируется вторым
Время удерживания (мин.) ~1,47	Время удерживания (мин.) ~1,88
Химическая чистота (% площади при 290 нм) 92,4	Химическая чистота (% площади при 290 нм) 7,6
Энантиомерный избыток (%) 84,8	

20 Основной энантиомер (R)-P9, который элюируется первым, соответствует соединению P9-A (таблица P(E)), полученному с помощью хирального разделения (пример P9 выше).

25 Все хиральные сульфоксиминовые соединения (R)-P1 - (R)-P19 с (R)-энантиомерной конфигурацией при атоме серы в таблице Y или в энантиомерно обогащенной, или вплоть до чистой формы могут быть получены аналогично путем применения примера получения E1, стадии 2 (или его адаптации, известной специалисту в данной области) в отношении соответствующих сульфинильных субстратов (R)-SO1 - (R)-SO19 в таблице P(SO).

Таблица P(SO):[§] Примеры (S)- или (R)-сульфинильных энантимеров формулы (III)

№	Название рацемата	Структуры	Конфигурация при атоме серы
(S)-SO1	2-[[6-[5-циклопропил-3-метил-4-оксо-6-(трифторметил)имидазо[4,5-с]пиридин-2-ил]-5-[(S)-этилсульфинил]-3-пиридил]окси]-2-метилпропаннитрил		S
(R)-SO1	2-[[6-[5-циклопропил-3-метил-4-оксо-6-(трифторметил)имидазо[4,5-с]пиридин-2-ил]-5-[(R)-этилсульфинил]-3-пиридил]окси]-2-метилпропаннитрил		R
(S)-SO2	1-[5-[(S)-этилсульфинил]-6-[7-метил-3-(трифторметил)имидазо[4,5-с]пиридазин-6-ил]-3-пиридил]циклопропанкарбонитрил		S
(R)-SO2	1-[5-[(R)-этилсульфинил]-6-[7-метил-3-(трифторметил)имидазо[4,5-с]пиридазин-6-ил]-3-пиридил]циклопропанкарбонитрил		R
(S)-SO3	2-[[5-[(S)-этилсульфинил]-6-[7-(трифторметил)имидазо[1,2-а]пиридин-2-ил]-3-пиридил]окси]-2-метилпропаннитрил		S
(R)-SO3	2-[[5-[(R)-этилсульфинил]-6-[7-(трифторметил)имидазо[1,2-а]пиридин-2-ил]-3-пиридил]окси]-2-метилпропаннитрил		R
(S)-SO4	2-[5-[(S)-этилсульфинил]-6-[3-метил-6-(трифторметил)имидазо[4,5-с]пиридин-2-ил]-3-пиридил]-2-метилпропаннитрил		S

№	Название рацемата	Структуры	Конфигурация при атоме серы
(R)-SO4	2-[5-[(R)-этилсульфинил]-6-[3-метил-6-(трифторметил)имидазо[4,5-с]пиридин-2-ил]-3-пиридил]-2-метилпропаннитрил		R
(S)-SO5	2-[[5-[(S)-этилсульфинил]-2-метил-6-[3-метил-6-(трифторметил)имидазо[4,5-b]пиридин-2-ил]-3-пиридил]окси]-2-метилпропаннитрил		S
(R)-SO5	2-[[5-[(R)-этилсульфинил]-2-метил-6-[3-метил-6-(трифторметил)имидазо[4,5-b]пиридин-2-ил]-3-пиридил]окси]-2-метилпропаннитрил		R
(S)-SO6	1-[3-[(S)-этилсульфинил]-4-[3-метил-6-(трифторметил)имидазо[4,5-b]пиридин-2-ил]фенил]циклопропанкарбонитрил		S
(R)-SO6	1-[3-[(R)-этилсульфинил]-4-[3-метил-6-(трифторметил)имидазо[4,5-b]пиридин-2-ил]фенил]циклопропанкарбонитрил		R
(S)-SO7	2-[[5-[(S)-этилсульфинил]-6-[7-(трифторметилсульфанил)имидазо[1,2-с]пиримидин-2-ил]-3-пиридил]окси]-2-метилпропаннитрил		S
(R)-SO7	2-[[5-[(R)-этилсульфинил]-6-[7-(трифторметилсульфанил)имидазо[1,2-с]пиримидин-2-ил]-3-пиридил]окси]-2-метилпропаннитрил		R
(S)-SO8	1-[5-[(S)-этилсульфинил]-6-[5-метокси-3-метил-4-оксо-6-(трифторметил)имидазо[4,5-с]пиридин-2-ил]-3-пиридил]циклопропанкарбонитрил		S

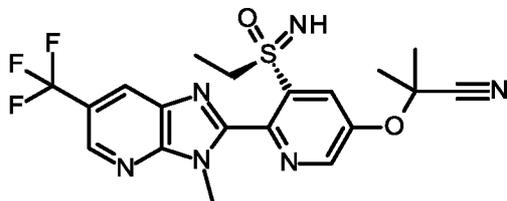
№	Название рацемата	Структуры	Конфигурация при атоме серы
(R)-SO8	1-[5-[(R)-этилсульфинил]-6-[5-метокси-3-метил-4-оксо-6-(трифторметил)имидазо[4,5-с]пиридин-2-ил]-3-пиридил]циклопропанкарбонитрил		R
(S)-SO9	2-[[5-[(S)-этилсульфинил]-6-[3-метил-6-(трифторметил)имидазо[4,5-b]пиридин-2-ил]-3-пиридил]окси]-2-метилпропаннитрил		S
(R)-SO9	2-[[5-[(R)-этилсульфинил]-6-[3-метил-6-(трифторметил)имидазо[4,5-b]пиридин-2-ил]-3-пиридил]окси]-2-метилпропаннитрил		R
(S)-SO10	1-[5-[(S)-этилсульфинил]-6-[3-метил-6-(трифторметил)имидазо[4,5-с]пиридин-2-ил]-3-пиридил]циклопропанкарбонитрил		S
(R)-SO10	1-[5-[(R)-этилсульфинил]-6-[3-метил-6-(трифторметил)имидазо[4,5-с]пиридин-2-ил]-3-пиридил]циклопропанкарбонитрил		R
(S)-SO11	2-[[5-[(S)-этилсульфинил]-6-[7-(трифторметил)имидазо[1,2-с]пиримидин-2-ил]-3-пиридил]окси]-2-метилпропаннитрил		S
(R)-SO11	2-[[5-[(R)-этилсульфинил]-6-[7-(трифторметил)имидазо[1,2-с]пиримидин-2-ил]-3-пиридил]окси]-2-метилпропаннитрил		R
(S)-SO12	2-[5-[(S)-этилсульфинил]-6-[3-метил-6-(трифторметил)имидазо[4,5-b]пиридин-2-ил]-3-пиридил]-2-метилпропаннитрил		S

№	Название рацемата	Структуры	Конфигурация при атоме серы
(R)-SO12	2-[5-[(R)-этилсульфинил]-6-[3-метил-6-(трифторметил)имидазо[4,5-b]пиридин-2-ил]-3-пиридил]-2-метилпропаннитрил		R
(S)-SO13	2-[[5-[(S)-этилсульфинил]-6-[3-метил-6-(трифторметил)имидазо[4,5-с]пиридин-2-ил]-3-пиридил]окси]-2-метилпропаннитрил		S
(R)-SO13	2-[[5-[(R)-этилсульфинил]-6-[3-метил-6-(трифторметил)имидазо[4,5-с]пиридин-2-ил]-3-пиридил]окси]-2-метилпропаннитрил		R
(S)-SO14	1-[6-[5-этил-3-метил-4-оксо-6-(трифторметил)имидазо[4,5-с]пиридин-2-ил]-5-[(S)-этилсульфинил]-3-пиридил]циклопропанкарбонитрил		S
(R)-SO14	1-[6-[5-этил-3-метил-4-оксо-6-(трифторметил)имидазо[4,5-с]пиридин-2-ил]-5-[(R)-этилсульфинил]-3-пиридил]циклопропанкарбонитрил		R
(S)-SO15	2-[[5-[(S)-этилсульфинил]-6-[7-метил-3-(трифторметил)имидазо[4,5-с]пиридазин-6-ил]-3-пиридил]окси]-2-метилпропаннитрил		S
(R)-SO15	2-[[5-[(R)-этилсульфинил]-6-[7-метил-3-(трифторметил)имидазо[4,5-с]пиридазин-6-ил]-3-пиридил]окси]-2-метилпропаннитрил		R
(S)-SO16	1-[5-[(S)-этилсульфинил]-6-[3-метил-6-(трифторметил)имидазо[4,5-b]пиридин-2-ил]-3-пиридил]циклопропанкарбонитрил		S

№	Название рацемата	Структуры	Конфигурация при атоме серы
(R)-SO16	1-[5-[(R)-этилсульфинил]-6-[3-метил-6-(трифторметил)имидазо[4,5-b]пиридин-2-ил]-3-пиридил]циклопропанкарбонитрил		R
(S)-SO17	2-[[5-[(S)-этилсульфинил]-2-метил-6-[3-метил-6-(трифторметил)имидазо[4,5-c]пиридин-2-ил]-3-пиридил]окси]-2-метилпропаннитрил		S
(R)-SO17	2-[[5-[(R)-этилсульфинил]-2-метил-6-[3-метил-6-(трифторметил)имидазо[4,5-c]пиридин-2-ил]-3-пиридил]окси]-2-метилпропаннитрил		R
(S)-SO18	1-[3-[(S)-этилсульфинил]-4-[3-метил-6-(трифторметил)имидазо[4,5-c]пиридин-2-ил]фенил]циклопропанкарбонитрил		S
(R)-SO18	1-[3-[(R)-этилсульфинил]-4-[3-метил-6-(трифторметил)имидазо[4,5-c]пиридин-2-ил]фенил]циклопропанкарбонитрил		R
(S)-SO19	2-[[6-[5-этил-3-метил-4-оксо-6-(трифторметил)имидазо[4,5-c]пиридин-2-ил]-5-[(S)-этилсульфинил]-3-пиридил]окси]-2-метилпропаннитрил		S
(R)-SO19	2-[[6-[5-этил-3-метил-4-оксо-6-(трифторметил)имидазо[4,5-c]пиридин-2-ил]-5-[(R)-этилсульфинил]-3-пиридил]окси]-2-метилпропаннитрил		R

§ В таблице P(SO) и в примерах получения E1 и E2 радикал " —: ", присоединенный к атому серы, обозначает его неподеленную пару электронов.

ПРИМЕР E2. Получение (S)-2-[[5-(этилсульфонимидоил)-6-[3-метил-6-(трифторметил)имидазо[4,5-b]пиридин-2-ил]-3-пиридил]окси]-2-метилпропаннитрила (соединение (S)-P9)



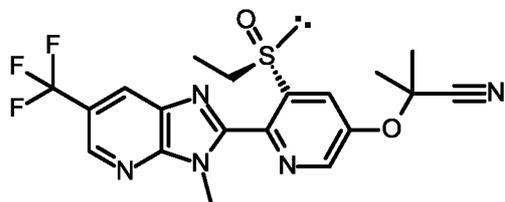
(Соединение (S)-P9)

5

Соединение (S)-P9 в энантимерно обогащенной форме (основной (S)-стереоизомер с абсолютной конфигурацией, изображенной на рисунке) получали с помощью аналогичного способа с применением противоположного энантиомера хирального лиганда во время образования сульфоксида (пример E1, стадия 1).

10

Стадия 1. Получение энантиобогащенного 2-[[5-[(S)-этилсульфинил]-6-[3-метил-6-(трифторметил)имидазо[4,5-b]пиридин-2-ил]-3-пиридил]окси]-2-метилпропаннитрила (соединение (S)-SO9)



(Соединение (S)-SO9)

15 Соединение (S)-SO9 получали из 2-[[5-этилсульфанил-6-[3-метил-6-(трифторметил)имидазо[4,5-b]пиридин-2-ил]-3-пиридил]окси]-2-метилпропаннитрила посредством процедуры, аналогичной примеру E1, стадии 1, с заменой 2-[(E)-[(1R)-1-(гидроксиметил)-2,2-диметилпропил]иминометил]-4,6-дйодфенола на 2-[(E)-[(1S)-1-(гидроксиметил)-2,2-диметилпропил]иминометил]-4,6-дйодфенол.

20 LCMS (способ 6): масса/заряд 438 [M+H]⁺; время удерживания: 1,87 мин.

Энантиомерный избыток измеряли в соответствии со следующим способом.

Способ аналитической SFC

SFC: Waters Acquity UPC²/QDa

25 Детектор PDA Waters Acquity UPC²

Колонка: Daicel SFC CHIRALPAK® IG, 3 мкм, 0,46 см x 10 см, 40°C

Подвижная фаза: А: CO₂ В: EtOH изократический режим: 20% В за 4,8 мин.

ABPR: 1800 фунтов/кв. дюйм

Скорость потока: 2,0 мл/мин.

5 Обнаружение: при 310 нм

Концентрация образца: 1 мг/мл в MeOH/ACN 50/50

Объем впрыска: 1 мкл

Результаты

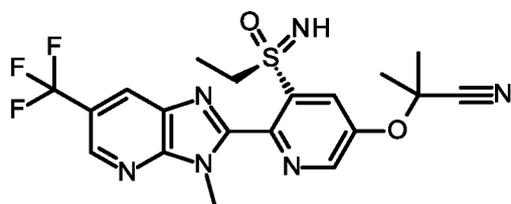
Энантиомер (R)-SO9, который элюируется первым	Энантиомер (R)-SO9, который элюируется вторым
Время удерживания (мин.) ~2,36	Время удерживания (мин.) ~3,53
Химическая чистота (% площади при 310 нм) 5,9	Химическая чистота (% площади при 310 нм) 94,1
Энантиомерный избыток (%) 88,2	

10

Все хиральные сульфинильные соединения (S)-SO1 - (S)-SO19 с (S)-энантиомерной конфигурацией при атоме серы в таблице P(SO) или в энантиомерно обогащенной, или вплоть до чистой формы могут быть получены аналогично путем применения примера получения E2, стадии 1 (или его адаптации, известной специалисту в данной области) в отношении соответствующих сульфаниловых субстратов.

15

Стадия 2. Получение энантиобогащенного (S)-2-[[5-(этилсульфонимидоил)-6-[3-метил-6-(трифторметил)имидазо[4,5-b]пиридин-2-ил]-3-пиридил]окси]-2-метилпропаннитрила (соединение (S)-P9)



20

(Соединение (S)-P9)

Соединение (S)-P9 получали из энантиобогащенного 2-[[5-[(S)-этилсульфинил]-6-[3-метил-6-(трифторметил)имидазо[4,5-b]пиридин-2-ил]-3-пиридил]окси]-2-метилпропаннитрила (соединение (S)-SO9, полученное, как описано выше) с помощью процедуры, аналогичной примеру E1, стадии 2.

25 LCMS (способ 6): масса/заряд 453 [M+H]⁺; время удерживания: 1,39 мин.

Энантиомерный избыток измеряли в соответствии со следующим способом.

Аналитическая SFC

SFC: Waters Acquity UPC²/QDa

5 Детектор PDA Waters Acquity UPC²

Колонка: Daicel SFC CHIRALPAK[®] IA, 3 мкм, 0,3 см x 10 см, 40°C

Подвижная фаза: А: CO₂ В: EtOH изократический режим: 10% В за 4,8 мин.

ABPR: 1800 фунтов/кв. дюйм

Скорость потока: 2,0 мл/мин.

10 Обнаружение: при 290 нм

Концентрация образца: 1 мг/мл в ACN

Объем впрыска: 1 мкл

Результаты

Энантиомер (R)-P9, который элюируется первым	Энантиомер (R)-P9, который элюируется вторым
Время удерживания (мин.) ~1,49	Время удерживания (мин.) ~1,88
Химическая чистота (площадь, %, при 290 нм) 5,6	Химическая чистота (площадь, %, при 290 нм) 94,4
Энантиомерный избыток (%) 88,8	

15

Основной энантиомер (S)-P9, который элюируется вторым, соответствует соединению P9-B (таблица P(E)), полученному с помощью хирального разделения (пример P9 выше).

20 Все хиральные сульфоксиминовые соединения (S)-P1 - (S)-P19 с (S)-энантиомерной конфигурацией при атоме серы в таблице Y или в энантиомерно обогащенной, или вплоть до чистой формы могут быть получены аналогично путем применения примера получения E2, стадии 2 (или его адаптации, известной специалисту в данной области) в отношении соответствующих сульфинильных субстратов (S)-SO1 - (S)-SO19 в таблице P(SO).

25

Предпочтительными являются следующие смеси соединений формулы I с активными ингредиентами (сокращение "ТХ" означает "одно соединение, выбранное из группы,

состоящей из соединений, описанных в таблицах А-1 - А-20, таблицах В-1 - В-20, таблице Y, таблице Z и таблице Р(Е) настоящего изобретения"):

вспомогательное вещество, выбранное из группы веществ, состоящей из нефтяных масел (альтернативное название) (628) + ТХ;

- 5 абамектина + ТХ, ацеквиноцила + ТХ, ацетамиприда + ТХ, ацетопрола + ТХ, акринатрина + ТХ, ацинонапира + ТХ, афидопиропена + ТХ, афоксоланера + ТХ, аланикарба + ТХ, аллетрина + ТХ, альфа-циперметрина + ТХ, альфаметрина + ТХ, амидофлумета + ТХ, аминокарба + ТХ, азоциклотина + ТХ, бенсултапа + ТХ, бензоксимата + ТХ, бензпиримоксана + ТХ, бетацифлутрина + ТХ, бета-циперметрина
- 10 + ТХ, бифеназата + ТХ, бифентрина + ТХ, бинапакрила + ТХ, биоаллетрина + ТХ, S-биоаллетрина + ТХ, биоресметрина + ТХ, бистрифлурона + ТХ, брофланилида + ТХ, брофлутрината + ТХ, бромфос-этила + ТХ, бупрофезина + ТХ, бутокарбоксима + ТХ, кадусафоса + ТХ, карбарила + ТХ, карбосульфана + ТХ, картапа + ТХ, номер CAS: 1632218-00-8 + ТХ, номер CAS: 1808115-49-2 + ТХ, номер CAS: 2032403-97-5 + ТХ,
- 15 номер CAS: 2044701-44-0 + ТХ, номер CAS: 2128706-05-6 + ТХ, номер CAS: 2095470-94-1 + ТХ, номер CAS: 2377084-09-6 + ТХ, номер CAS: 1445683-71-5 + ТХ, номер CAS: 2408220-94-8 + ТХ, номер CAS: 2408220-91-5 + ТХ, номер CAS: 1365070-72-9 + ТХ, номер CAS: 2171099-09-3 + ТХ, номер CAS: 2396747-83-2 + ТХ, номер CAS: 2133042-31-4 + ТХ, номер CAS: 2133042-44-9 + ТХ, номер CAS: 1445684-82-1 + ТХ, номер CAS:
- 20 1445684-82-1 + ТХ, номер CAS: 1922957-45-6 + ТХ, номер CAS: 1922957-46-7 + ТХ, номер CAS: 1922957-47-8 + ТХ, номер CAS: 1922957-48-9 + ТХ, номер CAS: 2415706-16-8 + ТХ, номер CAS: 1594624-87-9 + ТХ, номер CAS: 1594637-65-6 + ТХ, номер CAS: 1594626-19-3 + ТХ, номер CAS: 1990457-52-7 + ТХ, номер CAS: 1990457-55-0 + ТХ, номер CAS: 1990457-57-2 + ТХ, номер CAS: 1990457-77-6 + ТХ, номер CAS:
- 25 1990457-66-3 + ТХ, номер CAS: 1990457-85-6 + ТХ, номер CAS: 2220132-55-6 + ТХ, номер CAS: 1255091-74-7 + ТХ, номер CAS: РНК (специфической в отношении *Leptinotarsa decemlineata* рекомбинантной двухнитевой интерферирующей GS2) + ТХ, номер CAS: 2719848-60-7 + ТХ, номер CAS: 1956329-03-5 + ТХ, хлорантранилипрола + ТХ, хлордана + ТХ, хлорфенапира + ТХ, хлоропраллетрина + ТХ, кромафенозида +
- 30 ТХ, кленпирина + ТХ, клоэтокарба + ТХ, клотианидина + ТХ, 2-хлорфенил-N-метилкарбамата (СРМС) + ТХ, цианофенфоса + ТХ, циантранилипрола + ТХ, цикланилипрола + ТХ, циклобуттрифлурама + ТХ, циклопротрина + ТХ, циклоксаприда + ТХ, циенопирафена + ТХ, циетпирафена (или етпирафена) + ТХ, цифлуметофена +

ТХ, цифлутрина + ТХ, цигалодиамида + ТХ, цигалотрина + ТХ, циперметрина + ТХ,
 цифенотрина + ТХ, ципрофланилида + ТХ, циромазина + ТХ, дельтаметрина + ТХ,
 диафентиурона + ТХ, диалифоса + ТХ, диброма + ТХ, дихлоромезотиаза + ТХ,
 дифловидазина + ТХ, дифлубензурана + ТХ, димпропиридаза + ТХ, динактина + ТХ,
 5 динокапа + ТХ, динотефурана + ТХ, диоксабензофоса + ТХ, эмаектина (или
 эмаектина бензоата) + ТХ, эмпентрина + ТХ, эпсилон-момфлуоротрина + ТХ,
 эпсилон-метофлутрина + ТХ, эсфенвалерата + ТХ, этиона + ТХ, этипрола + ТХ,
 этофенпрокса + ТХ, этоксазола + ТХ, фамфура + ТХ, феназаквина + ТХ, фенфлутрина
 + ТХ, , фенмезодитиаза + ТХ, фенитротиона + ТХ, фенобукарба + ТХ, фенотиокарба +
 10 ТХ, феноксикарба + ТХ, фенпропатрина + ТХ, фенпироксимата + ТХ, фенсульфотиона
 + ТХ, фентиона + ТХ, фентинацетата + ТХ, фенвалерата + ТХ, фипронила + ТХ,
 флометоквина + ТХ, флоникамида + ТХ, флаукрипирима + ТХ, флаузаиндолизина +
 ТХ, флазурана + ТХ, флаубендиамида + ТХ, флаубензимиона + ТХ, флахлординилипрола
 + ТХ, флауцитрината + ТХ, флауциклоксурона + ТХ, флауцитрината + ТХ,
 15 флауенсульфона + ТХ, флауфенерима + ТХ, флауфенпрокса + ТХ, флауфипрола + ТХ,
 флаугексафона + ТХ, флауметрина + ТХ, флауопирама + ТХ, флаупентиофенокса + ТХ,
 флаупирадифурана + ТХ, флаупиримиона + ТХ, флаураланера + ТХ, флаувалината + ТХ,
 флауксаметамида + ТХ, флаустиазата + ТХ, гамма-цигалотрина + ТХ, гуадипира + ТХ,
 галофенозида + ТХ, галфенпрокса + ТХ, гептафлутрина + ТХ, гекситиазокса + ТХ,
 20 гидраметилнона + ТХ, имициафоса + ТХ, имидаклоприда + ТХ, имипротрина + ТХ,
 индазапироксамета + ТХ, индоксакарба + ТХ, йодметана + ТХ, ипродиона + ТХ,
 изоциклосоерама + ТХ, изотиоата + ТХ, ивермектина + ТХ, каппа-бифентрина + ТХ,
 каппа-тефлутрина + ТХ, лямбда-цигалотрина + ТХ, лепимектина + ТХ, лотиланера +
 ТХ, люфенурана + ТХ, метафлумизона + ТХ, метальдегида + ТХ, метама + ТХ,
 25 метомила + ТХ, метоксифенозида + ТХ, метофлутрина + ТХ, метолкарба + ТХ,
 мексакарбата + ТХ, милбемектина + ТХ, момфлуоротрина + ТХ, никлосамида + ТХ,
 никофлупрола + ТХ; нитенпирама + ТХ, нитиазина + ТХ, ометоата + ТХ, оксамила +
 ТХ, оксазосульфила + ТХ, паратион-этила + ТХ, перметрина + ТХ, фенотрина + ТХ,
 фосфокарба + ТХ, пиперонилбутоксидата + ТХ, пиримикарба + ТХ, пиримифос-этила +
 30 ТХ, пиримифос-метила + ТХ, вируса полиэдроза + ТХ, праллетрина + ТХ, профенофоса
 + ТХ, профлутрина + ТХ, пропаргита + ТХ, пропетамфоса + ТХ, пропрокса + ТХ,
 протиофоса + ТХ, протрифенбута + ТХ, пифлубумида + ТХ, пиметрозина + ТХ,
 пираклофоса + ТХ, пирафлупрола + ТХ, пиридабена + ТХ, пиридалила + ТХ,

пирифлуквиназона + ТХ, пиримидифена + ТХ, пириминостробина + ТХ, пирипрола + ТХ, пирипроксифена + ТХ, ресметрина + ТХ, сароланера + ТХ, селамектина + ТХ, силафлуофена + ТХ, спинеторама + ТХ, спиносада + ТХ, спиробудифена + ТХ; спиродиклофена + ТХ, спиромезифена + ТХ, спиропидиона + ТХ, спиротетрамата + ТХ, спидоксамата + ТХ, сульфоксафлора + ТХ, тебуфенозида + ТХ, тебуфенпирада + ТХ, тебупиримифоса + ТХ, тефлутрина + ТХ, темефоса + ТХ, тетрахлорантранилипрола + ТХ, тетрадифона + ТХ, тетраметрина + ТХ, тетраметилфлутрина + ТХ, тетранактина + ТХ, тетранилипрола + ТХ, тета-циперметрина + ТХ, тиаклоприда + ТХ, тиаметоксама + ТХ, тиоциклама + ТХ, тиодикарба + ТХ, тиофанокса + ТХ, тиометона + ТХ, тиосултапа + ТХ, тиголанера + ТХ, тиорантранилипрола + ТХ; тиоксазафена + ТХ, толфенпирада + ТХ, токсафена + ТХ, тралометрина + ТХ, трансфлутрина + ТХ, триазамата + ТХ, триазофоса + ТХ, трихлорфона + ТХ, трихлорната + ТХ, трихлорфона + ТХ, трифлуенфуроната + ТХ, трифлумезопирима + ТХ, тиклопиразофлора + ТХ, дзета-циперметрина + ТХ, экстракта морских водорослей и продукта ферментации, полученного из мелассы + ТХ, экстракта морских водорослей и продукта ферментации, полученного из мелассы, содержащего мочевины + ТХ, аминокислот + ТХ, калия, и молибдена, и EDTA-хелата марганца + ТХ, экстракта морских водорослей и ферментированных продуктов растительного происхождения + ТХ, экстракта морских водорослей и ферментированных продуктов растительного происхождения, содержащий регуляторы роста растений + ТХ, витаминов + ТХ, EDTA-хелата меди + ТХ, цинка + ТХ и железа + ТХ, азадирахтина + ТХ, *Bacillus aizawai* + ТХ, *Bacillus chitinosporus* AQ746 (номер доступа в NRRL B-21618) + ТХ, *Bacillus firmus* + ТХ, *Bacillus kurstaki* + ТХ, *Bacillus mycoides* AQ726 (номер доступа в NRRL B-21664) + ТХ, *Bacillus pumilus* (номер доступа в NRRL B-30087) + ТХ, *Bacillus pumilus* AQ717 (номер доступа в NRRL B-21662) + ТХ, *Bacillus sp.* AQ178 (номер доступа в ATCC 53522) + ТХ, *Bacillus sp.* AQ175 (номер доступа в ATCC 55608) + ТХ, *Bacillus sp.* AQ177 (номер доступа в ATCC 55609) + ТХ, *Bacillus subtilis* неуточненный + ТХ, *Bacillus subtilis* AQ153 (номер доступа в ATCC 55614) + ТХ, *Bacillus subtilis* AQ30002 (номер доступа в NRRL B-50421) + ТХ, *Bacillus subtilis* AQ30004 (номер доступа в NRRL B-50455) + ТХ, *Bacillus subtilis* AQ713 (номер доступа в NRRL B-21661) + ТХ, *Bacillus subtilis* AQ743 (номер доступа в NRRL B-21665) + ТХ, *Bacillus thuringiensis* AQ52 (номер доступа в NRRL B-21619) + ТХ, *Bacillus thuringiensis* BD#32 (номер доступа в NRRL B-21530) + ТХ, *Bacillus*

thuringiensis subspec. kurstaki BMP 123 + TX, Beauveria bassiana + TX, D-лимонена + TX, Granulovirus + TX, гарпина + TX, вируса ядерного полиэдроза Helicoverpa armigera + TX, вируса ядерного полиэдроза Helicoverpa zea + TX, вируса ядерного полиэдроза Heliothis virescens + TX, вируса ядерного полиэдроза Heliothis punctigera + TX, 5 Metarhizium spp. + TX, Muscodor albus 620 (номер доступа в NRRL 30547) + TX, Muscodor roseus A3-5 (номер доступа в NRRL 30548) + TX, продуктов на основе мелии индийской + TX, Paecilomyces fumosoroseus + TX, Paecilomyces lilacinus + TX, Pasteuria nishizawae + TX, Pasteuria penetrans + TX, Pasteuria ramosa + TX, Pasteuria thornei + TX, Pasteuria usgae + TX, п-цимола + TX, вируса гранулеза Plutella xylostella + TX, вируса ядерного полиэдроза Plutella xylostella + TX, вируса полиэдроза + TX, пиретрума + TX, QRD 420 (смеси терпеноидов) + TX, QRD 452 (смеси терпеноидов) + TX, QRD 460 (смеси терпеноидов) + TX, Quillaja saponaria + TX, Rhodococcus globerulus AQ719 (номер доступа в NRRL B-21663) + TX, вируса ядерного полиэдроза Spodoptera frugiperda + TX, Streptomyces galbus (номер доступа в NRRL 30232) + TX, Streptomyces 15 sp. (номер доступа в NRRL B-30145) + TX, смеси терпеноидов + TX и Verticillium spp. + TX;

альгицид, выбранный из группы веществ, состоящей из бетоксазина [CCN] + TX, диоктаноата меди (название согласно IUPAC) (170) + TX, сульфата меди (172) + TX, 20 цибутрина [CCN] + TX, дихлона (1052) + TX, дихлорофена (232) + TX, эндотала (295) + TX, фентина (347) + TX, гашеной извести [CCN] + TX, набама (566) + TX, квинокламина (714) + TX, квиноамида (1379) + TX, симазина (730) + TX, ацетата трифенилолова (название согласно IUPAC) (347) и гидроксида трифенилолова (название согласно IUPAC) (347) + TX;

антигельминтное средство, выбранное из группы веществ, состоящей из абамектина (1) 25 + TX, круфомата (1011) + TX, циклобутрифлурама + TX, дорамектина (альтернативное название) [CCN] + TX, эмаектина (291) + TX, эмаектина бензоата (291) + TX, эприномектина (альтернативное название) [CCN] + TX, ивермектина (альтернативное название) [CCN] + TX, милбемицин-оксима (альтернативное название) [CCN] + TX, моксидектина (альтернативное название) [CCN] + TX, 30 пиперазина [CCN] + TX, селамектина (альтернативное название) [CCN] + TX, спиносада (737) и тиофаната (1435) + TX;

авицид, выбранный из группы веществ, состоящей из хлоралозы (127) + TX, эндрина (1122) + TX, фентиона (346) + TX, пиридин-4-амин (название согласно IUPAC) (23) и стрихнина (745) + TX;

5 бактерицид, выбранный из группы веществ, состоящей из 1-гидрокси-1*H*-пиридин-2-тиона (название согласно IUPAC) (1222) + TX, 4-(хиноксалин-2-иламино)бензолсульфонамида (название согласно IUPAC) (748) + TX, 8-гидроксихинолина сульфата (446) + TX, бронопола (97) + TX, диоктаноата меди (название согласно IUPAC) (170) + TX, гидроксида меди (название согласно IUPAC) (169) + TX, крезола [CCN] + TX, дихлорофена (232) + TX, дипиритиона (1105) + TX, 10 додицина (1112) + TX, фенаминосульфа (1144) + TX, формальдегида (404) + TX, гидраргафена (альтернативное название) [CCN] + TX, касугамицина (483) + TX, гидрата касугамицина гидрохлорида (483) + TX, бис(диметилдитиокарбамата) никеля (название согласно IUPAC) (1308) + TX, нитрапирина (580) + TX, октилинона (590) + TX, оксолиновой кислоты (606) + TX, окситетрациклина (611) + TX, 15 гидроксихинолинсульфата калия (446) + TX, пробеназола (658) + TX, стрептомицина (744) + TX, стрептомицина сесквисульфата (744) + TX, теклофталама (766) + TX и тиомерсала (альтернативное название) [CCN] + TX;

биологическое средство, выбранное из группы веществ, состоящей из *Adoxophyes orana* GV (альтернативное название) (12) + TX, *Agrobacterium radiobacter* (альтернативное 20 название) (13) + TX, *Amblyseius* spp. (альтернативное название) (19) + TX, *Anagrapha falcifera* NPV (альтернативное название) (28) + TX, *Anagrus atomus* (альтернативное название) (29) + TX, *Aphelinus abdominalis* (альтернативное название) (33) + TX, *Aphidius colemani* (альтернативное название) (34) + TX, *Aphidoletes aphidimyza* (альтернативное название) (35) + TX, *Autographa californica* NPV (альтернативное 25 название) (38) + TX, *Bacillus firmus* (альтернативное название) (48) + TX, *Bacillus sphaericus* Neide (научное название) (49) + TX, *Bacillus thuringiensis* Berliner (научное название) (51) + TX, *Bacillus thuringiensis* подвид *aizawai* (научное название) (51) + TX, *Bacillus thuringiensis* подвид *israelensis* (научное название) (51) + TX, *Bacillus thuringiensis* подвид *japonensis* (научное название) (51) + TX, *Bacillus thuringiensis* подвид *kurstaki* (научное название) (51) + TX, *Bacillus thuringiensis* подвид *tenebrionis* (научное название) (51) + TX, *Beauveria bassiana* (альтернативное название) (53) + TX, *Beauveria brongniartii* (альтернативное название) (54) + TX, *Chrysoperla carnea* (альтернативное название) (151) + TX, *Cryptolaemus montrouzieri* (альтернативное 30 название) (151) + TX;

- название) (178) + TX, *Cydia pomonella* GV (альтернативное название) (191) + TX, *Dacnusa sibirica* (альтернативное название) (212) + TX, *Diglyphus isaea* (альтернативное название) (254) + TX, *Encarsia formosa* (научное название) (293) + TX, *Eretmocerus eremicus* (альтернативное название) (300) + TX, *Helicoverpa zea* NPV (альтернативное название) (431) + TX, *Heterorhabditis bacteriophora* и *H. megidis* (альтернативное название) (433) + TX, *Hippodamia convergens* (альтернативное название) (442) + TX, *Leptomastix dactylopii* (альтернативное название) (488) + TX, *Macrolophus caliginosus* (альтернативное название) (491) + TX, *Mamestra brassicae* NPV (альтернативное название) (494) + TX, *Metaphycus helvolus* (альтернативное название) (522) + TX, *Metarhizium anisopliae* разновидность *acridum* (научное название) (523) + TX, *Metarhizium anisopliae* разновидность *anisopliae* (научное название) (523) + TX, *Neodiprion sertifer* NPV и *N. lecontei* NPV (альтернативное название) (575) + TX, *Orius* spp. (альтернативное название) (596) + TX, *Paecilomyces fumosoroseus* (альтернативное название) (613) + TX, *Phytoseiulus persimilis* (альтернативное название) (644) + TX, мультикапсидный вирус ядерного полиэдроза *Spodoptera exigua* (научное название) (741) + TX, *Steinernema bibionis* (альтернативное название) (742) + TX, *Steinernema carpocapsae* (альтернативное название) (742) + TX, *Steinernema feltiae* (альтернативное название) (742) + TX, *Steinernema glaseri* (альтернативное название) (742) + TX, *Steinernema riobrave* (альтернативное название) (742) + TX, *Steinernema riobravense* (альтернативное название) (742) + TX, *Steinernema scapterisci* (альтернативное название) (742) + TX, *Steinernema* spp. (альтернативное название) (742) + TX, *Trichogramma* spp. (альтернативное название) (826) + TX, *Typhlodromus occidentalis* (альтернативное название) (844) и *Verticillium lecanii* (альтернативное название) (848) + TX;
- 25 стерилизатор почвы, выбранный из группы веществ, состоящей из йодметана (название согласно IUPAC) (542) и метилбромидом (537) + TX;
- хемотристерилизатор, выбранный из группы веществ, состоящей из афолата [CCN] + TX, бисазира (альтернативное название) [CCN] + TX, бусульфана (альтернативное название) [CCN] + TX, дифлубензурана (250) + TX, диматифа (альтернативное название) [CCN] + TX, хемела [CCN] + TX, хемпы [CCN] + TX, метепы [CCN] + TX, метиотепы [CCN] + TX, метилафолата [CCN] + TX, морзида [CCN] + TX, пенфлурана (альтернативное название) [CCN] + TX, тепы [CCN] + TX, тиохемпы (альтернативное название) [CCN] + TX, тиотепы (альтернативное название) [CCN] +

ТХ, третамина (альтернативное название) [CCN] и уредепы (альтернативное название) [CCN] + ТХ;

феромон насекомых, выбранный из группы веществ, состоящей из (*E*)-дец-5-ен-1-илацетата с (*E*)-дец-5-ен-1-олом (название согласно IUPAC) (222) + ТХ, (*E*)-тридец-4-ен-1-илацетата (название согласно IUPAC) (829) + ТХ, (*E*)-6-метилгепт-2-ен-4-ола (название согласно IUPAC) (541) + ТХ, (*E,Z*)-тетрадека-4,10-диен-1-илацетата (название согласно IUPAC) (779) + ТХ, (*Z*)-додец-7-ен-1-илацетата (название согласно IUPAC) (285) + ТХ, (*Z*)-гексадец-11-ен-1-илацетата (название согласно IUPAC) (436) + ТХ, (*Z*)-гексадец-11-ен-1-илацетата (название согласно IUPAC) (437) + ТХ, (*Z*)-гексадец-13-ен-11-ин-1-илацетата (название согласно IUPAC) (438) + ТХ, (*Z*)-эйкоз-13-ен-10-она (название согласно IUPAC) (448) + ТХ, (*Z*)-тетрадец-7-ен-1-ола (название согласно IUPAC) (782) + ТХ, (*Z*)-тетрадец-9-ен-1-ола (название согласно IUPAC) (783) + ТХ, (*Z*)-тетрадец-9-ен-1-илацетата (название согласно IUPAC) (784) + ТХ, (*7E,9Z*)-додека-7,9-диен-1-илацетата (название согласно IUPAC) (283) + ТХ, (*9Z,11E*)-тетрадека-9,11-диен-1-илацетата (название согласно IUPAC) (780) + ТХ, (*9Z,12E*)-тетрадека-9,12-диен-1-илацетата (название согласно IUPAC) (781) + ТХ, 14-метилоктадец-1-ена (название согласно IUPAC) (545) + ТХ, 4-метилнонан-5-ола с 4-метилнонан-5-оном (название согласно IUPAC) (544) + ТХ, альфа-мултистриатина (альтернативное название) [CCN] + ТХ, бревикомина (альтернативное название) [CCN] + ТХ, кодлелура (альтернативное название) [CCN] + ТХ, кодлемона (альтернативное название) (167) + ТХ, куелура (альтернативное название) (179) + ТХ, диспарлура (277) + ТХ, додец-8-ен-1-илацетата (название согласно IUPAC) (286) + ТХ, додец-9-ен-1-илацетата (название согласно IUPAC) (287) + ТХ, додека-8 + ТХ, 10-диен-1-илацетата (название согласно IUPAC) (284) + ТХ, доминикалура (альтернативное название) [CCN] + ТХ, этил-4-метилоктаноата (название согласно IUPAC) (317) + ТХ, эвгенола (альтернативное название) [CCN] + ТХ, фронталина (альтернативное название) [CCN] + ТХ, Gossypluge® (альтернативное название; смесь 1:1 (*Z,E*)- и (*Z,Z*)-изомеров гексадека-7,11-диен-1-илацетата) (420) + ТХ, грандлура (421) + ТХ, грандлура I (альтернативное название) (421) + ТХ, грандлура II (альтернативное название) (421) + ТХ, грандлура III (альтернативное название) (421) + ТХ, грандлура IV (альтернативное название) (421) + ТХ, гексалура [CCN] + ТХ, ипсдиенола (альтернативное название) [CCN] + ТХ, ипсенола (альтернативное название) [CCN] + ТХ, япониллура (альтернативное название) (481) + ТХ, линеатина (альтернативное

название) [CCN] + TX, литлура (альтернативное название) [CCN] + TX, луплура (альтернативное название) [CCN] + TX, медлура [CCN] + TX, мегатомоевой кислоты (альтернативное название) [CCN] + TX, метилэвгенола (альтернативное название) (540) + TX, мускалура (563) + TX, октадека-2,13-диен-1-илацетата (название согласно IUPAC) (588) + TX, октадека-3,13-диен-1-илацетата (название согласно IUPAC) (589) + TX, орфралура (альтернативное название) [CCN] + TX, орикталура (альтернативное название) (317) + TX, острамона (альтернативное название) [CCN] + TX, сиглура [CCN] + TX, соридина (альтернативное название) (736) + TX, сулкатола (альтернативное название) [CCN] + TX, тетрадец-11-ен-1-илацетата (название согласно IUPAC) (785) + TX, тримедлура (839) + TX, тримедлура А (альтернативное название) (839) + TX, тримедлура В₁ (альтернативное название) (839) + TX, тримедлура В₂ (альтернативное название) (839) + TX, тримедлура С (альтернативное название) (839) и транк-кола (альтернативное название) [CCN] + TX; средство для отпугивания насекомых, выбранное из группы веществ, состоящей из 2- (октилтио)этанола (название согласно IUPAC) (591) + TX, бутопириноксила (933) + TX, бутокси(полипропиленгликоля) (936) + TX, дибутиладипата (название согласно IUPAC) (1046) + TX, дибутилфталата (1047) + TX, дибутилсукцината (название согласно IUPAC) (1048) + TX, диэтилтолуамида [CCN] + TX, диметилкарбата [CCN] + TX, диметилфталата [CCN] + TX, этилгександиола (1137) + TX, гексамида [CCN] + TX, метоквин-бутила (1276) + TX, метилнеодеканамида [CCN] + TX, оксамата [CCN] и пикаридина [CCN] + TX;

моллюскоцид, выбранный из группы веществ, состоящей из оксида бис(трибутилолова) (название согласно IUPAC) (913) + TX, бромацетамида [CCN] + TX, арсената кальция [CCN] + TX, клоэтокарба (999) + TX, ацетоарсенита меди [CCN] + TX, сульфата меди (172) + TX, фентина (347) + TX, фосфата железа(III) (название согласно IUPAC) (352) + TX, метальдегида (518) + TX, метиокарба (530) + TX, никлозамида (576) + TX, никлозамид-оламина (576) + TX, пентахлорфенола (623) + TX, пентахлорфеноксида натрия (623) + TX, тазимкарба (1412) + TX, тиодикарба (799) + TX, оксида трибутилолова (913) + TX, трифенморфа (1454) + TX, триметакарба (840) + TX, ацетата трифенилолова (название согласно IUPAC) (347) и гидроксида трифенилолова (название согласно IUPAC) (347) + TX, пирипрола [394730-71-3] + TX;

нематодид, выбранный из группы веществ, состоящей из АКD-3088 (код соединения) + TX, 1,2-дибром-3-хлорпропана (название согласно IUPAC/Химической реферативной службе) (1045) + TX, 1,2-дихлорпропана (название согласно IUPAC/Химической реферативной службе) (1062) + TX, 1,2-дихлорпропана с 1,3-дихлорпропеном (название согласно IUPAC) (1063) + TX, 1,3-дихлорпропена (233) + TX, 3,4-дихлортетрагидротиофена 1,1-диоксида (название согласно IUPAC/Химической реферативной службе) (1065) + TX, 3-(4-хлорфенил)-5-метилроданина (название согласно IUPAC) (980) + TX, 5-метил-6-тиоксо-1,3,5-тиадиазиан-3-илуксусной кислоты (название согласно IUPAC) (1286) + TX, 6-изопентениламинопурина (альтернативное название) (210) + TX, абамектина (1) + TX, ацетопрола [CCN] + TX, аланикарба (15) + TX, альдикарба (16) + TX, альдоксикарба (863) + TX, AZ 60541 (код соединения) + TX, бенклотиаза [CCN] + TX, беномила (62) + TX, бутилпиридабена (альтернативное название) + TX, кадусафоса (109) + TX, карбофурана (118) + TX, дисульфида углерода (945) + TX, карбосульфана (119) + TX, хлорпикрина (141) + TX, хлорпирифоса (145) + TX, клоэтокарба (999) + TX, циклобутрифлурама + TX, цитокининов (альтернативное название) (210) + TX, дазомета (216) + TX, DBCP (1045) + TX, DCIP (218) + TX, диамидафоса (1044) + TX, дихлофентиона (1051) + TX, диклифоса (альтернативное название) + TX, диметоата (262) + TX, дорамектина (альтернативное название) [CCN] + TX, эмаектина (291) + TX, эмаектина бензоата (291) + TX, эприномектина (альтернативное название) [CCN] + TX, этопрофоса (312) + TX, этилендибромида (316) + TX, фенамифоса (326) + TX, фенпирада (альтернативное название) + TX, фенсульфотиона (1158) + TX, фостиазата (408) + TX, фостиетана (1196) + TX, фурфурола (альтернативное название) [CCN] + TX, GY-81 (код разработки) (423) + TX, гетерофоса [CCN] + TX, йодметана (название согласно IUPAC) (542) + TX, изамидофоса (1230) + TX, исазофоса (1231) + TX, ивермектина (альтернативное название) [CCN] + TX, кинетина (альтернативное название) (210) + TX, мекарфона (1258) + TX, метама (519) + TX, метам-калия (альтернативное название) (519) + TX, метам-натрия (519) + TX, метилбромида (537) + TX, метилизотиоцианата (543) + TX, милбемицин-оксима (альтернативное название) [CCN] + TX, оксидектина (альтернативное название) [CCN] + TX, композиции на основе *Myrothecium verrucaria* (альтернативное название) (565) + TX, NC-184 (код соединения) + TX, оксамила (602) + TX, фората (636) + TX, фосфамидона (639) + TX, фосфокарба [CCN] + TX,

- себуфоса (альтернативное название) + ТХ, селамектина (альтернативное название) [CCN] + ТХ, спиносада (737) + ТХ, тербама (альтернативное название) + ТХ, тербуфоса (773) + ТХ, тетраклортиофена (название согласно IUPAC/Химической реферативной службе) (1422) + ТХ, тиафенокса (альтернативное название) + ТХ, тионазина (1434) + ТХ, триазофоса (820) + ТХ, триазурона (альтернативное название) + ТХ, ксиленолов [CCN] + ТХ, YI-5302 (код соединения) и зеатина (альтернативное название) (210) + ТХ, флуенсульфона [318290-98-1] + ТХ, флуопирама + ТХ;
- ингибитор нитрификации, выбранный из группы веществ, состоящей из этилксантата калия [CCN] и нитрапирина (580) + ТХ;
- 10 активатор роста растений, выбранный из группы веществ, состоящей из ацибензолара (6) + ТХ, ацибензолар-*S*-метила (6) + ТХ, пробеназола (658) и экстракта *Reynoutria sachalinensis* (альтернативное название) (720) + ТХ;
- родентицид, выбранный из группы веществ, состоящей из 2-изовалериллиндан-1,3-диона (название согласно IUPAC) (1246) + ТХ, 4-(хиноксалин-2-иламино)бензолсульфонамида (название согласно IUPAC) (748) + ТХ, альфа-хлоргидрина [CCN] + ТХ, фосфида алюминия (640) + ТХ, ANTU (880) + ТХ, оксида мышьяка (882) + ТХ, карбоната бария (891) + ТХ, бистиосеми (912) + ТХ, бродифакума (89) + ТХ, бромадиолона (в том числе альфа-бромадиолона) + ТХ, брометалина (92) + ТХ, цианида кальция (444) + ТХ, хлоралозы (127) + ТХ, 15 хлорофацинона (140) + ТХ, холекальциферола (альтернативное название) (850) + ТХ, кумахлора (1004) + ТХ, кумафурила (1005) + ТХ, куматетралила (175) + ТХ, кримидина (1009) + ТХ, дифенакума (246) + ТХ, дифетиалона (249) + ТХ, дифацинона (273) + ТХ, эргокальциферола (301) + ТХ, флокумафена (357) + ТХ, фторацетамида (379) + ТХ, флупропадина (1183) + ТХ, флупропадина гидрохлорида 20 (1183) + ТХ, гамма-НСН (430) + ТХ, НСН (430) + ТХ, циановодорода (444) + ТХ, йодметана (название согласно IUPAC) (542) + ТХ, линдана (430) + ТХ, фосфида магния (название согласно IUPAC) (640) + ТХ, метилбромида (537) + ТХ, норбормида (1318) + ТХ, фосацетима (1336) + ТХ, фосфина (название согласно IUPAC) (640) + ТХ, фосфора [CCN] + ТХ, пиндона (1341) + ТХ, арсенита калия 25 [CCN] + ТХ, пиринурона (1371) + ТХ, сциллирозида (1390) + ТХ, арсенита натрия [CCN] + ТХ, цианида натрия (444) + ТХ, фторацетата натрия (735) + ТХ, стрихнина (745) + ТХ, сульфата таллия [CCN] + ТХ, варфарина (851) и фосфида цинка (640) + ТХ;

- синергист, выбранный из группы веществ, состоящей из 2-(2-бутоксипропилокси)этилпиперонилата (название согласно IUPAC) (934) + ТХ, 5-(1,3-бензодиоксол-5-ил)-3-гексилциклогекс-2-енон (название согласно IUPAC) (903) + ТХ, фарнезола с неролидом (альтернативное название) (324) + ТХ, МВ-599 (код разработки) (498) + ТХ, МК 264 (код разработки) (296) + ТХ, пиперонилбутоксид (649) + ТХ, пипротала (1343) + ТХ, изомера пропила (1358) + ТХ, S421 (код разработки) (724) + ТХ, сезамекса (1393) + ТХ, сезасмолина (1394) и сульфоксида (1406) + ТХ;
- 10 средство для отпугивания животных, выбранное из группы веществ, состоящей из антрахинона (32) + ТХ, хлоралозы (127) + ТХ, нафтената меди [CCN] + ТХ, оксихлорида меди (171) + ТХ, диазинона (227) + ТХ, дициклопентадиена (химическое название) (1069) + ТХ, гуазатина (422) + ТХ, ацетатов гуазатина (422) + ТХ, метиокарба (530) + ТХ, пиридин-4-амин (название согласно IUPAC) (23) + ТХ, тирама (804) + ТХ, триметакарба (840) + ТХ, нафтената цинка [CCN] и зирама (856) +
- 15 ТХ;
- вируцида, выбранного из группы веществ, состоящей из иманина (альтернативное название) [CCN] и рибавирина (альтернативное название) [CCN] + ТХ;
- защитное средство для ран, выбранное из группы веществ, состоящей из оксида ртути (512) + ТХ, октилинона (590) и тиофанат-метила (802) + ТХ;
- 20 биологически активное вещество, выбранное из 1,1-бис(4-хлорфенил)-2-этоксиэтанола + ТХ, 2,4-дихлорфенилбензолсульфоната + ТХ, 2-фтор-N-метил-N-1-нафтилацетамида + ТХ, 4-хлорфенилфенилсульфона + ТХ, ацетопрола + ТХ, альдоксикарба + ТХ, амидитиона + ТХ, амидотиоата + ТХ, амитона + ТХ, гидрооксалата амитона + ТХ, амитраза + ТХ, арамиты + ТХ, оксида мышьяка + ТХ, азобензола + ТХ, азотоата + ТХ,
- 25 беномила + ТХ, беноксафоса + ТХ, бензилбензоата + ТХ, биксафена + ТХ, брофенвалерата + ТХ, бромциклена + ТХ, бромфоса + ТХ, бромпропилата + ТХ, бупрофезина + ТХ, бутоксикарбоксима + ТХ, бутоксикарбоксима + ТХ, бутилпиридабена + ТХ, полисульфида кальция + ТХ, камфехлора + ТХ, карбанолата + ТХ, карбофенотиона + ТХ, цимиазола + ТХ, хинометионата + ТХ, хлорбензида + ТХ,
- 30 хлордиформа + ТХ, гидрохлорида хлордиформа + ТХ, хлорфенетол + ТХ, хлорфенсона + ТХ, хлорфенсульфида + ТХ, хлоробензилата + ТХ, хлоромебуформа + ТХ, хлорометиурона + ТХ, хлоропропилата + ТХ, хлортиофоса + ТХ, цинерина I + ТХ, цинерина II + ТХ, цинеринов + ТХ, клозантела + ТХ, кумафоса + ТХ, кротамитона +

ТХ, кротоксифоса + ТХ, куфранеба + ТХ, циантоата + ТХ, DCPM + ТХ, DDT + ТХ, демефиона + ТХ, демефион-О + ТХ, демефион-S + ТХ, деметон-метила + ТХ, деметон-О + ТХ, деметон-О-метила + ТХ, деметон-S + ТХ, деметон-S-метила + ТХ, деметон-S-метилсульфона + ТХ, дихлорфлуанида + ТХ, дихлофоса + ТХ, диклифоса + ТХ, диенохлора + ТХ, димефокса + ТХ, динекса + ТХ, динекс-диклексина + ТХ, динокапа-4 + ТХ, динокапа-6 + ТХ, диноктона + ТХ, динопентона + ТХ, диносурьфона + ТХ, динотербона + ТХ, диоксатиона + ТХ, дифенилсульфона + ТХ, дисульфирама + ТХ, DNOC + ТХ, дофенапина + ТХ, дорамектина + ТХ, эндотиона + ТХ, эприномектина + ТХ, этоат-метила + ТХ, этримфоса + ТХ, феназафлора + ТХ, оксида фенбутатина + ТХ, фенотиокарба + ТХ, фенпирада + ТХ, фенпироксимата + ТХ, фенпиразамина + ТХ, фензона + ТХ, фентрифанила + ТХ, флубензимиона + ТХ, флуциклоксурона + ТХ, флуенетила + ТХ, флуорбензида + ТХ, FMC 1137 + ТХ, форметаната + ТХ, гидрохлорида форметаната + ТХ, формпараната + ТХ, гамма-НСН + ТХ, глиодина + ТХ, галфенпрокса + ТХ, гексадецилциклопропанкарбоксилата + ТХ, изокарбофоса + ТХ, жасмолина I + ТХ, жасмолина II + ТХ, йодофенфоса + ТХ, линдана + ТХ, маленобена + ТХ, мекарбама + ТХ, мефосфолана + ТХ, месульфена + ТХ, метакрифоса + ТХ, метилбромида + ТХ, метолкарба + ТХ, мексакарбата + ТХ, оксима мильбемицина + ТХ, мипафокса + ТХ, монокротофоса + ТХ, морфотиона + ТХ, моксидектина + ТХ, наледа + ТХ, 4-хлор-2-(2-хлор-2-метилпропил)-5-[(6-йод-3-пиридил)метокси]пиридазин-3-она + ТХ, нифлуридида + ТХ, никкомицинов + ТХ, нитрилакарба + ТХ, комплекса нитрилакарба и хлорида цинка 1:1 + ТХ, ометоата + ТХ, оксидепрофоса + ТХ, оксидисульфотона + ТХ, pp'-DDT + ТХ, паратиона + ТХ, перметрина + ТХ, фенкаптона + ТХ, фозалона + ТХ, фосфолана + ТХ, фосфамидона + ТХ, полихлортерпенов + ТХ, полинактинов + ТХ, проклонола + ТХ, промацила + ТХ, пропоксура + ТХ, протидатиона + ТХ, протоата + ТХ, пиретрина I + ТХ, пиретрина II + ТХ, пиретринов + ТХ, пиридафентиона + ТХ, пиримитата + ТХ, квиналфоса + ТХ, квинтиофоса + ТХ, R-1492 + ТХ, фосглицина + ТХ, ротенона + ТХ, шрадана + ТХ, себуфоса + ТХ, селамектина + ТХ, софамида + ТХ, SSI-121 + ТХ, сульфирама + ТХ, сульфлурамида + ТХ, сульфотепа + ТХ, серы + ТХ, дифловидазина + ТХ, тау-флювалината + ТХ, ТЕРР + ТХ, тербама + ТХ, тетрадифона + ТХ, тетрасула + ТХ, тиафенокса + ТХ, тиокарбоксива + ТХ, тиофанокса + ТХ, тиометона + ТХ, тиоквинокса + ТХ, турингиенсина + ТХ, триамифоса + ТХ, триаратена + ТХ, триазофоса + ТХ, триазурина + ТХ, трифенофоса + ТХ, тринактина + ТХ, вамидотиона + ТХ,

ванилипрола + ТХ, бетоксазина + ТХ, диоктаноата меди + ТХ, сульфата меди + ТХ, цибутрина + ТХ, дихлона + ТХ, дихлорофена + ТХ, эндотала + ТХ, фентина + ТХ, гашеной извести + ТХ, набама + ТХ, квинокламина + ТХ, квиноамида + ТХ, симазина + ТХ, ацетата трифенилолова + ТХ, гидроксида трифенилолова + ТХ, круфомата + ТХ, 5 пиперазина + ТХ, тиофаната + ТХ, хлоралозы + ТХ, фентиона + ТХ, пиридин-4-амин + ТХ, стрихнина + ТХ, 1-гидрокси-1Н-пиридин-2-тиона + ТХ, 4-(хиноксалин-2-иламино)бензолсульфонамида + ТХ, сульфата 8-гидроксихинолина + ТХ, бронопола + ТХ, гидроксида меди + ТХ, крезола + ТХ, дипиритиона + ТХ, додицина + ТХ, фенаминосульфа + ТХ, формальдегида + ТХ, гидраргафена + ТХ, касугамицина + ТХ, 10 гидрата гидрохлорида касугамицина + ТХ, бис(диметилдитиокарбамата) никеля + ТХ, нитрапирина + ТХ, октилинона + ТХ, оксолиновой кислоты + ТХ, окситетрациклина + ТХ, гидросихинолинсульфата калия + ТХ, пробеназола + ТХ, стрептомицина + ТХ, сесквисульфата стрептомицина + ТХ, теклофталама + ТХ, тиомерсала + ТХ, Adoxophyes orana GV + ТХ, Agrobacterium radiobacter + ТХ, Amblyseius spp. + ТХ, 15 Anagrapha falcifera NPV + ТХ, Anagrus atomus + ТХ, Aphelinus abdominalis + ТХ, Aphidius colemani + ТХ, Aphidoletes aphidimyza + ТХ, Autographa californica NPV + ТХ, Bacillus sphaericus Neide + ТХ, Beauveria brongniartii + ТХ, Chrysoperla carnea + ТХ, Cryptolaemus montrouzieri + ТХ, Cydia pomonella GV + ТХ, Dacnusa sibirica + ТХ, Diglyphus isaea + ТХ, Encarsia formosa + ТХ, Eretmocerus eremicus + ТХ, Heterorhabditis bacteriophora и H. megidis + ТХ, Hippodamia convergens + ТХ, Leptomastix dactylopii + ТХ, 20 Macrolophus caliginosus + ТХ, Mamestra brassicae NPV + ТХ, Metaphycus helvolus + ТХ, Metarhizium anisopliae var. acridum + ТХ, Metarhizium anisopliae var. anisopliae + ТХ, Neodiprion sertifer NPV и N. lecontei NPV + ТХ, Orius spp. + ТХ, Paecilomyces fumosoroseus + ТХ, Phytoseiulus persimilis + ТХ, Steinernema bibionis + ТХ, Steinernema carpocapsae + ТХ, Steinernema feltiae + ТХ, Steinernema glaseri + ТХ, Steinernema riobrave + ТХ, Steinernema riobravus + ТХ, Steinernema scapterisci + ТХ, Steinernema spp. + ТХ, Trichogramma spp. + ТХ, Typhlodromus occidentalis + ТХ, Verticillium lecanii + ТХ, афолата + ТХ, бисазира + ТХ, бусульфана + ТХ, диматифа + ТХ, хемела + ТХ, хемпы + ТХ, метепы + ТХ, метиотепы + ТХ, метилафолата + ТХ, морзида + ТХ, 25 пенфлурона + ТХ, тепы + ТХ, тиохемпы + ТХ, тиотепы + ТХ, третамина + ТХ, уредепы + ТХ, (Е)-дец-5-ен-1-илацетата и (Е)-дец-5-ен-1-ола + ТХ, (Е)-тридец-4-ен-1-илацетата + ТХ, (Е)-6-метилгепт-2-ен-4-ола + ТХ, (Е,З)-тетрадека-4,10-диен-1-илацетата + ТХ, (З)-додец-7-ен-1-илацетата + ТХ, (З)-гексадец-11-енала + ТХ, (З)-гексадец-11-ен-1-

илацетата + ТХ, (Z)-гексадец-13-ен-11-ин-1-илацетата + ТХ, (Z)-икоз-13-ен-10-она + ТХ, (Z)-тетрадец-7-ен-1-аля + ТХ, (Z)-тетрадец-9-ен-1-ола + ТХ, (Z)-тетрадец-9-ен-1-илацетата + ТХ, (7E,9Z)-додека-7,9-диен-1-илацетата + ТХ, (9Z,11E)-тетрадека-9,11-диен-1-илацетата + ТХ, (9Z,12E)-тетрадека-9,12-диен-1-илацетата + ТХ, 14-метилоктадец-1-ена + ТХ, 4-метилнонан-5-ола и 4-метилнонан-5-она + ТХ, альфамултистриатина + ТХ, бревикомина + ТХ, кодлелура + ТХ, кодлемона + ТХ, куелура + ТХ, диспарлура + ТХ, додец-8-ен-1-илацетата + ТХ, додец-9-ен-1-илацетата + ТХ, додека-8 + ТХ, 10-диен-1-илацетата + ТХ, доминикалура + ТХ, этил-4-метилоктаноата + ТХ, эвгенола + ТХ, фронталина + ТХ, грандлура + ТХ, грандлура I + ТХ, грандлура II + ТХ, грандлура III + ТХ, грандлура IV + ТХ, гексалура + ТХ, ипсдиенола + ТХ, ипсенола + ТХ, японилура + ТХ, линеатина + ТХ, литлура + ТХ, луплура + ТХ, медлура + ТХ, мегатомоевой кислоты + ТХ, метилэвгенола + ТХ, мускалура + ТХ, октадека-2,13-диен-1-илацетата + ТХ, октадека-3,13-диен-1-илацетата + ТХ, орфралура + ТХ, орикталура + ТХ, острамона + ТХ, сиглура + ТХ, сордидина + ТХ, сулкатола + ТХ, тетрадец-11-ен-1-илацетата + ТХ, тримедлура + ТХ, тримедлура А + ТХ, тримедлура В₁ + ТХ, тримедлура В₂ + ТХ, тримедлура С + ТХ, транк-колла + ТХ, 2-(октилтио)-этанола + ТХ, бутопиროноксила + ТХ, бутокси(полипропиленгликоль) + ТХ, дибутиладипата + ТХ, дибутилфталата + ТХ, дибутилсукцината + ТХ, диэтилтолуамида + ТХ, диметилкарбата + ТХ, диметилфталата + ТХ, этилгександиола + ТХ, гексамида + ТХ, метоквин-бутила + ТХ, метилнеодеканамида + ТХ, оксамата + ТХ, рикаридина + ТХ, 1-дихлор-1-нитроэтана + ТХ, 1,1-дихлор-2,2-бис(4-этилфенил)-этана + ТХ, 1,2-дихлорпропана и 1,3-дихлорпропена + ТХ, 1-бром-2-хлорэтана + ТХ, 2,2,2-трихлор-1-(3,4-дихлорфенил)этилацетата + ТХ, 2,2-дихлорвинил 2-этилсульфинилэтилметилфосфата + ТХ, 2-(1,3-дитиолан-2-ил)фенилдиметилкарбамата + ТХ, 2-(2-бутоксиэтокси)этилтиоцианата + ТХ, 2-(4,5-диметил-1,3-диоксолан-2-ил)фенилметилкарбамата + ТХ, 2-(4-хлор-3,5-ксилилокси)этанола + ТХ, 2-хлорвинилдиэтилфосфата + ТХ, 2-имидазолидона + ТХ, 2-изовалерилиндан-1,3-диона + ТХ, 2-метил(проп-2-инил)аминофенилметилкарбамата + ТХ, 2-тиоцианатоэтиллаурата + ТХ, 3-бром-1-хлорпроп-1-ена + ТХ, 3-метил-1-фенилпиразол-5-илдиметилкарбамата + ТХ, 4-метил(проп-2-инил)амино-3,5-ксилилметилкарбамата + ТХ, 5,5-диметил-3-оксоциклогекс-1-енилдиметилкарбамата + ТХ, ацетиона + ТХ, акрилонитрила + ТХ, альдрина + ТХ, аллозамидина + ТХ, алликсикарба + ТХ, альфа-экдизона + ТХ, фосфида алюминия + ТХ, аминокарба + ТХ, анабазина + ТХ, атидатиона + ТХ, азаметифоса +

ТХ, дельта-эндотоксинов *Bacillus thuringiensis* + ТХ, гексафторсиликата бария + ТХ, полисульфида бария + ТХ, бартрина + ТХ, Bayer 22/190 + ТХ, Bayer 22408 + ТХ, бета-цифлутрина + ТХ, бета-циперметрина + ТХ, биоэтанометрина + ТХ, биоперметрина + ТХ, бис(2-хлорэтилового) эфира + ТХ, буры + ТХ, бромфенвинфоса + ТХ, бром-DDT + ТХ, буфенкарба + ТХ, бутакарба + ТХ, бутатиофоса + ТХ, бутоната + ТХ, арсената кальция + ТХ, цианида кальция + ТХ, сероуглерода + ТХ, тетрахлорметана + ТХ, гидрохлорида картапа + ТХ, цевадина + ТХ, хлорбициклена + ТХ, хлордана + ТХ, хлордекона + ТХ, хлороформа + ТХ, хлорпикрина + ТХ, хлорфоксима + ТХ, хлорпразофоса + ТХ, цис-ресметрина + ТХ, цисметрина + ТХ, клоцитрина + ТХ, ацетоарсенита меди + ТХ, арсената меди + ТХ, олеата меди + ТХ, кумитоата + ТХ, криолита + ТХ, CS 708 + ТХ, цианофенфоса + ТХ, цианофоса + ТХ, циклетрина + ТХ, цитиоата + ТХ, d-тетраметрина + ТХ, DAEP + ТХ, дазомета + ТХ, декарбофурана + ТХ, диамидафоса + ТХ, дикаптона + ТХ, дихлофентиона + ТХ, дикрезила + ТХ, дицикланила + ТХ, диелдрина + ТХ, диэтил-5-метилпиразол-3-илфосфата + ТХ, дилора + ТХ, димефлутрина + ТХ, диметана + ТХ, диметрина + ТХ, диметилвинфоса + ТХ, диметилана + ТХ, динопропа + ТХ, диносама + ТХ, диносеба + ТХ, диофенолана + ТХ, диоксабензофоса + ТХ, дитикрофоса + ТХ, DSP + ТХ, экдистерона + ТХ, EI 1642 + ТХ, ЕМРС + ТХ, ЕРВР + ТХ, этафоса + ТХ, этиофенкарба + ТХ, этилформиата + ТХ, этилендибромид + ТХ, этилендихлорида + ТХ, оксида этилена + ТХ, EXD + ТХ, фенхлофоса + ТХ, фенетакарба + ТХ, фенитротиона + ТХ, феноксакрима + ТХ, фенпиритрина + ТХ, фенсульфотиона + ТХ, фентион-этила + ТХ, флукофурана + ТХ, фосметилана + ТХ, фоспирата + ТХ, фостиэтана + ТХ, фуратиокарба + ТХ, фуретрина + ТХ, гуазатина + ТХ, ацетатов гуазатина + ТХ, тетратиокарбоната натрия + ТХ, галфенпрокса + ТХ, HCH + ТХ, HEOD + ТХ, гептахлора + ТХ, гетерофоса + ТХ, NHDN + ТХ, синильной кислоты + ТХ, хиквинкарба + ТХ, IPSP + ТХ, изазофоса + ТХ, изобензана + ТХ, изодрина + ТХ, изофенфоса + ТХ, изолана + ТХ, изопротиолана + ТХ, изоксатиона + ТХ, ювенильного гормона I + ТХ, ювенильного гормона II + ТХ, ювенильного гормона III + ТХ, келевана + ТХ, кинопрена + ТХ, арсената свинца + ТХ, лептофоса + ТХ, лиримфоса + ТХ, литидатиона + ТХ, м-куменилметилкарбамата + ТХ, фосфида магния + ТХ, мазидокса + ТХ, мекарфона + ТХ, меназона + ТХ, хлорида ртути + ТХ, месульфенфоса + ТХ, метама + ТХ, метам-калия + ТХ, метам-натрия + ТХ, фторида метансульфонила + ТХ, метокротофоса + ТХ, метопрена + ТХ, метотрина + ТХ, метоксихлора + ТХ, метилизотиоцианата + ТХ, метилхлороформа + ТХ,

метиленхлорида + ТХ, метоксадиазона + ТХ, мирекса + ТХ, нафталофоса + ТХ,
 нафталина + ТХ, NC-170 + ТХ, никотина + ТХ, сульфата никотина + ТХ, нитиазина +
 ТХ, норникотина + ТХ, О-5-дихлор-4-йодфенил-О-этилэтилфосфонотиоата + ТХ, О,О-
 диэтил-О-4-метил-2-оксо-2Н-хромен-7-илфосфоротиоата + ТХ, О,О-диэтил-О-6-метил-
 5 2-пропилпиримидин-4-илфосфоротиоата + ТХ, О,О,О',О'-
 тетрапропилдитиопирофосфата + ТХ, олеиновой кислоты + ТХ, пара-дихлорбензола +
 ТХ, паратион-метила + ТХ, пентахлорфенола + ТХ, пентахлорфениллаурата + ТХ, РН
 60-38 + ТХ, фенкаптона + ТХ, фосниклора + ТХ, фосфина + ТХ, фоксим-метила + ТХ,
 пириметафоса + ТХ, изомеров полихлордициклопентадиена + ТХ, арсенита калия + ТХ,
 10 тиоцианата калия + ТХ, прекоцена I + ТХ, прекоцена II + ТХ, прекоцена III + ТХ,
 примидофоса + ТХ, профлутрина + ТХ, промекарба + ТХ, протиофоса + ТХ,
 пиразофоса + ТХ, пиресметрина + ТХ, квасии + ТХ, квиналфос-метила + ТХ,
 квинотиона + ТХ, рафоксанида + ТХ, ресметрина + ТХ, ротенона + ТХ, кадетрина +
 ТХ, риании + ТХ, рианодина + ТХ, сабадиллы + ТХ, шрадана + ТХ, себуфоса + ТХ, SI-
 15 0009 + ТХ, тиaproнила + ТХ, арсенита натрия + ТХ, цианида натрия + ТХ, фторида
 натрия + ТХ, гексафторсиликата натрия + ТХ, пентахлорфеноксида натрия + ТХ,
 селената натрия + ТХ, тиоцианата натрия + ТХ, сулкофуруна + ТХ, сулкофурун-натрия
 + ТХ, сульфурилфторида + ТХ, сульпрофоса + ТХ, дегтярных масел + ТХ, тазимкарба +
 ТХ, TDE + ТХ, тебупиримфоса + ТХ, темефоса + ТХ, тераллетрина + ТХ,
 20 тетрахлорэтана + ТХ, тикрофоса + ТХ, тиоциклама + ТХ, гидрооксалата тиоциклама +
 ТХ, тионазина + ТХ, тиосултапа + ТХ, тиосултап-натрия + ТХ, тралометрина + ТХ,
 трансперметрина + ТХ, триазамата + ТХ, трихлорметафоса-3 + ТХ, трихлороната + ТХ,
 триметакарба + ТХ, толпрокарба + ТХ, трихлопирикарба + ТХ, трипрена + ТХ,
 вератридина + ТХ, вератрина + ТХ, ХМС + ТХ, зетаметрина + ТХ, фосфида цинка +
 25 ТХ, золапрофоса + ТХ, меперфлутрина + ТХ, тетраметилфлутрина + ТХ, оксида
 бис(трибутилолова) + ТХ, бромацетамида + ТХ, фосфата железа + ТХ, никлосамид-
 оламина + ТХ, оксида трибутилолова + ТХ, пириморфа + ТХ, трифенморфа + ТХ, 1,2-
 дибром-3-хлорпропана + ТХ, 1,3-дихлорпропена + ТХ, 3,4-дихлортетрагидродиофен-
 1,1-диоксида + ТХ, 3-(4-хлорфенил)-5-метилгроданина + ТХ, 5-метил-6-тиоксо-1,3,5-
 30 тиадиазинан-3-илуксусной кислоты + ТХ, 6-изопентениламинопурина + ТХ,
 анисифлупурина + ТХ, бенклотиаза + ТХ, цитокининов + ТХ, DCIP + ТХ, фурфурола +
 ТХ, изамидофоса + ТХ, кинетина + ТХ, композиции на основе *Murothecium verrucaria* +
 ТХ, тетрахлортиофена + ТХ, ксиленолов + ТХ, зеатина + ТХ, этилксантата калия + ТХ ,

ацибензолара + ТХ, ацибензолар-S-метила + ТХ, экстракта *Reynoutria sachalinensis* + ТХ, альфа-хлоргидрина + ТХ, анту + ТХ, карбоната бария + ТХ, бистиосеми + ТХ, бродифакума + ТХ, бромадиолона + ТХ, брометалина + ТХ, хлорофацинона + ТХ, холекальциферола + ТХ, кумахлора + ТХ, кумафурила + ТХ, куматетралила + ТХ, 5 кримидина + ТХ, дифенакума + ТХ, дифетиалона + ТХ, дифацинона + ТХ, эргокальциферола + ТХ, флокумафена + ТХ, флуороацетамида + ТХ, флупропадина + ТХ, гидрохлорида флупропадина + ТХ, норбормида + ТХ, фосацетима + ТХ, фосфора + ТХ, пиндона + ТХ, пиринурона + ТХ, скиллирозида + ТХ, -фторацетата натрия + ТХ, сульфата таллия + ТХ, варфарина + ТХ, -2-(2-бутоксизтокси)этилпиперонилата + ТХ, 10 (1,3-бензодиоксол-5-ил)-3-гексилциклогекс-2-енона + ТХ, фарнезола с неролидолом + ТХ, вербутина + ТХ, MGK 264 + ТХ, пиперонилбутоксиды + ТХ, пипротала + ТХ, изомера пропила + ТХ, S421 + ТХ, сезамекса + ТХ, сезасмолина + ТХ, сульфоксида + ТХ, антрахинона + ТХ, нафтената меди + ТХ, оксихлорида меди + ТХ, дициклопентадиена + ТХ, тирама + ТХ, нафтената цинка + ТХ, цирама + ТХ, иманина + 15 ТХ, рибавирина + ТХ, хлороинконазида + ТХ, оксида ртути + ТХ, тиофанат-метила + ТХ, азаконазола + ТХ, битертанола + ТХ, бромуконазола + ТХ, ципроконазола + ТХ, дифеноконазола + ТХ, диниконазола + ТХ, эпоксиконазола + ТХ, фенбуконазола + ТХ, флуквинконазола + ТХ, флузилазола + ТХ, флутриафола + ТХ, фураметпира + ТХ, гексаконазола + ТХ, имазалила + ТХ, имибен-коназола + ТХ, ипконазола + ТХ, 20 метконазола + ТХ, миклобутанила + ТХ, паклобутразола + ТХ, пефуразоата + ТХ, пенконазола + ТХ, протиоконазола + ТХ, пирифенокса + ТХ, прохлораза + ТХ, пропиконазола + ТХ, призоксазола + ТХ, -симеконазола + ТХ, тебукон-азола + ТХ, тетраконазола + ТХ, триадимефона + ТХ, триадименола + ТХ, трифлумизола + ТХ, тритиконазола + ТХ, анцимидола + ТХ, фенаримола + ТХ, нуаримола + ТХ, 25 бупиримата + ТХ, диметиримола + ТХ, этиримола + ТХ, додеморфа + ТХ, фенпропидина + ТХ, фенпропиморфа + ТХ, спироксамина + ТХ, тридеморфа + ТХ, ципродинила + ТХ, мепанипирима + ТХ, пириметанила + ТХ, фенпиклонила + ТХ, флудиоксонила + ТХ, беналаксила + ТХ, фуралаксила + ТХ, -металаксила + ТХ, R-металаксила + ТХ, офураса + ТХ, оксадиксила + ТХ, карбендазима + ТХ, дебакарба + 30 ТХ, фуберидазола + ТХ, тиабендазола + ТХ, хлостолина + ТХ, дихлозолина + ТХ, миклозолина + ТХ, процимидона + ТХ, винклозолина + ТХ, боскалида + ТХ, карбоксина + ТХ, фенфурама + ТХ, флутоланила + ТХ, мепронила + ТХ, оксикарбоксина + ТХ, пентиопирада + ТХ, тифлузамида + ТХ, додина + ТХ,

иминоктадина + ТХ, азоксистробина + ТХ, димоксистробина + ТХ, энестробурина + ТХ, фенаминстробина + ТХ, флуфеноксистробина + ТХ, флуоксастробина + ТХ, крезоксим-метила + ТХ, метоминостробина + ТХ, трифлуксистробина + ТХ, орисастробина + ТХ, пикоксистробина + ТХ, пиракlostробина + ТХ, пираметостробина + ТХ, пираоксистробина + ТХ, фербама + ТХ, манкозеба + ТХ, манеба + ТХ, метирама + ТХ, пропиенеба + ТХ, цинеба + ТХ, каптафола + ТХ, каптана + ТХ, фтороимида + ТХ, фолпета + ТХ, толилфлуанида + ТХ, бордосской смеси + ТХ, оксида меди + ТХ, манкоопера + ТХ, оксиновой меди + ТХ, нитротал-изопропила + ТХ, эдифенфоса + ТХ, ипробенфоса + ТХ, фосдифена + ТХ, толклофос-метила + ТХ, анилазина + ТХ, бентиаваликарба + ТХ, бластицидина-S + ТХ, хлоронеба -+ ТХ, хлороталонила + ТХ, цифлуфенамида + ТХ, цимоксанила + ТХ, циклобуттрифлурама + ТХ, диклоцимета + ТХ, дикломезина -+ ТХ, диклорана + ТХ, дизтофенкарба + ТХ, диметоморфа -+ ТХ, флуморфа + ТХ, дитианона + ТХ, этабоксама + ТХ, этридиазола + ТХ, фамоксадона + ТХ, фенамидона + ТХ, феноксанила + ТХ, феримзона + ТХ, флуазинама + ТХ, флуметилсульфорима + ТХ, флуопиколида + ТХ, флуокситиоконазола + ТХ, флусульфамида + ТХ, флуксапироксада + ТХ, -фенгексамида + ТХ, фосетил-алюминия -+ ТХ, химексазола + ТХ, ипроваликарба + ТХ, циазофамида + ТХ, метасульфокарба + ТХ, метрафенона + ТХ, пенцикурона + ТХ, фталида + ТХ, полиоксинов + ТХ, пропамокарба + ТХ, пирибенкарба + ТХ, проквиназида + ТХ, пироквилона + ТХ, пириофенона + ТХ, квиноксифена + ТХ, квинтозена + ТХ, тиадинила + ТХ, триазоксида + ТХ, трициклазола + ТХ, трифорина + ТХ, валидамицина + ТХ, валифеналата + ТХ, зоксамида + ТХ, мандипропамида + ТХ, флубенетерама + ТХ, изопиразама + ТХ, седаксана + ТХ, бензовиндифлупира + ТХ, пидифлуметофена + ТХ, 3-дифторметил-1-метил-1Н-пиразол-4-карбоновой кислоты (3',4',5'-трифтор-бифенил-2-ил)-амида + ТХ, изофлуципрам + ТХ, изотианила + ТХ, дипиметитрона + ТХ, 6-этил-5,7-диоксопирроло[4,5][1,4]дитиино[1,2-с]изотиазол-3-карбонитрила + ТХ, 2-(дифторметил)-N-[3-этил-1,1-диметилиндан-4-ил]пиридин-3-карбоксамид + ТХ, 4-(2,6-дифторфенил)-6-метил-5-фенилпиридазин-3-карбонитрила + ТХ, (R)-3-(дифторметил)-1-метил-N-[1,1,3-триметилиндан-4-ил]пиразол-4-карбоксамид + ТХ, 4-(2-бром-4-фторфенил)-N-(2-хлор-6-фторфенил)-2,5-диметилпиразол-3-амин + ТХ, 4-(2-бром-4-фторфенил)-N-(2-хлор-6-фторфенил)-1,3-диметил-1Н-пиразол-5-амин + ТХ, флуиндапир + ТХ, куметоксисробина (цзясянцзюньчжи) + ТХ, лвбенмиксианана + ТХ, дихлобентиазокса + ТХ, мандестробина + ТХ, 3-(4,4-дифтор-3,4-дигидро-3,3-

диметилизохинолин-1-ил)хинолона + ТХ, 2-[2-фтор-6-[(8-фтор-2-метил-3-хинолил)окси]фенил]пропан-2-ола + ТХ, оксатиапипролина + ТХ, трет-бутил-N-[6-[[[(1-метилтетразол-5-ил)-фенилметиле]амино]оксиметил]-2-пиридил]карбамата + ТХ, пиразифлумида + ТХ, инпирфлуксама + ТХ, тролпрокарб + ТХ, мефентрифлуконазола + ТХ, ипфентрифлуконазола + ТХ, 2-(дифторметил)-N-[(3R)-3-этил-1,1-диметилиндан-4-ил]пиридин-3-карбоксамида + ТХ, N'-(2,5-диметил-4-феноксифенил)-N-этил-N-метилформамина + ТХ, N'-[4-(4,5-дихлортиазол-2-ил)окси-2,5-диметилфенил]-N-этил-N-метилформамина + ТХ, [2-[3-[2-[1-[2-[3,5-бис(дифторметил)пиразол-1-ил]ацетил]-4-пиперидил]тиазол-4-ил]-4,5-дигидроизоксазол-5-ил]-3-хлорфенил]метансульфоната + ТХ, бут-3-инил-N-[6-[[[(Z)-[(1-метилтетразол-5-ил)-фенилметиле]амино]оксиметил]-2-пиридил]карбамата + ТХ, метил-N-[[5-[4-(2,4-диметилфенил)триазол-2-ил]-2-метилфенил]метил]карбамата + ТХ, 3-хлор-6-метил-5-фенил-4-(2,4,6-трифторфенил)пиридазина + ТХ, пиридахлометила + ТХ, 3-(дифторметил)-1-метил-N-[1,1,3-триметилиндан-4-ил]пиразол-4-карбоксамида + ТХ, 1-[2-[[1-(4-хлорфенил)пиразол-3-ил]оксиметил]-3-метилфенил]-4-метилтетразол-5-она + ТХ, 1-метил-4-[3-метил-2-[[2-метил-4-(3,4,5-триметилпиразол-1-ил)фенокси]метил]фенил]тетразол-5-она + ТХ, аминопирифена + ТХ, аметоктрадина + ТХ, амисулброма + ТХ, пенфлуфена + ТХ, (Z,2E)-5-[1-(4-хлорфенил)пиразол-3-ил]окси-2-метоксиимино-N,3-диметилпент-3-енамида + ТХ, флорилпикоксамид + ТХ, фенпикоксамид + ТХ, метарилпикоксамида + ТХ, тебуфлоквина + ТХ, ипфлуфеноквин + ТХ, квинофумелина + ТХ, изофетамида + ТХ, этил-1-[[4-[[2-(трифторметил)-1,3-диоксолан-2-ил]метокси]фенил]метил]пиразол-3-карбоксилата + ТХ (может быть получен согласно способам, описанным в WO 2020/056090), этил-1-[[4-[(Z)-2-этокси-3,3,3-трифторпроп-1-енокси]фенил]метил]пиразол-3-карбоксилата + ТХ (может быть получен согласно способам, описанным в WO 2020/056090), метил-N-[[4-[1-(4-циклопропил-2,6-дифторфенил)пиразол-4-ил]-2-метилфенил]метил]карбамата + ТХ (может быть получен согласно способам, описанным в WO 2020/097012), метил-N-[[4-[1-(2,6-дифтор-4-изопропилфенил)пиразол-4-ил]-2-метилфенил]метил]карбамата + ТХ (может быть получен согласно способам, описанным в WO 2020/097012), 6-хлор-3-(3-циклопропил-2-фторфенокси)-N-[2-(2,4-диметилфенил)-2,2-дифторетил]-5-метилпиридазин-4-карбоксамида + ТХ (может быть получен согласно способам, описанным в WO 2020/109391), 6-хлор-N-[2-(2-хлор-4-метилфенил)-2,2-дифторетил]-3-(3-циклопропил-2-фторфенокси)-5-метилпиридазин-4-карбоксамида + ТХ (может быть

получен согласно способам, описанным в WO 2020/109391), 6-хлор-3-(3-циклопропил-2-фторфенокси)-N-[2-(3,4-диметилфенил)-2,2-дифторетил]-5-метилпиридазин-4-карбоксамид + ТХ (может быть получен согласно способам, описанным в WO 2020/109391), N-[2-[2,4-дихлорфенокси]фенил]-3-(дифформетил)-1-метилпиразол-4-карбоксамид + ТХ, N-[2-[2-хлор-4-(трифформетил)фенокси]фенил]-3-(дифформетил)-1-метилпиразол-4-карбоксамид + ТХ, бензотиостробина + ТХ, фенамакрила + ТХ, цинковая соль 5-амино-1,3,4-тиадиазол-2-тиола (2:1) + ТХ, флуопирама + ТХ, флуофеноксадиазама + ТХ, флутуанила + ТХ, флуопимотида + ТХ, пирпропоин + ТХ, пикарбутразокса + ТХ, 2-(дифформетил)-N-(3-этил-1,1-диметилиндан-4-ил)пиридин-3-карбоксамид + ТХ, 2-(дифформетил)-N-((3R)-1,1,3-триметилиндан-4-ил)пиридин-3-карбоксамид + ТХ, 4-[[6-[2-(2,4-дифторфенил)-1,1-дифтор-2-гидрокси-3-(1,2,4-триазол-1-ил)пропил]-3-пиридил]окси]бензонитрила + ТХ, метилтетрапрол + ТХ, 2-(дифформетил)-N-((3R)-1,1,3-триметилиндан-4-ил)пиридин-3-карбоксамид + ТХ, α-(1,1-диметилэтил)-α-[4'-(трифформетокси)[1,1'-бифенил]-4-ил]-5-пиримидинметанола + ТХ, флуоксапипролина + ТХ, эноксастробина + ТХ, метил-(Z)-3-метокси-2-[2-метил-5-[4-(трифформетил)триазол-2-ил]фенокси]проп-2-еноата + ТХ, метил-(Z)-3-метокси-2-[2-метил-5-(4-пропилтриазол-2-ил)фенокси]проп-2-еноата + ТХ, метил-(Z)-2-[5-(3-изопропилпиразол-1-ил)-2-метил-фенокси]-3-метоксипроп-2-еноата + ТХ, метил-(Z)-3-метокси-2-[2-метил-5-(3-пропилпиразол-1-ил)фенокси]проп-2-еноата + ТХ, метил-(Z)-3-метокси-2-[2-метил-5-[3-(трифформетил)пиразол-1-ил]фенокси]проп-2-еноата + ТХ (эти соединения могут быть получены согласно способам, описанным в WO2020/079111), метил-(Z)-2-(5-циклогексил-2-метилфенокси)-3-метоксипроп-2-еноата + ТХ, метил-(Z)-2-(5-циклопентил-2-метилфенокси)-3-метоксипроп-2-еноата + ТХ (данные соединения могут быть получены согласно способам, описанным в WO2020/193387), 4-[[6-[2-(2,4-дифторфенил)-1,1-дифтор-2-гидрокси-3-(1,2,4-триазол-1-ил)пропил]-3-пиридил]окси]бензонитрила + ТХ, 4-[[6-[2-(2,4-дифторфенил)-1,1-дифтор-2-гидрокси-3-(5-сульфанил-1,2,4-триазол-1-ил)пропил]-3-пиридил]окси]бензонитрила + ТХ, 4-[[6-[2-(2,4-дифторфенил)-1,1-дифтор-2-гидрокси-3-(5-тиоксо-4Н-1,2,4-триазол-1-ил)пропил]-3-пиридил]окси]бензонитрила + ТХ, тринексапака + ТХ, кумоксистробина + ТХ, чжуншенмицина + ТХ, тиодиазола меди + ТХ, тиазола цинка + ТХ, амектотрактин + ТХ, ипродиона + ТХ, себоктиламина + ТХ; N'-[5-бром-2-метил-6-[(1S)-1-метил-2-пропоксиэтокси]-3-пиридил]-N-этил-N-метилформамидина + ТХ, N'-[5-бром-2-метил-6-[(1R)-1-метил-2-пропоксиэтокси]-3-

- пиридил]-N-этил-N-метилформамина + ТХ, N'-[5-бром-2-метил-6-(1-метил-2-пропоксиэтокси)-3-пиридил]-N-этил-N-метилформамина + ТХ, N'-[5-хлор-2-метил-6-(1-метил-2-пропоксиэтокси)-3-пиридил]-N-этил-N-метилформамина + ТХ, N'-[5-бром-2-метил-6-(1-метил-2-пропоксиэтокси)-3-пиридил]-N-изопропил-N-
- 5 метилформамина + ТХ (данные соединения могут быть получены согласно способам, описанным в WO2015/155075); N'-[5-бром-2-метил-6-(2-пропоксипропокси)-3-пиридил]-N-этил-N-метилформамина + ТХ (данные соединения могут быть получены согласно способам, описанным в IPCOM000249876D); N-изопропил-N'-[5-метокси-2-метил-4-(2,2,2-трифтор-1-гидрокси-1-фенилэтил)фенил]-N-
- 10 метилформамина + ТХ, N'-[4-(1-циклопропил-2,2,2-трифтор-1-гидроксиэтил)-5-метокси-2-метилфенил]-N-изопропил-N-метилформамина + ТХ (данные соединения могут быть получены согласно способам, описанным в WO2018/228896); N-этил-N'-[5-метокси-2-метил-4-[(2-трифторметил)оксетан-2-ил]фенил]-N-метилформамина + ТХ, N-этил-N'-[5-метокси-2-метил-4-[(2-трифторметил)тетрагидрофуран-2-ил]фенил]-N-
- 15 метилформамина + ТХ (данные соединения могут быть получены с помощью способов, описанных в WO 2019/110427); N-[(1R)-1-бензил-3-хлор-1-метилбут-3-енил]-8-фторхинолин-3-карбоксамид + ТХ, N-[(1S)-1-бензил-3-хлор-1-метилбут-3-енил]-8-фторхинолин-3-карбоксамид + ТХ, N-[(1R)-1-бензил-3,3,3-трифтор-1-метилпропил]-8-фторхинолин-3-карбоксамид + ТХ, N-[(1S)-1-бензил-3,3,3-трифтор-1-метилпропил]-8-
- 20 фторхинолин-3-карбоксамид + ТХ, N-[(1R)-1-бензил-1,3-диметилбутил]-7,8-дифторхинолин-3-карбоксамид + ТХ, N-[(1S)-1-бензил-1,3-диметилбутил]-7,8-дифторхинолин-3-карбоксамид + ТХ, 8-фтор-N-[(1R)-1-[(3-фторфенил)метил]-1,3-диметилбутил]хинолин-3-карбоксамид + ТХ, 8-фтор-N-[(1S)-1-[(3-фторфенил)метил]-1,3-диметилбутил]хинолин-3-карбоксамид + ТХ, N-[(1R)-1-бензил-1,3-диметилбутил]-
- 25 8-фторхинолин-3-карбоксамид + ТХ, N-[(1S)-1-бензил-1,3-диметилбутил]-8-фторхинолин-3-карбоксамид + ТХ, N-((1R)-1-бензил-3-хлор-1-метилбут-3-енил)-8-фторхинолин-3-карбоксамид + ТХ, N-((1S)-1-бензил-3-хлор-1-метилбут-3-енил)-8-фторхинолин-3-карбоксамид + ТХ (данные соединения могут быть получены согласно способам, описанным в WO 2017/153380); 1-(6,7-диметилпиразоло[1,5-а]пиридин-3-ил)-4,4,5-трифтор-3,3-диметилизохинолина + ТХ, 1-(6,7-диметилпиразоло[1,5-
- 30 а]пиридин-3-ил)-4,4,6-трифтор-3,3-диметилизохинолина + ТХ, 4,4-дифтор-3,3-диметил-1-(6-метилпиразоло[1,5-а]пиридин-3-ил)изохинолина + ТХ, 4,4-дифтор-3,3-диметил-1-(7-метилпиразоло[1,5-а]пиридин-3-ил)изохинолина + ТХ, 1-(6-хлор-7-

метилпиразоло[1,5-а]пиридин-3-ил)-4,4-дифтор-3,3-диметилизохинолина + ТХ (данные соединения могут быть получены согласно способам, описанным в WO 2017/025510); 1-(4,5-диметилбензимидазол-1-ил)-4,4,5-трифтор-3,3-диметилизохинолина + ТХ, 1-(4,5-диметилбензимидазол-1-ил)-4,4-дифтор-3,3-диметилизохинолина + ТХ, 6-хлор-4,4-дифтор-3,3-диметил-1-(4-метилбензимидазол-1-ил)изохинолина + ТХ, 4,4-дифтор-1-(5-фтор-4-метилбензимидазол-1-ил)-3,3-диметилизохинолина + ТХ, 3-(4,4-дифтор-3,3-диметил-1-изохинолил)-7,8-дигидро-6Н-циклопента[е]бензимидазола + ТХ (данные соединения могут быть получены согласно способам, описанным в WO 2016/156085); N-метокси-N-[[4-[5-(трифторметил)-1,2,4-оксадиазол-3-ил]фенил]метил]циклопропанкарбоксамид + ТХ, N,2-диметокси-N-[[4-[5-(трифторметил)-1,2,4-оксадиазол-3-ил]фенил]метил]пропанамида + ТХ, N-этил-2-метил-N-[[4-[5-(трифторметил)-1,2,4-оксадиазол-3-ил]фенил]метил]пропанамида + ТХ, 1-метокси-3-метил-1-[[4-[5-(трифторметил)-1,2,4-оксадиазол-3-ил]фенил]метил]мочевины + ТХ, 1,3-диметокси-1-[[4-[5-(трифторметил)-1,2,4-оксадиазол-3-ил]фенил]метил]мочевины + ТХ, 3-этил-1-метокси-1-[[4-[5-(трифторметил)-1,2,4-оксадиазол-3-ил]фенил]метил]мочевины + ТХ, N-[[4-[5-(трифторметил)-1,2,4-оксадиазол-3-ил]фенил]метил]пропанамида + ТХ, 4,4-диметил-2-[[4-[5-(трифторметил)-1,2,4-оксадиазол-3-ил]фенил]метил]изоксазолидин-3-она + ТХ, 5,5-диметил-2-[[4-[5-(трифторметил)-1,2,4-оксадиазол-3-ил]фенил]метил]изоксазолидин-3-она + ТХ, этил-1-[[4-[5-(трифторметил)-1,2,4-оксадиазол-3-ил]фенил]метил]пиразол-4-карбоксилата + ТХ, N,N-диметил-1-[[4-[5-(трифторметил)-1,2,4-оксадиазол-3-ил]фенил]метил]-1,2,4-триазол-3-амин + ТХ. Соединения в данном абзаце могут быть получены согласно способам, описанным в WO 2017/055473, WO 2017/055469, WO 2017/093348 и WO 2017/118689; 2-[6-(4-хлорфенокси)-2-(трифторметил)-3-пиридил]-1-(1,2,4-триазол-1-ил)пропан-2-ола + ТХ (данное соединение может быть получено согласно способам, описанным в WO 2017/029179); 2-[6-(4-бромфенокси)-2-(трифторметил)-3-пиридил]-1-(1,2,4-триазол-1-ил)пропан-2-ола + ТХ (данное соединение может быть получено согласно способам, описанным в WO 2017/029179); 3-[2-(1-хлорциклопропил)-3-(2-фторфенил)-2-гидроксипропил]имидазол-4-карбонитрила + ТХ (данное соединение может быть получено согласно способам, описанным в WO 2016/156290); 3-[2-(1-хлорциклопропил)-3-(3-хлор-2-фторфенил)-2-гидроксипропил]имидазол-4-карбонитрила + ТХ (данное соединение может быть получено согласно способам,

описанным в WO 2016/156290); (4-феноксифенил)метил-2-амино-6-метил-пиридин-3-карбоксилата + TX (данное соединение может быть получено согласно способам, описанным в WO 2014/006945); 2,6-диметил-1H,5H-[1,4]дитиино[2,3-с:5,6-с']дипиррол-1,3,5,7(2H,6H)-тетрона + TX (данное соединение может быть получено согласно способам, описанным в WO 2011/138281); N-метил-4-[5-(трифторметил)-1,2,4-оксадиазол-3-ил]бензолкарботиоамида + TX; N-метил-4-[5-(трифторметил)-1,2,4-оксадиазол-3-ил]бензамида + TX; (Z,2E)-5-[1-(2,4-дихлорфенил)пиразол-3-ил]окси-2-метоксиимино-N,3-диметилпент-3-енамида + TX (данное соединение может быть получено согласно способам, описанным в WO 2018/153707); N'-(2-хлор-5-метил-4-феноксифенил)-N-этил-N-метилформамина + TX; N'-[2-хлор-4-(2-фторфенокси)-5-метилфенил]-N-этил-N-метилформамина + TX (данное соединение может быть получено согласно способам, описанным в WO 2016/202742); 2-(дифторметил)-N-[(3S)-3-этил-1,1-диметилиндан-4-ил]пиридин-3-карбоксамида + TX (данное соединение может быть получено согласно способам, описанным в WO 2014/095675); (5-метил-2-пиридил)-[4-[5-(трифторметил)-1,2,4-оксадиазол-3-ил]фенил]метанона + TX, (3-метилизоксазол-5-ил)-[4-[5-(трифторметил)-1,2,4-оксадиазол-3-ил]фенил]метанона + TX (данные соединения могут быть получены согласно способам, описанным в WO 2017/220485); 2-оксо-N-пропил-2-[4-[5-(трифторметил)-1,2,4-оксадиазол-3-ил]фенил]ацетамида + TX (данное соединение может быть получено согласно способам, описанным в WO 2018/065414); этил-1-[[5-[5-(трифторметил)-1,2,4-оксадиазол-3-ил]-2-тиенил]метил]пиразол-4-карбоксилата + TX (данное соединение может быть получено согласно способам, описанным в WO 2018/158365); 2,2-дифтор-N-метил-2-[4-[5-(трифторметил)-1,2,4-оксадиазол-3-ил]фенил]ацетамида + TX, N-[(E)-метоксииминометил]-4-[5-(трифторметил)-1,2,4-оксадиазол-3-ил]бензамида + TX, N-[(Z)-метоксииминометил]-4-[5-(трифторметил)-1,2,4-оксадиазол-3-ил]бензамида + TX, N-[N-метокси-С-метил-карбонимидоил]-4-[5-(трифторметил)-1,2,4-оксадиазол-3-ил]бензамида + TX (данные соединения могут быть получены согласно способам, описанным в WO 2018/202428);

микроорганизмы, в том числе *Acinetobacter lwoffii* + TX, *Acremonium alternatum* + TX + TX, *Acremonium cephalosporium* + TX + TX, *Acremonium diospyri* + TX, *Acremonium obclavatum* + TX, *Adoxophyes orana granulovirus* (AdoxGV) (Capex®) + TX, *Agrobacterium radiobacter*, штамм K84 (Galltrol-A®) + TX, *Alternaria alternate* + TX, *Alternaria cassia* + TX, *Alternaria destruens* (Smolder®) + TX, *Ampelomyces quisqualis*

(AQ10®) + TX, *Aspergillus flavus* AF36 (AF36®) + TX, *Aspergillus flavus* NRRL 21882 (Aflaguard®) + TX, *Aspergillus* spp. + TX, *Aureobasidium pullulans* + TX, *Azospirillum* + TX, (MicroAZ® + TX, TAZO B®) + TX, *Azotobacter* + TX, *Azotobacter chroococcum* (Azotomeal®) + TX, цисты *Azotobacter* (Bionatural Blooming Blossoms®) + TX, *Bacillus amyloliquefaciens* + TX, *Bacillus cereus* + TX, *Bacillus chitinosporus*, штамм CM-1 + TX, *Bacillus chitinosporus*, штамм AQ746 + TX, *Bacillus licheniformis*, штамм HB-2 (Biostart™ Rhizoboost®) + TX, *Bacillus licheniformis*, штамм 3086 (EcoGuard® + TX, Green Releaf®) + TX, *Bacillus circulans* + TX, *Bacillus firmus* (BioSafe® + TX, BioNem-WP® + TX, VOTiVO®) + TX, *Bacillus firmus*, штамм I-1582 + TX, *Bacillus macerans* + TX, *Bacillus marismortui* + TX, *Bacillus megaterium* + TX, *Bacillus mycoides*, штамм AQ726 + TX, *Bacillus papillae* (Milky Spore Powder®) + TX, *Bacillus pumilus* spp. + TX, *Bacillus pumilus*, штамм GB34 (Yield Shield®) + TX, *Bacillus pumilus*, штамм AQ717 + TX, *Bacillus pumilus*, штамм QST 2808 (Sonata® + TX, Ballad Plus®) + TX, *Bacillus spahericus* (VectoLex®) + TX, *Bacillus* spp. + TX, *Bacillus* spp., штамм AQ175 + TX, *Bacillus* spp., штамм AQ177 + TX, *Bacillus* spp., штамм AQ178 + TX, *Bacillus subtilis*, штамм QST 713 (CEASE® + TX, Serenade® + TX, Rhapsody®) + TX, *Bacillus subtilis*, штамм QST 714 (JAZZ®) + TX, *Bacillus subtilis*, штамм AQ153 + TX, *Bacillus subtilis*, штамм AQ743 + TX, *Bacillus subtilis*, штамм QST3002 + TX, *Bacillus subtilis*, штамм QST3004 + TX, *Bacillus subtilis* разновидность *amyloliquefaciens*, штамм FZB24 (Taegro® + TX, Rhizopro®) + TX, Cry 2Ae *Bacillus thuringiensis* + TX, Cry1Ab *Bacillus thuringiensis* + TX, *Bacillus thuringiensis aizawai* GC 91 (Agree®) + TX, *Bacillus thuringiensis israelensis* (BMP123® + TX, Aquabac® + TX, VectoBac®) + TX, *Bacillus thuringiensis kurstaki* (Javelin® + TX, Deliver® + TX, CryMax® + TX, Bonide® + TX, Scutella WP® + TX, Turilav WP® + TX, Astuto® + TX, Dipel WP® + TX, Biobit® + TX, Foray®) + TX, *Bacillus thuringiensis kurstaki* BMP 123 (Baritone®) + TX, *Bacillus thuringiensis kurstaki* HD-1 (Bioprotec-CAF/3P®) + TX, *Bacillus thuringiensis*, штамм BD№32 + TX, *Bacillus thuringiensis*, штамм AQ52 + TX, *Bacillus thuringiensis* разновидность *aizawai* (XenTari® + TX, DiPel®) + TX, разновидности бактерий (GROWMEND® + TX, GROWSWEET® + TX, Shootup®) + TX, бактериофаг *Clavipacter michiganensis* (AgriPhage®) + TX, Bakflor® + TX, *Beauveria bassiana* (Beaugenic® + TX, Brocaril WP®) + TX, *Beauveria bassiana* GHA (Mycotrol ES® + TX, Mycotrol O® + TX, BotaniGuard®) + TX, *Beauveria brongniartii* (Engerlingspilz® + TX, Schweizer Beauveria® + TX, Melocont®) + TX, *Beauveria* spp. + TX, *Botrytis cineria* + TX, *Bradyrhizobium*

japonicum (TerraMax®) + TX, *Brevibacillus brevis* + TX, *Bacillus thuringiensis tenebrionis* (Novodor®) + TX, BtBooster + TX, *Burkholderia cepacia* (Deny® + TX, Intercept® + TX, Blue Circle®) + TX, *Burkholderia gladii* + TX, *Burkholderia gladioli* + TX, *Burkholderia* spp. + TX, грибок полевого бодяка (CBH Canadian Bioherbicide®) + TX, *Candida butyri* + TX, *Candida famata* + TX, *Candida fructus* + TX, *Candida glabrata* + TX, *Candida guilliermondii* + TX, *Candida melibiosica* + TX, *Candida oleophila*, штамм O + TX, *Candida parapsilosis* + TX, *Candida pelliculosa* + TX, *Candida pulcherrima* + TX, *Candida reukaufii* + TX, *Candida saitoana* (Bio-Coat® + TX, Biocure®) + TX, *Candida sake* + TX, *Candida* spp. + TX, *Candida tenuis* + TX, *Cedecea dravisae* + TX, *Cellulomonas flavigena* + TX, *Chaetomium cochliodes* (Nova-Cide®) + TX, *Chaetomium globosum* (Nova-Cide®) + TX, *Chromobacterium subtsugae*, штамм PRAA4-1T (Grandevo®) + TX, *Cladosporium cladosporioides* + TX, *Cladosporium oxysporum* + TX, *Cladosporium chlorocephalum* + TX, *Cladosporium* spp. + TX, *Cladosporium tenuissimum* + TX, *Clonostachys rosea* (EndoFine®) + TX, *Colletotrichum acutatum* + TX, *Coniothyrium minitans* (Cotans WG®) + TX, *Coniothyrium* spp. + TX, *Cryptococcus albidus* (YIELDPLUS®) + TX, *Cryptococcus humicola* + TX, *Cryptococcus infirmo-miniatus* + TX, *Cryptococcus laurentii* + TX, *Cryptophlebia leucotreta gramulovirus* (Cryptex®) + TX, *Cupriavidus campinensis* + TX, *Cydia pomonella gramulovirus* (CYD-X®) + TX, *Cydia pomonella gramulovirus* (Madex® + TX, Madex Plus® + TX, Madex Max/Carpovirusine®) + TX, *Cylindrobasidium laeve* (Stumpout®) + TX, *Cylindrocladium* + TX, *Debaryomyces hansenii* + TX, *Drechslera hawaiiensis* + TX, *Enterobacter cloacae* + TX, *Enterobacteriaceae* + TX, *Entomophthora virulenta* (Vektor®) + TX, *Epicoccum nigrum* + TX, *Epicoccum purpurascens* + TX, *Epicoccum* spp. + TX, *Filobasidium floriforme* + TX, *Fusarium acuminatum* + TX, *Fusarium chlamydosporum* + TX, *Fusarium oxysporum* (Fusaclean®/Biofox C®) + TX, *Fusarium proliferatum* + TX, *Fusarium* spp. + TX, *Galactomyces geotrichum* + TX, *Gliocladium catemulatum* (Primastop® + TX, Prestop®) + TX, *Gliocladium roseum* + TX, *Gliocladium* spp. (SoilGard®) + TX, *Gliocladium virens* (Soilgard®) + TX, *Gramulovirus* (Granupom®) + TX, *Halobacillus halophilus* + TX, *Halobacillus litoralis* + TX, *Halobacillus trueperi* + TX, *Halomonas* spp. + TX, *Halomonas subglaciescola* + TX, *Halovibrio variabilis* + TX, *Hanseniaspora uvarum* + TX, вирус ядерного полиэдроса *Helicoverpa armigera* (Helicovex®) + TX, вирус ядерного полиэдроса *Helicoverpa zea* (Gemstar®) + TX, изофлавоон – формононетин (Myconate®) + TX, *Kloeckera apiculata* + TX, *Kloeckera* spp. + TX, *Lagenidium giganteum* (Laginex®) + TX, *Lecanicillium longisporum* (Vertiblast®) +

TX, *Lecanicillium muscarium* (Vertikil®) + TX, вирус ядерного полиэдроза *Lymantria Dispar* (Disparvirus®) + TX, *Marinococcus halophilus* + TX, *Meira geulakonigii* + TX, *Metarhizium anisopliae* (Met52®) + TX, *Metarhizium anisopliae* (Destruxin WP®) + TX, *Metschnikowia fruticola* (Shemer®) + TX, *Metschnikowia pulcherrima* + TX, *Microdochium dimerum* (Antibot®) + TX, *Micromonospora coerulea* + TX, *Microsphaeropsis ochracea* + TX, *Muscodor albus* 620 (Muscudor®) + TX, *Muscodor roseus*, штамм A3-5 + TX, *Mycorrhizae* spp. (AMykor® + TX, Root Maximizer®) + TX, *Myrothecium verrucaria*, штамм AARC-0255 (DiTera®) + TX, BROS PLUS® + TX, *Ophiostoma piliferum*, штамм D97 (Sylvanex®) + TX, *Paecilomyces farinosus* + TX, *Paecilomyces fumosoroseus* (PFR-97®) + TX, PreFeRal®) + TX, *Paecilomyces linacinus* (Biostat WP®) + TX, *Paecilomyces lilacinus*, штамм 251 (MeloCon WG®) + TX, *Paenibacillus polymyxa* + TX, *Pantoea agglomerans* (BlightBan C9-1®) + TX, *Pantoea* spp. + TX, *Pasteuria* spp. (Econem®) + TX, *Pasteuria nishizawae* + TX, *Penicillium aurantiogriseum* + TX, *Penicillium billai* (Jumpstart® + TX, TagTeam®) + TX, *Penicillium brevicompactum* + TX, *Penicillium frequentans* + TX, *Penicillium griseofulvum* + TX, *Penicillium purpurogenum* + TX, *Penicillium* spp. + TX, *Penicillium viridicatum* + TX, *Phlebiopsis gigantea* (Rotstop®) + TX, солюбилизирующие фосфаты бактерии (Phosphomeal®) + TX, *Phytophthora cryptogea* + TX, *Phytophthora palmivora* (Devine®) + TX, *Pichia anomala* + TX, *Pichia guilermundii* + TX, *Pichia membranaefaciens* + TX, *Pichia onychis* + TX, *Pichia stipites* + TX, *Pseudomonas aeruginosa* + TX, *Pseudomonas aureofasciens* (Spot-Less Biofungicide®) + TX, *Pseudomonas cepacia* + TX, *Pseudomonas chlororaphis* (AtEze®) + TX, *Pseudomonas corrugate* + TX, *Pseudomonas fluorescens*, штамм A506 (BlightBan A506®) + TX, *Pseudomonas putida* + TX, *Pseudomonas reactans* + TX, *Pseudomonas* spp. + TX, *Pseudomonas syringae* (Bio-Save®) + TX, *Pseudomonas viridiflava* + TX, *Pseudomonas fluorescens* (Zequanox®) + TX, *Pseudozyma flocculosa*, штамм PF-A22 UL (Sporodex L®) + TX, *Puccinia canaliculata* + TX, *Puccinia thlaspeos* (Wood Warrior®) + TX, *Pythium paroecandrum* + TX, *Pythium oligandrum* (Polygandron® + TX, Polyversum®) + TX, *Pythium periplocum* + TX, *Rhanella aquatilis* + TX, *Rhanella* spp. + TX, *Rhizobia* (Dormal® + TX, Vault®) + TX, *Rhizoctonia* + TX, *Rhodococcus globerulus*, штамм AQ719 + TX, *Rhodosporidium diobovatum* + TX, *Rhodosporidium toruloides* + TX, *Rhodotorula* spp. + TX, *Rhodotorula glutinis* + TX, *Rhodotorula graminis* + TX, *Rhodotorula mucilagnosa* + TX, *Rhodotorula rubra* + TX, *Saccharomyces cerevisiae* + TX, *Salinococcus roseus* + TX, *Sclerotinia minor* + TX, *Sclerotinia minor* (SARRITOR®) + TX, *Scytalidium* spp. + TX,

Scytalidium uredinicola + TX, вирус ядерного полиэдроза *Spodoptera exigua* (Spod-X® + TX, Spexit®) + TX, *Serratia marcescens* + TX, *Serratia plymuthica* + TX, *Serratia* spp. + TX, *Sordaria fimicola* + TX, вирус ядерного полиэдроза *Spodoptera littoralis* (Littovir®) + TX, *Sporobolomyces roseus* + TX, *Stenotrophomonas maltophilia* + TX, *Streptomyces ahgrosopicus* + TX, *Streptomyces albaduncus* + TX, *Streptomyces exfoliates* + TX, *Streptomyces galbus* + TX, *Streptomyces griseoplanus* + TX, *Streptomyces griseoviridis* (Mycostop®) + TX, *Streptomyces lydicus* (Actinovate®) + TX, *Streptomyces lydicus* WYEC-108 (ActinoGrow®) + TX, *Streptomyces violaceus* + TX, *Tilletiopsis minor* + TX, *Tilletiopsis* spp. + TX, *Trichoderma asperellum* (T34 Biocontrol®) + TX, *Trichoderma gamsii* (Tenet®) + TX, *Trichoderma atroviride* (Plantmate®) + TX, *Trichoderma hamatum* TH 382 + TX, *Trichoderma harzianum rifai* (Mycostar®) + TX, *Trichoderma harzianum* T-22 (Trianum-P®) + TX, PlantShield HC® + TX, RootShield® + TX, Trianum-G®) + TX, *Trichoderma harzianum* T-39 (Trichodex®) + TX, *Trichoderma inhamatum* + TX, *Trichoderma koningii* + TX, *Trichoderma* spp. LC 52 (Sentinel®) + TX, *Trichoderma lignorum* + TX, *Trichoderma longibrachiatum* + TX, *Trichoderma polysporum* (Binab T®) + TX, *Trichoderma taxi* + TX, *Trichoderma virens* + TX, *Trichoderma virens* (ранее *Gliocladium virens* GL-21) (SoilGuard®) + TX, *Trichoderma viride* + TX, *Trichoderma viride*, штамм ICC 080 (Remedier®) + TX, *Trichosporon pullulans* + TX, *Trichosporon* spp. + TX, *Trichothecium* spp. + TX, *Trichothecium roseum* + TX, *Typhula phacorrhiza*, штамм 94670 + TX, *Typhula phacorrhiza*, штамм 94671 + TX, *Ulocladium atrum* + TX, *Ulocladium oudemansii* (Botry-Zen®) + TX, *Ustilago maydis* + TX, различные бактерии и дополнительные микроэлементы (Natural П®) + TX, различные грибы (Millennium Microbes®) + TX, *Verticillium chlamydosporium* + TX, *Verticillium lecanii* (Mycotal® + TX, Vertalec®) + TX, Vip3Aa20 (VIPtera®) + TX, *Virgibacillus marismortui* + TX, *Xanthomonas campestris* pv. *Poae* (Camperico®) + TX, *Xenorhabdus bovienii* + TX, *Xenorhabdus nematophilus*; экстракты растений, в том числе сосновое масло (Retenol®) + TX, азадирахтин (Plasma Neem Oil® + TX, AzaGuard® + TX, MeemAzal® + TX, Molt-X® + TX, Botanical IGR (Neemazad® + TX, Neemix®) + TX, каноловое масло (Lilly Miller Vegol®) + TX, *Chenopodium ambrosioides near ambrosioides* (Requiem®) + TX, экстракт *Chrysanthemum* (Crisant®) + TX, экстракт масла маргозы (Trilogy®) + TX, эфирные масла *Labiatae* (Botania®) + TX, экстракты масла гвоздики, розмарина, перечной мяты и тимьяна (Garden insect killer®) + TX, глицинбетаин (Greenstim®) + TX, чеснок + TX, масло лемонграсса (GreenMatch®) + TX, масло маргозы + TX, *Nepeta cataria* (масло

- котовника кошачьего) + TX, *Nepeta catarina* + TX, никотин + TX, масло душицы (MossBuster®) + TX, масло *Pedaliaceae* (Nematon®) + TX, пиретрум + TX, *Quillaja saponaria* (NemaQ®) + TX, *Reynoutria sachalinensis* (Regalia® + TX, Sakalia®) + TX, ротенон (Eco Roten®) + TX, экстракт растений из семейства *Rutaceae* (Soleo®) + TX,
- 5 соевое масло (Ortho ecosense®) + TX, масло чайного дерева (Timorex Gold®) + TX, масло тимьяна + TX, AGNIQUE® MMF + TX, BugOil® + TX, смесь экстрактов розмарина, кунжута, перечной мяты, тимьяна и корицы (EF 300®) + TX, смесь экстрактов гвоздики, розмарина и перечной мяты (EF 400®) + TX, смесь гвоздики, перечной мяты, масла чеснока и мяты (Soil Shot®) + TX, каолин (Screen®) + TX,
- 10 глюкан, который запасают бурые водоросли (Laminarin®);
- феромоны, в том числе феромон листовертки черноголовой (3M Sprayable Blackheaded Fireworm Pheromone®) + TX, феромон яблоневого плодового жорки (Paramount dispenser-(CM)/ Isomate C-Plus®) + TX, феромон листовертки виноградной (3M MEC-GBM Sprayable Pheromone®) + TX, феромон листовертки (3M MEC – LR Sprayable
- 15 Pheromone®) + TX, мускамон (Snip7 Fly Bait® + TX, Starbar Premium Fly Bait®) + TX, феромон листовертки восточной персиковой (3M oriental fruit moth sprayable pheromone®) + TX, феромон стеклянницы персиковой (Isomate-P®) + TX, феромон томатной остроты (3M Sprayable pheromone®) + TX, Entostat в виде порошка (экстракт пальмового дерева) (Exosex CM®) + TX, (E + TX,Z + TX,Z)-3 + TX,8 + TX,11
- 20 тетрадекатриенилацетат + TX, (Z + TX,Z + TX,E)-7 + TX,11 + TX,13-гексадекатриеналь + TX, (E + TX,Z)-7 + TX,9-додекадиен-1-илацетат + TX, 2-метил-1-бутанол + TX, ацетат кальция + TX, Scenturion® + TX, Biolure® + TX, Check-Mate® + TX, лавандулилсенеционат;
- макроорганизмы, в том числе *Aphelinus abdominalis* + TX, *Aphidius ervi* (Aphelinus-
- 25 System®) + TX, *Acerophagus papaya* + TX, *Adalia bipunctata* (Adalia-System®) + TX, *Adalia bipunctata* (Adaline®) + TX, *Adalia bipunctata* (Aphidalia®) + TX, *Ageniaspis citricola* + TX, *Ageniaspis fuscicollis* + TX, *Amblyseius andersoni* (Anderline® + TX, Andersoni-System®) + TX, *Amblyseius californicus* (Amblyline® + TX, Spical®) + TX, *Amblyseius cucumeris* (Thripex® + TX, Bugline cucumeris®) + TX, *Amblyseius fallacis*
- 30 (Fallacis®) + TX, *Amblyseius swirskii* (Bugline swirskii® + TX, Swirskii-Mite®) + TX, *Amblyseius womersleyi* (WomerMite®) + TX, *Amitus hesperidum* + TX, *Anagrus atomus* + TX, *Anagrus fusciventris* + TX, *Anagrus kamali* + TX, *Anagrus loeckii* + TX, *Anagrus pseudococci* (Citripar®) + TX, *Anicetus benefices* + TX, *Anisopteromalus calandrae* + TX,

Anthocoris nemoralis (Anthocoris-System®) + TX, *Aphelinus abdominalis* (Apheline® + TX, Aphiline®) + TX, *Aphelinus asychis* + TX, *Aphidius colemani* (Aphipar®) + TX, *Aphidius ervi* (Ervipar®) + TX, *Aphidius gifuensis* + TX, *Aphidius matricariae* (Aphipar-M®) + TX, *Aphidoletes aphidimyza* (Aphidend®) + TX, *Aphidoletes aphidimyza* (Aphidoline®) + TX,

5 *Aphytis lingnanensis* + TX, *Aphytis melinus* + TX, *Aprostocetus hagenowii* + TX, *Atheta coriaria* (Staphyline®) + TX, *Bombus* spp. + TX, *Bombus terrestris* (Natupol Beehive®) + TX, *Bombus terrestris* (Beeline® + TX, Tripol®) + TX, *Cephalonomia stephanoderis* + TX, *Chilocorus nigritus* + TX, *Chrysoperla carnea* (Chrysoline®) + TX, *Chrysoperla carnea* (Chrysopa®) + TX, *Chrysoperla rufilabris* + TX, *Cirrospilus ingenuus* + TX, *Cirrospilus quadristriatus* + TX, *Citrostichus phyllocnistoides* + TX, *Closterocerus chamaeleon* + TX, *Closterocerus* spp. + TX, *Coccidoxenoides perminutus* (Planopar®) + TX, *Coccophagus cowperi* + TX, *Coccophagus lycimnia* + TX, *Cotesia flavipes* + TX, *Cotesia plutellae* + TX, *Cryptolaemus montrouzieri* (Cryptobug® + TX, Cryptoline®) + TX, *Cybocephalus nipponicus* + TX, *Dacnusa sibirica* + TX, *Dacnusa sibirica* (Minusa®) + TX, *Diglyphus isaea* (Diminex®) + TX, *Delphastus catalinae* (Delphastus®) + TX, *Delphastus pusillus* + TX, *Diachasmimorpha krausii* + TX, *Diachasmimorpha longicaudata* + TX, *Diaparsis jucunda* + TX, *Diaphorencyrtus aligarhensis* + TX, *Diglyphus isaea* + TX, *Diglyphus isaea* (Miglyphus® + TX, Digline®) + TX, *Dacnusa sibirica* (DacDigline® + TX, Minex®) + TX, *Diversinervus* spp. + TX, *Encarsia citrina* + TX, *Encarsia formosa* (Encarsia max® + TX,

20 Encarline® + TX, En-Strip®) + TX, *Eretmocerus eremicus* (Enermix®) + TX, *Encarsia guadeloupeae* + TX, *Encarsia haitiensis* + TX, *Episyrphus balteatus* (Syrphidend®) + TX, *Eretmoceris siphonini* + TX, *Eretmocerus californicus* + TX, *Eretmocerus eremicus* (Ercal® + TX, Eretline e®) + TX, *Eretmocerus eremicus* (Bemimix®) + TX, *Eretmocerus hayati* + TX, *Eretmocerus mundus* (Bemipar® + TX, Eretline m®) + TX, *Eretmocerus siphonini* + TX, *Exochomus quadripustulatus* + TX, *Feltiella acarisuga* (Spidend®) + TX, *Feltiella acarisuga* (Feltiline®) + TX, *Fopius arisanus* + TX, *Fopius ceratitivorus* + TX, формонетин (Wirless Beehome®) + TX, *Franklinothrips vespiformis* (Vespop®) + TX, *Galendromus occidentalis* + TX, *Goniozus legneri* + TX, *Habrobracon hebetor* + TX, *Harmonia axyridis* (HarmoBeetle®) + TX, *Heterorhabditis* spp. (Lawn Patrol®) + TX,

30 *Heterorhabditis bacteriophora* (NemaShield HB® + TX, Nemaseek® + TX, Terranem-Nam® + TX, Terranem® + TX, Larvanem® + TX, B-Green® + TX, NemAttack® + TX, Nematop®) + TX, *Heterorhabditis megidis* (Nemasys H® + TX, BioNem H® + TX, Exhibitline hm® + TX, Larvanem-M®) + TX, *Hippodamia convergens* + TX, *Hypoaspis*

aculeifer (Aculeifer-System® + TX, Entomite-A®) + TX, *Hypoaspis miles* (Hypoline m® + TX, Entomite-M®) + TX, *Lbalia leucospoides* + TX, *Lecanoideus floccissimus* + TX, *Lemophagus errabundus* + TX, *Leptomastidea abnormis* + TX, *Leptomastix dactylopii* (Leptopar®) + TX, *Leptomastix epona* + TX, *Lindorus lophanthae* + TX, *Lipolexis oregmae* + TX, *Lucilia caesar* (NatuFly®) + TX, *Lysiphlebus testaceipes* + TX, *Macrolophus caliginosus* (Mirical-N® + TX, Macroline c® + TX, Mirical®) + TX, *Mesoseiulus longipes* + TX, *Metaphycus flavus* + TX, *Metaphycus lounsburyi* + TX, *Micromus angulatus* (Milacewing®) + TX, *Microterys flavus* + TX, *Muscidifurax raptorellus* и *Spalangia cameroni* (Biopar®) + TX, *Neodryinus typhlocybae* + TX, *Neoseiulus californicus* + TX, *Neoseiulus cucumeris* (THRYPEX®) + TX, *Neoseiulus fallacis* + TX, *Nesideocoris tenuis* (NesidioBug® + TX, Nesibug®) + TX, *Ophyra aenescens* (Biofly®) + TX, *Orius insidiosus* (Thripor-I® + TX, Oriline i®) + TX, *Orius laevigatus* (Thripor-L® + TX, Oriline l®) + TX, *Orius majusculus* (Oriline m®) + TX, *Orius strigicollis* (Thripor-S®) + TX, *Pauesia juniperorum* + TX, *Pediobius foveolatus* + TX, *Phasmarhabditis hermaphrodita* (Nemaslug®) + TX, *Phymastichus coffea* + TX, *Phytoseiulus macropilus* + TX, *Phytoseiulus persimilis* (Spidex® + TX, Phytoline p®) + TX, *Podisus maculiventris* (Podisus®) + TX, *Pseudacteon curvatus* + TX, *Pseudacteon obtusus* + TX, *Pseudacteon tricuspis* + TX, *Pseudaphycus maculipennis* + TX, *Pseudleptomastix mexicana* + TX, *Psyllaephagus pilosus* + TX, *Psytalia concolor* (комплекс видов) + TX, *Quadrastichus* spp. + TX, *Rhizobius lophanthae* + TX, *Rodolia cardinalis* + TX, *Rumina decollate* + TX, *Semielacher petiolatus* + TX, *Sitobion avenae* (Ervibank®) + TX, *Steinernema carpocapsae* (Nematac C® + TX, Millenium® + TX, BioNem C® + TX, NemAttack® + TX, Nemastar® + TX, Capsanem®) + TX, *Steinernema feltiae* (NemaShield® + TX, Nemasys F® + TX, BioNem F® + TX, Steinernema-System® + TX, NemAttack® + TX, Nemaplus® + TX, Exhibitline sf® + TX, Scia-rid® + TX, Entonem®) + TX, *Steinernema kraussei* (Nemasys L® + TX, BioNem L® + TX, Exhibitline srb®) + TX, *Steinernema riobrave* (BioVector® + TX, BioVektor®) + TX, *Steinernema scapterisci* (Nematac S®) + TX, *Steinernema* spp. + TX, *Steinernematid* spp. (Guardian Nematodes®) + TX, *Stethorus punctillum* (Stethorus®) + TX, *Tamarixia radiata* + TX, *Tetrastichus setifer* + TX, *Thripobius semiluteus* + TX, *Torymus sinensis* + TX, *Trichogramma brassicae* (Tricholine b®) + TX, *Trichogramma brassicae* (Tricho-Strip®) + TX, *Trichogramma evanescens* + TX, *Trichogramma minutum* + TX, *Trichogramma ostriniae* + TX, *Trichogramma platneri* + TX, *Trichogramma pretiosum* + TX, *Xanthopimpla stemmator*;

другие биологические средства, в том числе абсцизовая кислота + TX, bioSea® + TX, *Chondrostereum purpureum* (Chontrol Paste®) + TX, *Colletotrichum gloeosporioides* (Collego®) + TX, октаноат меди (Cueva®) + TX, дельтовидные ловушки (Trapline d®) + TX, *Erwinia amylovora* (харпин) (ProAct® + TX, Ni-HIBIT Gold CST®) + TX, жирные кислоты, полученные из природного побочного продукта изготовления оливкового масла экстра класса (FLIPPER®) + TX, феррофосфат (Ferramol®) + TX, воронковидные ловушки (Trapline y®) + TX, Gallex® + TX, Grower's Secret® + TX, гомобрассинолид + TX, фосфат железа (Lilly Miller Worry Free Ferramol Slug & Snail Bait®) + TX, ловушка MCP hail (Trapline f®) + TX, *Microctonus hyperodae* + TX, *Mycoleptodiscus terrestris* (Des-X®) + TX, BioGain® + TX, Aminomite® + TX, Zenox® + TX, феромонная ловушка (Thripline ams®) + TX, бикарбонат калия (MilStop®) + TX, калиевые соли жирных кислот (Sanova®) + TX, раствор силиката калия (Sil-Matrix®) + TX, йодид калия + тиоцианат калия (Enzicur®) + TX, SuffOil-X® + TX, яд паука + TX, *Nosema locustae* (Semaspore Organic Grasshopper Control®) + TX, клеевые ловушки (Trapline YF® + TX, 15 *Rebell Amarillo*®) + TX и ловушки (Takitrapline y + b®) + TX;

(1) антибактериальные средства, выбранные из группы, состоящей из:

(1.1) бактерий, примерами которых являются штамм R3B *Bacillus mojavensis* (номер доступа в NCAIM (P) B001389) (WO 2013/034938) от Certis USA LLC, дочерней компании Mitsui & Co. + TX; *Bacillus pumilus*, в частности, штамм BU F-33 с номером доступа в NRRL 50185 (доступный в качестве части продукта CARTISSA® от BASF, регистрационный номер в EPA 71840-19) + TX; *Bacillus subtilis*, в частности, штамм QST713/AQ713 (доступный как SERENADE OPTI или SERENADE ASO от Bayer CropScience LP, США, с номером доступа в NRRL B21661, патент США № 6060051) + TX; штамм BU1814 *Bacillus subtilis* (доступный как VELONDIS® PLUS, VELONDIS® 25 FLEX и VELONDIS® EXTRA от BASF SE) + TX; штамм FZB24 *Bacillus subtilis* var. *Amyloliquefaciens* с номером доступа DSM 10271 (доступный от Novozymes как TAEGRO® или TAEGRO® ECO (регистрационный номер в EPA 70127-5)) + TX; *Bacillus subtilis* CX-9060 от Certis USA LLC, дочерней компании Mitsui & Co. + TX; *Bacillus* sp., в частности, штамм D747 (доступный как DOUBLE NICKEL® от Kumiai 30 Chemical Industry Co., Ltd.) с номером доступа FERM BP-8234, патент США № 7094592, + TX; штамм *Paenibacillus* sp. с номером доступа NRRL B-50972 или номером доступа NRRL B-67129, WO 2016/154297, + TX; *Paenibacillus polymyxa*, в частности, штамм AC-1 (например, TOPSEED® от Green Biotech Company Ltd.) + TX;

Pantoea agglomerans, в частности, штамм E325 (номер доступа NRRL B-21856) (доступный как BLOOMTIME BIOLOGICAL™ FD BIOPESTICIDE от Northwest Agri Products) + TX; *Pseudomonas proradix* (например, PRORADIX® от Sourcon Padena) + TX; и

5 (1.2) грибов, примерами которых являются *Aureobasidium pullulans*, в частности, бластоспоры штамма DSM14940, бластоспоры штамма DSM 14941 или смеси бластоспор штаммов DSM14940 и DSM14941 (например, BOTECTOR® и BLOSSOM PROTECT® от bio-ferm, Швейцария) + TX; *Pseudozyma aphidis* (раскрытый в WO 2011/151819 от Yissum Research Development Company Еврейского университета в 10 Иерусалиме) + TX; *Saccharomyces cerevisiae*, в частности, штаммы CNCM № 1-3936, CNCM № 1-3937, CNCM № 1-3938 или CNCM № 1-3939 (WO 2010/086790) от Lesaffre et Compagnie, Франция;

(2) биологические фунгициды, выбранные из группы, состоящей из:

(2.1) бактерий, примерами которых являются штамм K84 *Agrobacterium radiobacter* 15 (например, GALLTROL-A® от AgBioChem, Калифорния) + TX; штамм K1026 *Agrobacterium radiobacter* (например, NOGALL™ от BASF SE) + TX; штамм FZB24 *Bacillus subtilis* var. *amyloliquefaciens* с номером доступа DSM 10271 (доступный от Novozymes как TAEGRO® или TAEGRO® ECO (регистрационный номер в EPA 70127-5)) + TX; *Bacillus amyloliquefaciens*, в частности, штамм D747 (доступный как Double 20 Nickel™ от Kumiai Chemical Industry Co., Ltd. с номером доступа FERM BP-8234, патент США № 7094592) + TX; штамм F727 *Bacillus amyloliquefaciens* (также известный как штамм MBI110) (номер доступа в NRRL B-50768, WO 2014/028521) (STARGUS® от Marrone Bio Innovations) + TX; штамм FZB42 *Bacillus amyloliquefaciens*, номер доступа DSM 23117 (доступный как RHIZOVITAL® от AViTEP, Германия) + TX; 25 изолят B246 *Bacillus amyloliquefaciens* (например, AVOGREEN™ от Университета Претории) + TX; *Bacillus licheniformis*, в частности, штамм SB3086 с номером доступа ATCC 55406, WO 2003/000051 (доступный как ECOGUARD® Biofungicide и GREEN RELEAF™ от Novozymes) + TX + TX; *Bacillus licheniformis* FMCH001 и *Bacillus subtilis* FMCH002 (QUARTZO® (WG) и PRESENCE® (WP) от FMC Corporation) + TX; штамм 30 ВАС-9912 *Bacillus methylotrophicus* (от Института прикладной экологии академии наук Китая) + TX; штамм R3B *Bacillus mojavensis* (номер доступа в NCAIM (P) B001389) (WO 2013/034938) от Certis USA LLC, дочерней компании Mitsui & Co. + TX; изолят *Bacillus mycoides* с номером доступа B-30890 (доступный как BMJ TGAi® или WG и

LifeGard™ от Certis USA LLC, дочерней компании Mitsui & Co.) + TX; *Bacillus pumilus*, в частности, штамм QST2808 (доступный как SONATA® от Bayer CropScience LP, США, с номером доступа NRRL B-30087 и описанный в патенте США № 6245551) + TX; *Bacillus pumilus*, в частности, штамм GB34 (доступный как Yield Shield® от Bayer AG, Германия) + TX; *Bacillus pumilus*, в частности, штамм BU F-33 с номером доступа в NRRL 50185 (доступный в качестве части продукта CARTISSA от BASF, регистрационный номер в EPA 71840-19) + TX; *Bacillus subtilis*, в частности, штамм QST713/AQ713 (доступный как SERENADE OPTI или SERENADE ASO от Bayer CropScience LP, США, с номером доступа в NRRL B21661 и описанный в патенте США № 6060051) + TX; *Bacillus subtilis* Y1336 (доступный как BIOBAC® WP от Bion-Tech, Тайвань, зарегистрированный в качестве биологического фунгицида в Тайване под регистрационными №№ 4764, 5454, 5096 и 5277) + TX; штамм MBI 600 *Bacillus subtilis* (доступный как SUBTILEX от BASF SE) с номером доступа NRRL B-50595, патент США № 5061495 + TX; штамм GB03 *Bacillus subtilis* (доступный как Kodiak® от Bayer AG, Германия) + TX; штамм BU1814 *Bacillus subtilis* (доступный как VELONDIS® PLUS, VELONDIS® FLEX и VELONDIS® EXTRA от BASF SE) + TX; *Bacillus subtilis* CX-9060 от Certis USA LLC, дочерней компании Mitsui & Co. + TX; штамм KTSB *Bacillus subtilis* (FOLIACTIVE® от Donaghys) + TX; *Bacillus subtilis* IAB/BS03 (AVIV™ от STK Bio-Ag Technologies, PORTENTO® от Idai Nature) + TX; штамм Y1336 *Bacillus subtilis* (доступный как BIOBAC® WP от Bion-Tech, Тайвань, зарегистрированный в качестве биологического фунгицида в Тайване под регистрационными №№ 4764, 5454, 5096 и 5277) + TX; *Paenibacillus epiphyticus* (WO 2016/020371) от BASF SE + TX; *Paenibacillus polymyxa* ssp. *plantarum* (WO 2016/020371) от BASF SE + TX; штамм *Paenibacillus* sp. с номером доступа NRRL B-50972 или номером доступа NRRL B-67129, WO 2016/154297 + TX; штамм AFS009 *Pseudomonas chlororaphis* с номером доступа NRRL B-50897, WO 2017/019448 (например, HOWLER™ и ZIO® от AgBiome Innovations, США) + TX; *Pseudomonas chlororaphis*, в частности, штамм MA342 (например, CEDOMON®, CERALL® и CEDRESS® от Bioagri и Koppert) + TX; штамм A506 *Pseudomonas fluorescens* (например, BLIGHTBAN® A506 от NuFarm) + TX; *Pseudomonas proradix* (например, PRORADIX® от Sourcon Padena) + TX; штамм K61 *Streptomyces griseoviridis* (также известный как штамм K61 *Streptomyces galbus*) (номер доступа DSM 7206) (MYCOSTOP® от Verdara, PREFERENCE® от BioWorks, ср. Crop Protection 2006, 25, 468-475) + TX; штамм WYEC108 *Streptomyces lydicus* (также

известный как штамм WYCD108US *Streptomyces lydicus*) (ACTINO-IRON® и ACTINOVATE® от Novozymes) + TX; и

(2.2) грибов, примерами которых являются *Ampelomyces quisqualis*, в частности, штамм AQ 10 (например, AQ 10® от Intrachem Bio Italia) + TX; штамм AQ10 *Ampelomyces quisqualis* с номером доступа CNCM 1-807 (например, AQ 10® от Intrachem Bio Italia) + TX; штамм NRRL 21882 *Aspergillus flavus* (продукты, известные как AFLA-GUARD® от Syngenta/ChemChina) + TX; *Aureobasidium pullulans*, в частности, бластоспоры штамма DSM14940 + TX; *Aureobasidium pullulans*, в частности, бластоспоры штамма DSM 14941 + TX; *Aureobasidium pullulans*, в частности, смеси бластоспор штаммов DSM14940 и DSM 14941 (например, Botector® от bio-ferm, Швейцария) + TX; *Chaetomium cupreum* (номер доступа CABI 353812) (например, BИOKUPRUM™ от AgriLife) + TX; *Chaetomium globosum* (доступный как RIVADIOM® от Rivale) + TX; *Cladosporium cladosporioides*, штамм H39 с номером доступа CBS122244, US 2010/0291039 (от Stichting Dienst Landbouwkundig Onderzoek) + TX; *Coniothyrium minitans*, в частности, штамм CON/M/91-8 (номер доступа DSM9660, например, Contans® от Bayer CropScience Biologics GmbH) + TX; *Cryptococcus flavescens*, штамм 3C (NRRL Y-50378) (B2.2.99) + TX; *Dactylaria candida* + TX; *Dilophosphora alopecuri* (доступный как TWIST FUNGUS®) + TX; *Fusarium oxysporum*, штамм Fo47 (доступный как FUSACLEAN® от Natural Plant Protection) + TX; *Gliocladium catenulatum* (синоним: *Clonostachys rosea* f. *catenulate*), штамм J1446 (например, Prestop® от Lallemand) + TX; *Gliocladium roseum* (также известный как *Clonostachys rosea* f. *rosea*), в частности, штамм 321U от Adjuvants Plus, штамм ACM941, раскрытый 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* strain 'IK726', Australas Plant Pathol. 2007,36:95-101) + TX; конидии штамма KV01 *Lecanicillium lecanii* (ранее известного как *Verticillium lecanii*) (например, Vertalec® от Koppert/Arysta) + TX; *Metschnikowia fructicola*, в частности, штамм NRRL Y-30752 (B2.2.3) + TX; *Microsphaeropsis ochracea* + TX; *Muscodor roseus*, в частности, штамм A3-5 (номер доступа NRRL 30548) + TX; *Penicillium steckii* (DSM 27859, WO 2015/067800) от BASF SE + TX; *Penicillium vermiculatum* + TX; *Phlebiopsis gigantea*, штамм VRA 1992 (ROTSTOP® C от Danstar Ferment) + TX; *Pichia anomala*, штамм WRL-076 (NRRL Y-30842), патент США

№ 7579183, + TX; *Pseudozyma flocculosa*, штамм PF-A22 UL (доступный как SPORODEX® L от Plant Products Co., Калифорния) + TX; *Saccharomyces cerevisiae*, в частности, штамм LASO2 (от Agro-Levures et Dérivés), клеточные стенки штамма LAS117 (CEREVISANE® от Lesaffre, ROMEO® от BASF SE), штаммы CNCM № 1-3936, CNCM № 1-3937, CNCM № 1-3938, CNCM № 1-3939 (WO 2010/086790) от Lesaffre et Compagnie, Франция, + TX; *Simplicillium lanosoniveum* + TX; *Talaromyces flavus*, штамм V117b + TX; *Trichoderma asperelloides* JM41R (номер доступа NRRL B-50759) (TRICHO PLUS® от BASF SE) + TX; *Trichoderma asperellum*, в частности, штамм kd (например, T-Gro от Andermatt Biocontrol) + TX; *Trichoderma asperellum*, в частности, штамм SKT-1 с номером доступа FERM P-16510 (например, ECO-HOPE® от Kumiai Chemical Industry), штамм T34 (например, T34 Biocontrol от Biocontrol Technologies S.L., Испания) или штамм ICC 012 от Isagro + TX; *Trichoderma atroviride*, в частности, штамм SC1 (с номером доступа CBS 122089, WO 2009/116106 и патент США № 8431120 (от Bi-PA)), штамм 77B (T77 от Andermatt Biocontrol) или штамм LU132 (например, Sentinel от Agrimm Technologies Limited) + TX; *Trichoderma atroviride*, штамм CNCM 1-1237 (например, Esquive® WP от Agrauxine, Франция) + TX; *Trichoderma atroviride*, штамм № V08/002387 + TX; *Trichoderma atroviride*, штамм по NMI № V08/002388 + TX; *Trichoderma atroviride*, штамм по NMI № V08/002389 + TX; *Trichoderma atroviride*, штамм по NMI № V08/002390 + TX; *Trichoderma atroviride*, штамм LC52 (например, Tenet от Agrimm Technologies Limited) + TX; *Trichoderma atroviride*, штамм ATCC 20476 (IMI 206040) + TX; *Trichoderma atroviride*, штамм T11 (IMI352941/CECT20498) + TX; *Trichoderma atroviride*, штамм SKT-1 (FERM P-16510), публикация патента JP (Kokai) № 11-253151 A, + TX; *Trichoderma atroviride*, штамм SKT-2 (FERM P-16511), публикация патента JP (Kokai) № 11-253151 A, + TX; *Trichoderma atroviride*, штамм SKT-3 (FERM P-17021), публикация патента JP (Kokai) № 11-253151 A, + TX; *Trichoderma fertile* (например, продукт TrichoPlus от BASF) + TX; *Trichoderma gamsii* (ранее *T. viride*), штамм ICC080 (IMI CC 392151 CABI, например, BioDerma от AGROBIOSOL DE MEXICO, S.A. DE C.V.) + TX; *Trichoderma gamsii* (ранее *T. viride*), штамм ICC 080 (IMI CC 392151 CABI) (доступный как BIODERMA® от AGROBIOSOL DE MEXICO, S.A. DE C.V.) + TX; *Trichoderma harmatum* + TX; *Trichoderma harmatum* с номером доступа ATCC 28012 + TX; *Trichoderma harzianum*, штамм T-22 (например, Triatum-P от Andermatt Biocontrol или Корперт) или штамм Сера SimbT5 (от Simbiose Agro) + TX; *Trichoderma harzianum* + TX; *Trichoderma*

harzianum rifai T39 (например, Trichodex® от Makhteshim, США) + TX; Trichoderma harzianum, штамм ITEM 908 (например, Trianum-P от Koppert) + TX; Trichoderma harzianum, штамм TH35 (например, Root-Pro от Mycontrol) + TX; Trichoderma harzianum, штамм DB 103 (доступный как T-GRO® 7456 от Dagutat Biolab) + TX;

5 Trichoderma polysporum, штамм IMI 206039 (например, Binab TF WP от BINAB Bio-Innovation AB, Швеция) + TX; Trichoderma stromaticum с номером доступа Ts3550 (например, Tricovab от CEPЛАС, Бразилия) + TX; Trichoderma virens (также известный как Gliocladium virens), в частности, штамм GL-21 (например, SoilGard от Certis, США) + TX; Trichoderma virens, ранее известный как Gliocladium virens, штамм G-41 (номер

10 доступа ATCC 20906) (например, ROOTSHIELD® PLUS WP и TURFSHIELD® PLUS WP от BioWorks, США) + TX; Trichoderma viride, штамм TV1 (например, Trianum-P от Koppert) + TX; Trichoderma viride, в частности, штамм B35 (Pietr et al., 1993, Zesz. Nauk. A R w Szczecinie 161: 125-137) + TX; смеси Trichoderma asperellum, штамм ICC 012 (также известного как Trichoderma harzianum ICC012) с номером доступа CABI CC IMI

15 392716, и Trichoderma gamsii (ранее T. viride), штамм ICC 080 с номером доступа IMI 392151 (например, BIO-TAM™ от Isagro USA, Inc. и BIODERMA® от Agrobiosol de Mexico, S.A. de C.V.) + TX; Ulocladium oudemansii, штамм U3 с номером доступа NM 99/06216 (например, BOTRY-ZEN® от Botry-Zen Ltd, Новая Зеландия, и BOTRYSTOP® от BioWorks, Inc.) + TX; Verticillium albo-atrum (ранее V. dahliae),

20 штамм WCS850 с номером доступа WCS850, депонированный в Центральном бюро грибных культур (например, DUTCH TRIG® от Tree Care Innovations) + TX; Verticillium chlamydosporium + TX;

(3) биологические средства контроля, оказывающие эффект в отношении улучшения роста растений и/или состояния здоровья растений, выбранные из группы, состоящей

25 из:

(3.1) бактерий, примерами которых являются *Azospirillum brasilense* (например, VIGOR® от KALO, Inc.) + TX; *Azospirillum lipoferum* (например, VERTEX-IF™ от TerraMax, Inc.) + TX; *Azorhizobium caulinodans*, в частности, штамм ZB-SK-5 + TX; *Azotobacter chroococcum*, в частности, штамм H23 + TX; *Azotobacter vinelandii*, в

30 частности, штамм ATCC 12837 + TX; смесь *Azotobacter vinelandii* и *Clostridium pasteurianum* (доступная как INVIGORATE® от Agrinos) + TX; *Bacillus amyloliquefaciens* pm414 (LOLI-PEPTA® от Biofilm Crop Protection) + TX; *Bacillus amyloliquefaciens* SB3281 (ATCC № PTA-7542, WO 2017/205258) + TX; *Bacillus*

amyloliquefaciens TJ1000 (доступный как QUIKROOTS® от Novozymes) + TX; *Bacillus amyloliquefaciens*, в частности, штамм IN937a + TX; *Bacillus amyloliquefaciens*, в частности, штамм FZB42 (например, RHIZOVITAL® от АВіТЕР, Германия) + TX; *Bacillus amyloliquefaciens* BS27 (номер доступа NRRL B-5015) + TX; представитель 5 EE128 семейства *Bacillus cereus* (№ в NRRL B-50917) + TX; представитель EE349 семейства *Bacillus cereus* (№ в NRRL B-50928) + TX; *Bacillus cereus*, в частности, штамм BP01 (ATCC 55675, например, МЕРІСНLOR® от Arysta Lifescience, США) + TX; *Bacillus firmus*, в частности, штамм CNMC 1-1582 (например, VOTIVO® от BASF SE) + TX; *Bacillus mycoides* BT155 (№ в NRRL B-50921) + TX; *Bacillus mycoides* EE118 10 (№ в NRRL B-50918) + TX; *Bacillus mycoides* EE141 (№ в NRRL B-50916) + TX; *Bacillus mycoides* BT46-3 (№ в NRRL B-50922) + TX; *Bacillus pumilus*, в частности, штамм QST2808 (с номером доступа № в NRRL B-30087) + TX; *Bacillus pumilus*, в частности, штамм GB34 (например, YIELD SHIELD® от Bayer Crop Science, Германия) + TX; *Bacillus siamensis*, в частности, штамм КСТС 13613Т + TX; *Bacillus subtilis*, в частности, 15 штамм QST713/AQ713 (с номером доступа в NRRL B-21661 и описанный в патенте США № 6060051, доступный как SERENADE® ОПТІ или SERENADE® ASO от Bayer CropScience LP, США) + TX; *Bacillus subtilis*, в частности, штамм AQ30002 (с номером доступа NRRL B-50421 и описанный в заявке на патент США № 13/330576) + TX; *Bacillus subtilis*, в частности, штамм AQ30004 (и NRRL B-50455, и описанный в заявке 20 на патент США № 13/330576) + TX; *Bacillus subtilis*, штамм BU1814 (доступный как TEQUALIS® от BASF SE), *Bacillus subtilis* rm303 (RHIZOMAX® от Biofilm Crop Protection) + TX; *Bacillus thuringiensis* BT013A (№ в NRRL B-50924), также известный как *Bacillus thuringiensis* 4Q7 + TX; смесь *Bacillus licheniformis* FMCH001 и *Bacillus subtilis* FMCH002 (доступна как QUARTZO® (WG), PRESENCE® (WP) от FMC 25 Corporation) + TX; *Bacillus subtilis*, в частности, штамм MBI 600 (например, SUBTILEX® от BASF SE) + TX; *Bacillus tequilensis*, в частности, штамм НИІ-0943 + TX; *Bradyrhizobium japonicum* (например, OPTIMIZE® от Novozymes) + TX; *Delftia acidovorans*, в частности, штамм RAY209 (например, БІОВООСТ® от Brett Young Seeds) + TX; *Mesorhizobium cicer* (например, NODULATOR от BASF SE) + TX; 30 *Lactobacillus* sp. (например, ЛАСТОПЛАНТ® от LactoPAFI) + TX; *Rhizobium leguminosarium biovar viciae* (например, NODULATOR от BASF SE) + TX; *Pseudomonas proradix* (например, PRORADIX® от Sourcon Padena) + TX; *Pseudomonas aeruginosa*, в частности, штамм PN1 + TX; *Rhizobium leguminosarum*, в частности, штамм Z25 bv.

viceae (номер доступа СЕСТ 4585) + TX; *Paenibacillus polymyxa*, в частности, штамм AC-1 (например TOPSEED® от Green Biotech Company Ltd.) + TX; *Serratia marcescens*, в частности, штамм SRM (номер доступа MTCC 8708) + TX; *Sinorhizobium meliloti*, штамм NRG-185-1 (NITRAGIN® GOLD от Bayer CropScience) + TX; *Thiobacillus* sp. (например, CROPAID® от Cropaid Ltd UK) + TX; и

5 (3.2) грибов, примерами которых являются *Purpureocillium lilacinum*, штамм 251 (ранее известный как *Paecilomyces lilacinus*) (AGAL 89/030550, например, BioAct от Bayer CropScience Biologics GmbH) + TX; *Penicillium bilaii*, штамм ATCC 22348 (например, JumpStart® от Acceleron BioAg), *Talaromyces flavus*, штамм V117b + TX; *Trichoderma atroviride*, штамм CNCM 1-1237 (например, Esquive® WP от Agrauxine, Франция), *Trichoderma viride*, например, штамм B35 (Pietr et al., 1993, Zesz. Nauk. A R w Szczecinie 161: 125-137) + TX; *Trichoderma atroviride*, штамм LC52 (также известный как штамм LU132 *Trichoderma atroviride*, например, Sentinel от Agrimm Technologies Limited) + TX; *Trichoderma atroviride*, штамм SC1, описанный в международной патентной заявке

10 PCT/IT2008/000196) + TX; *Trichoderma asperellum*, штамм kd (например, T-Gro от Andermatt Biocontrol) + TX; *Trichoderma asperellum*, штамм Eco-T (Plant Health Products, Южная Африка), *Trichoderma harzianum*, штамм T-22 (например, Triatum-P от Andermatt Biocontrol или Koppert) + TX; *Myrothecium verrucaria*, штамм AARC-0255 (например, DiTera™ от Valent Biosciences) + TX; *Penicillium bilaii*, штамм ATCC

20 ATCC20851 + TX; *Pythium oligandrum*, штамм M1 (ATCC 38472, например Polyversum от Biopreparaty, Чехия) + TX; *Trichoderma virens*, штамм GL-21 (например, SoilGard® от Certis, США) + TX; *Verticillium albo-atrum*, штамм WCS850 (ранее *V. dahliae*) (CBS 276.92, например, Dutch Trig от Tree Care Innovations) + TX; *Trichoderma atroviride*, в частности, штамм № V08/002387, № штамма в NMI № V08/002388, № штамма в NMI

25 № V08/002389, № штамма в NMI № V08/002390 + TX; *Trichoderma harzianum*, штамм ITEM 908, *Trichoderma harzianum*, штамм TSTh20 + TX; *Trichoderma harzianum*, штамм 1295-22 + TX; *Pythium oligandrum*, штамм DV74 + TX; *Rhizopogon amylopogon* (например, содержащийся в Мусо-Sol от Helena Chemical Company) + TX; *Rhizopogon fulvigleba* (например, содержащийся в Мусо-Sol от Helena Chemical Company) + TX;

30 *Trichoderma virens*, штамм GI-3 + TX;

(4) инсектицидно активные биологические средства контроля, выбранные из

(4.1) бактерий, примерами которых являются *Agrobacterium radiobacter*, штамм K84(Galltrol от AgBiochem Inc.) + TX; *Bacillus amyloliquefaciens*, в частности, штамм

PTS-4838 (например, AVEO от Valent Biosciences, США) + TX; *Bacillus firmus*, в частности, штамм CNMC 1-1582 (например, VOTIVO® от BASF SE) + TX; изолят J. *Bacillus mycoides* (например, BmJ от Certis USA LLC, дочерней компании Mitsui & Co.) + TX; *Bacillus sphaericus*, в частности, штамм 2362 серотипа H5a5b (штамм ABTS-1743) (например, VECTOLEX® от Valent BioSciences, США) + TX; *Bacillus thuringiensis* subsp. *aizawai*, в частности, штамм ABTS-1857 (SD-1372, например XENTARI® от Valent BioSciences) + TX; *Bacillus thuringiensis* subsp. *aizawai*, в частности, серотип H-7 (например, FLORBAC® WG от Valent BioSciences, США) + TX; *Bacillus thuringiensis israelensis*, штамм BMP 144 (например, AQUABAC® от Becker Microbial Products, Иллинойс) + TX; *Bacillus thuringiensis* subsp. *israelensis*, штамм AM65-52 (серотип H-14) (номер доступа ATCC 1276) (например, VECTOBAC® от Valent BioSciences, США) + TX; *Bacillus thuringiensis* subsp. *aizawai*, штамм GC-91 + TX; *Bacillus thuringiensis* var. *Colmeri* (например, TIANBAOBTС от Changzhou Jianghai Chemical Factory) + TX; *Bacillus thuringiensis* var. *japonensis*, штамм Buibui + TX; *Bacillus thuringiensis* subsp. *kurstaki*, штамм BMP 123 от Becker Microbial Products, Иллинойс + TX; *Bacillus thuringiensis* subsp. *kurstaki*, штамм BMP 123 от Becker Microbial Products, Иллинойс, например, BARITONE от Bayer CropScience + TX; *Bacillus thuringiensis* subsp. *kurstaki*, штамм HD-1 (например, DIPEL® ES от Valent BioSciences, США) + TX; *Bacillus thuringiensis* var. *kurstaki*, штамм EVB-113-19 (например, BIOPROTEC® от AEF Global) + TX; *Bacillus thuringiensis* subsp. *kurstaki*, штамм ABTS 351 + TX; *Bacillus thuringiensis* subsp. *kurstaki*, штамм PB 54 + TX; *Bacillus thuringiensis* subsp. *kurstaki*, штамм SA 11 (JAVELIN от Certis, США) + TX; *Bacillus thuringiensis* subsp. *kurstaki*, штамм SA 12 (THURICIDE от Certis, США) + TX; *Bacillus thuringiensis* subsp. *kurstaki*, штамм EG 2348 (LEPINOX от Certis, США) + TX; *Bacillus thuringiensis* subsp. *kurstaki*, штамм EG 7841 (CRYMAX от Certis, США) + TX; *Bacillus thuringiensis* subsp. *tenebrionis*, штамм NB 176 (SD-5428, например, NOVODOR® FC от BioFa, Германия) + TX; *Brevibacillus laterosporus* (LATERAL от Ecolibrium Biologicals) + TX; *Burkholderia* spp., в частности, штамм A396 *Burkholderia ginsengensis* (также известный как *Burkholderia ginsengensis*, штамм MBI 305) (номер доступа NRRL B-50319 + TX; WO 2011/106491 и WO 2013/032693 + TX; например, MBI206 TGAI и ZELTO® от Marrone Bio Innovations) + TX; *Chromobacterium subtsugae*, в частности, штамм PRAA4-1T (MBI-203 + TX; например, GRANDEVO® от Marrone Bio Innovations) + TX; *Lecanicillium muscarium* Ve6 (MYCOTAL от Koppert) + TX; *Paenibacillus popilliae* (ранее *Bacillus popilliae* + TX;

например, MILKY SPORE POWDER™ и MILKY SPORE GRANULAR™ от St. Gabriel Laboratories) + TX; *Pasteuria nishizawae*, штамм Pn1 (CLARIVA от Syngenta/ChemChina) + TX; *Serratia entomophila* (например, INVADE® от Wrightson Seeds) + TX; *Serratia marcescens*, в частности, штамм SRM (номер доступа MTCC 8708) + TX; *Trichoderma asperellum* (TRICHODERMAX от Novozymes) + TX; штамм ZAP *Wolbachia pipientis* (например, ZAP MALES® от MosquitoMate) + TX; и

(4.2) грибов, примерами которых являются *Beauveria bassiana*, штамм ATCC 74040 (например, NATURALIS® от Intrachem Bio Italia) + TX; *Beauveria bassiana*, штамм GHA (номер доступа ATCC74250, например, BOTANIGUARD® ES и MYCONTROL-O® от Laverlam International Corporation) + TX; *Beauveria bassiana*, штамм ATP02 (номер доступа DSM 24665) + TX; *Isaria fumosorosea* (ранее известного как *Paecilomyces fumosoroseus*), штамм Аорка 97, PREFERAL от SePRO + TX; *Metarhizium anisopliae* 3213-1 (депонированный под номером доступа в NRRL 67074) (WO 2017/066094 + TX; Pioneer Hi-Bred International) + TX; *Metarhizium robertsii* 15013-1 (депонированный под номером доступа в NRRL 67073) + TX; *Metarhizium robertsii* 23013-3 (депонированный под номером доступа в NRRL 67075) + TX; *Paecilomyces lilacinus*, штамм 251 (MELOCON от Certis, США) + TX; *Zoophtora radicans* + TX;

(5) **вирусы**, выбранные из группы, состоящей из вируса гранулеза (GV) *Adoxophyes orana* (листокрутка сетчатая) + TX; вируса гранулеза (GV) *Cydia pomonella* (плодожорки яблочной) + TX; вируса ядерного полиэдроза (NPV) *Helicoverpa armigera* (совки хлопчатниковой) + TX; mNPV *Spodoptera exigua* (совки малой) + TX; mNPV *Spodoptera frugiperda* (совки кукурузной листовой) + TX; NPV *Spodoptera littoralis* (совки египетской хлопчатниковой) + TX;

(6) бактерии и грибы, которые могут быть добавлены в качестве 'инокулянта' в отношении растений, или частей растений, или органов растений и которые за счет своих особенных свойств стимулируют рост растений и улучшают состояние здоровья растений, выбранные из *Agrobacterium spp.* + TX; *Azorhizobium caulinodans* + TX; *Azospirillum spp.* + TX; *Azotobacter spp.* + TX; *Bradyrhizobium spp.* + TX; *Burkholderia spp.*, в частности, *Burkholderia cepacia* (ранее известный как *Pseudomonas cepacia*) + TX; *Gigaspora spp.* или *Gigaspora monosporum* + TX; *Glomus spp.* + TX; *Laccaria spp.* + TX; *LactoBacillus buchneri* + TX; *Paraglomus spp.* + TX; *Pisolithus tinctorius* + TX; *Pseudomonas spp.* + TX; *Rhizobium spp.*, в частности *Rhizobium trifolii* + TX; *Rhizopogon spp.* + TX; *Scleroderma spp.* + TX; *Suillus spp.* + TX; *Streptomyces spp.* + TX;

(7) экстракты растений и продукты, образованные микроорганизмами, включая белки и вторичные метаболиты, которые могут использоваться в качестве биологических средств контроля, выбранные из *Allium sativum* (NEMGUARD от Eco-Spray + TX; BRALIC от ADAMA) + TX; Armour-Zen + TX; *Artemisia absinthium* + TX; азадирахтина (например, AZATIN XL от Certis, США) + TX; Biokeeper WP + TX; экстракта растений семейства Brassicaceae, в частности, порошка масличного рапса или порошка горчицы + TX; *Cassia nigricans* + TX; *Celastrus angulatus* + TX; *Chenopodium anthelminticum* + TX; хитина + TX; *Dryopteris filix-mas* + TX; *Equisetum arvense* + TX; Fortune Aza + TX; Fungastop + TX; Heads Up (экстракта сапонинов *Chenopodium quinoa*) + TX; PROBLAD (встречающегося в природе полипептида Blad из семян люпина), Certis EU + TX; FRACTURE (встречающегося в природе полипептида Blad из семян люпина), FMC + TX; пиретрума/пиретринов + TX; *Quassia amara* + TX; *Quercus* + TX; экстракта коры килайи (QL AGRI 35 от BASF) + TX; экстракта *Reynoutria sachalinensis* (REGALLIA/REGALIA MAXX от Marrone Bio) + TX; "Requiem™ Insecticide" + TX; ротенона + TX; рианиии/рианодина + TX; *Symphytum officinale* + TX; *Tanacetum vulgare* + TX; тимола + TX; тимола в смеси с гераниолом (CEDROZ от Eden Research) + TX; тимола в смеси с гераниолом и эвгенолом (MEVALONE от Eden Research) + TX; Triact 70 + TX; TriCon + TX; *Tropaeolum majus* + TX; экстракта *Melaleuca alternifolia* (TIMOREX GOLD от STK) + TX; *Urtica dioica* + TX; вератрина + TX и *Viscum album* + TX; и

антидот, такой как беноксакор + TX, клоквиносет (в том числе клоквиносет-мексил) + TX, ципросульфамид + TX, дихлормид + TX, фенхлоразол (в том числе фенхлоразол-этил) + TX, фенклорим + TX, флуксофеним + TX, фурилазол + TX, изоксадифен (в том числе изоксадифен-этил) + TX, мефенпир (в том числе мефенпир-диэтил) + TX, меткамифен + TX и оксабетринил + TX.

Ссылки в квадратных скобках после активных ингредиентов, например [3878-19-1], относятся к номеру согласно реестру Химической реферативной службы. Вышеописанные ингредиенты для смешивания являются известными. Если активные ингредиенты включены в "The Pesticide Manual" [The Pesticide Manual - A World Compendium; Thirteenth Edition; Editor: C. D. S. TomLin; British Crop Protection Council], то они описаны в нем под номером записи, приведенном в данном документе выше в круглых скобках для конкретного соединения; например, соединение "аба멕тин"

описано под регистрационным номером (1). Если в данном документе выше к конкретному соединению добавлено "[CCN]", то рассматриваемое соединение включено в "Compendium of Pesticide Common Names", который доступен в Интернете [A. Wood; Compendium of Pesticide Common Names, Copyright © 1995-2004]; например, соединение "ацетопрол" описано по адресу в Интернете <http://www.alanwood.net/pesticides/acetoprole.html>.

Большинство вышеописанных активных ингредиентов приведены в данном документе выше под так называемым "общепринятым названием", соответствующем "общепринятому названию согласно ISO" или другому "общепринятому названию", которое используют в отдельных случаях. Если обозначение не является "общепринятым названием", для конкретного соединения в круглых скобках представлена природа обозначения, применяемого вместо него; в этом случае применяют название согласно IUPAC, название согласно IUPAC/Химической реферативной службе, "химическое название", "традиционное название", "название соединения" или "код разработки" или, если не применяют ни одно из этих обозначений, ни "общепринятое название", то используют "альтернативное название". "Регистрационный № по CAS" означает регистрационный номер согласно Химической реферативной службе.

Смесь активных ингредиентов соединений формулы I, выбранных из таблиц А-1 - А-20, таблиц В-1 - В-20, таблицы Y, таблицы Z и таблицы Р(Е), с активными ингредиентами, описанными выше, содержит соединение, выбранное из таблиц А-1 - А-20, таблиц В-1 - В-20, таблицы Y, таблицы Z и таблицы Р(Е), и активный ингредиент, описанный выше, предпочтительно при соотношении компонентов смеси, составляющем от 100:1 до 1:6000, в частности, от 50:1 до 1:50, более предпочтительно при соотношении, составляющем от 20:1 до 1:20, еще более предпочтительно от 10:1 до 1:10, крайне предпочтительно от 5:1 до 1:5, при этом особое предпочтение отдают соотношению от 2:1 до 1:2, и при этом соотношение от 4:1 до 2:1 является также предпочтительным, прежде всего при соотношении 1:1 или 5:1, или 5:2, или 5:3, или 5:4, или 4:1, или 4:2, или 4:3, или 3:1, или 3:2, или 2:1, или 1:5, или 2:5, или 3:5, или 4:5, или 1:4, или 2:4, или 3:4, или 1:3, или 2:3, или 1:2, или 1:600, или 1:300, или 1:150, или 1:35, или 2:35, или 4:35, или 1:75, или 2:75, или 4:75, или 1:6000, или 1:3000, или

1:1500, или 1:350, или 2:350, или 4:350, или 1:750, или 2:750, или 4:750. Эти соотношения компонентов смеси указаны по весу.

5 Вышеописанные смеси можно применять в способе контроля вредителей, который включает применение композиции, содержащей вышеописанную смесь, по отношению к вредителям или их среде обитания, за исключением способа лечения организма человека или животного путем хирургического вмешательства или терапии и способов диагностики, применяемых на практике в отношении организма человека или животного.

10 Смеси, содержащие соединение формулы I, выбранное из таблиц А-1 - А-20, таблиц В-1 - В-20, таблицы Y, таблицы Z и таблицы P(E), и один или несколько активных ингредиентов, описанных выше, можно применять, например, в форме отдельной "готовой смеси", в объединенной смеси для опрыскивания, состоящей из отдельных
15 составов отдельных компонентов, представляющих собой активные ингредиенты, такой как "баковая смесь", и при объединенном применении отдельных активных ингредиентов, в случае их применения последовательным образом, т. е. один за другим с обоснованно коротким периодом, таким как несколько часов или дней. Порядок применения соединений формулы I, выбранных из таблиц А-1 - А-20, таблиц В-1 - В-
20 20, таблицы Y, таблицы Z и таблицы P(E), и активных ингредиентов, описанных выше, не является существенным для осуществления настоящего изобретения.

Композиции согласно настоящему изобретению также могут содержать дополнительные твердые или жидкие вспомогательные средства, такие как
25 стабилизаторы, например неэпоксирированные или эпоксирированные растительные масла (например, эпоксирированное кокосовое масло, рапсовое масло или соевое масло), противовспениватели, например силиконовое масло, консерванты, регуляторы вязкости, связующие и/или придающие липкость вещества, удобрения или другие активные ингредиенты для обеспечения специфических эффектов, например,
30 бактерициды, фунгициды, нематоциды, активаторы роста растения, моллюскоциды или гербициды.

- Композиции согласно настоящему изобретению получают способом, известным per se, в отсутствие вспомогательных средств, например, посредством измельчения, просеивания и/или прессования твердого активного ингредиента, а в присутствии по меньшей мере одного вспомогательного средства, например, посредством тщательного
- 5 перемешивания и/или измельчения активного ингредиента со вспомогательным(вспомогательными) средством(средствами). Такие способы получения композиций и применение соединений I для получения таких композиций также являются объектом настоящего изобретения.
- 10 Способы применения композиций, то есть способы контроля вредителей вышеупомянутого типа, такие как распыление, разбрызгивание, опудривание, нанесение кистью, дражирование, разбрасывание или полив, которые будут выбирать для удовлетворения намеченных целей с учетом данных обстоятельств, и применение композиций для контроля вредителей вышеупомянутого типа являются другими
- 15 объектами настоящего изобретения. Типичные нормы концентрации активного ингредиента составляют от 0,1 до 1000 ppm, предпочтительно от 0,1 до 500 ppm. Норма применения на гектар, как правило, составляет от 1 до 2000 г активного ингредиента на гектар, в частности от 10 до 1000 г/га, предпочтительно от 10 до 600 г/га.
- 20 Предпочтительным способом нанесения в области защиты культур является нанесение на листву растений (внекорневое внесение), при этом можно выбрать частоту и норму применения в соответствии с опасностью заражения рассматриваемым вредителем. В качестве альтернативы, активный ингредиент может достигать растений через
- 25 корневую систему (системное действие) за счет орошения места произрастания растений жидкой композицией или за счет внедрения активного ингредиента в твердой форме в место произрастания растений, например в почву, например, в форме гранул (внесение в почву). В случае сельскохозяйственной культуры риса-падди такие гранулы можно дозировать в определенном количестве в затопляемое рисовое поле.
- 30 Соединения по настоящему изобретению и композиции на их основе также являются подходящими для защиты материала для размножения растений, например семян, как например плоды, клубни или зерна, или саженцев от вредителей упомянутого выше типа. Материал для размножения можно обрабатывать с помощью соединения перед

посадкой, например семя можно обрабатывать перед посевом. В качестве альтернативы соединение можно применять по отношению к косточкам семени (нанесение покрытия) либо с помощью замачивания косточек в жидкой композиции, либо с помощью нанесения слоя твердой композиции. Композиции также можно применять при посадке материала для размножения в место внесения, например, при внесении в борозду для 5 семян во время рядового сева. Данные способы обработки материала для размножения растений и обработанный таким образом материал для размножения растений являются дополнительными объектами настоящего изобретения. Типичные нормы обработки будут зависеть от растения и вредителя/грибов, подлежащих контролю, и обычно они 10 составляют от 1 до 200 грамм на 100 кг семян, предпочтительно от 5 до 150 грамм на 100 кг семян, как например от 10 до 100 грамм на 100 кг семян.

Термин "семя" охватывает семена и вегетативные части растения всех видов, в том числе без ограничения истинные семена, кусочки семян, корневые побеги, зерно 15 злаковых, луковицы, плод, клубни, зерна, ризомы, черенки, нарезанные побеги и т. п., и согласно предпочтительному варианту осуществления означает истинные семена.

Настоящее изобретение также предусматривает семена, покрытые или обработанные с помощью соединения формулы I или содержащие таковое. Термин "покрытый или 20 обработанный и/или содержащий" обычно означает, что активный ингредиент находится на большей части поверхности семени во время применения, хотя большая или меньшая часть ингредиента может проникать в семенной материал в зависимости от способа применения. Если указанный семенной продукт (повторно) высаживают, он может поглощать активный ингредиент. В одном варианте осуществления в данном 25 изобретении представлен материал для размножения растений с нанесенным на него соединением формулы I, в том числе выбранным из таблиц A-1 - A-20, таблиц B-1 - B-20, таблицы Y, таблицы Z и таблицы P(E). Кроме того, в данном документе представлена композиция, содержащая материал для размножения растений, обработанный соединением формулы I, в том числе выбранным из таблиц A-1 - A-20, 30 таблиц B-1 - B-20, таблицы Y, таблицы Z и таблицы P(E).

Обработка семян включает все подходящие методики обработки семян, известные из уровня техники, такие как дражирование семян, покрытие семян, опудривание семян,

пропитывание семян и гранулирование семян. Применение соединения формулы I (в том числе выбранного из таблиц А-1 - А-20, таблиц В-1 - В-20, таблицы Y, таблицы Z и таблицы Р(Е)) при обработке семян может быть осуществлено с помощью любых известных способов, таких как опрыскивание или опудривание семян, перед посевом или во время посева/посадки семян.

Биологические примеры

Следующие примеры служат для иллюстрации настоящего изобретения. Определенные соединения по настоящему изобретению могут отличаться от известных соединений более высокой эффективностью при низких нормах применения, что способен проверить специалист в данной области техники с использованием экспериментальных процедур, изложенных в примерах, с использованием при необходимости более низких норм применения, например, 50 ppm, 12,5 ppm, 6 ppm, 3 ppm, 1,5 ppm, 0,8 ppm или 0,2 ppm.

Пример В1. Активность в отношении *Spodoptera littoralis* (египетская хлопчатниковая совка)

Листовые диски хлопчатника помещали на агар в 24-луночные микротитровальные планшеты и опрыскивали водными растворами тестируемых соединений, полученными из 10000 ppm исходных растворов в DMSO. После высушивания листовые диски заражали пятью личинками L1. Образцы оценивали в отношении смертности, противодействия питанию и ингибирования роста по сравнению с необработанными образцами через 3 дня после заражения. Контроль *Spodoptera littoralis* исследуемыми образцами присутствовал, если по меньшей мере одна из категорий смертности, антифидантного эффекта и ингибирования роста являлась выше, чем для необработанного образца.

Следующие соединения обеспечивали по меньшей мере 80% контроль при норме применения 200 ppm: P1, P3, P5, P6, P8, P9, P11, P12, P13, P14, P17, P19, P1-A, P3-A, P5-A, P7-A, P8-A, P9-A, P14-A, P15-A, P19-A, P1-B, P3-B, P5-B, P6-B, P7-B, P9-B, P13-B, P14-B, P16-B, P17-B, P19-B.

Пример В2. Активность в отношении *Plutella xylostella* (моль капустная)

С помощью пипетки 24-луночные микротитровальные планшеты с искусственной питательной средой обрабатывали водными растворами тестируемых соединений, полученными из 10000 ppm исходных растворов в DMSO. После высушивания планшеты заражали личинками L2 (10-15 на лунку). Образцы оценивали в отношении смертности и ингибирования роста по сравнению с необработанными образцами через 5 дней после заражения.

Следующие соединения обеспечивали эффект, составляющий по меньшей мере 80%, в по меньшей мере одной из двух категорий (смертность или ингибирование роста) при норме применения 200 ppm: P1, P3, P5, P6, P8, P9, P11, P12, P13, P14, P15, P16, P17, P19.

Пример В3. Активность в отношении *Diabrotica balteata* (блошка длинноусая)

Проростки маиса, помещенные на слой агара в 24-луночные микротитрационные планшеты, обрабатывали водными растворами тестируемых соединений, полученными из 10000 ppm исходных растворов в DMSO, путем распыления. После высушивания планшеты заражали личинками L2 (6-10 на лунку). Образцы оценивали в отношении смертности и ингибирования роста по сравнению с необработанными образцами через 4 дня после заражения.

Следующие соединения обеспечивали эффект, составляющий по меньшей мере 80%, в по меньшей мере одной из двух категорий (смертность или ингибирование роста) при норме применения 200 ppm: P1, P2, P3, P5, P7, P8, P9, P11, P12, P13, P14, P15, P18, P19, P1-A, P3-A, P5-A, P6-A, P7-A, P8-A, P9-A, P10-A, P11-A, P12-A, P13-A, P14-A, P15-A, P16-A, P17-A, P18-A, P19-A, P1-B, P3-B, P4-B, P5-B, P6-B, P7-B, P8-B, P9-B, P11-B, P12-B, P13-B, P14-B, P15-B, P17-B, P18-B, P19-B.

Пример В4. Активность в отношении *Myzus persicae* (тля персиковая зеленая).

Воздействие при поедании/контактное действие

Листовые диски подсолнечника помещали на агар в 24-луночный микротитровальный планшет и опрыскивали водными растворами тестируемых соединений, полученными из 10000 ppm исходных растворов в DMSO. После высушивания листовые диски заражали популяцией тли разных возрастов. Образцы оценивали в отношении смертности через 6 дней после заражения.

Следующие соединения обеспечивали по меньшей мере 80% смертность при норме применения 200 ppm: P1, P2, P3, P4, P5, P6, P7, P8, P9, P10, P11, P12, P13, P14, P15, P16, P17, P18, P19, P1-A, P2-A, P3-A, P4-A, P5-A, P6-A, P7-A, P8-A, P9-A, P10-A, P11-A, P12-A, P13-A, P14-A, P15-A, P16-A, P17-A, P18-A, P19-A, P1-B, P2-B, P3-B, P4-B, P5-B, P6-B, P7-B, P8-B, P9-B, P10-B, P11-B, P12-B, P13-B, P14-B, P15-B, P16-B, P17-B, P18-B, P19-B.

Пример В5. Активность в отношении *Myzus persicae* (тля персиковая зеленая).

Системное действие

10 Корни проростков гороха, зараженных популяцией тли разных возрастов, помещали непосредственно в водные растворы тестируемых соединений, полученные из 10000 ppm исходных растворов в DMSO. Через 6 дней после помещения проростков в растворы тестируемых соединений образцы оценивали в отношении смертности.

Следующие соединения обеспечивали по меньшей мере 80% смертность при исследуемой норме 24 ppm: P1, P2, P4, P5, P6, P8, P9, P10, P11, P12, P13, P14, P15, P16, P17, P18, P19, P1-A, P2-A, P4-A, P5-A, P6-A, P7-A, P8-A, P9-A, P10-A, P11-A, P12-A, P13-A, P14-A, P15-A, P16-A, P17-A, P18-A, P19-A, P1-B, P2-B, P3-B, P4-B, P5-B, P6-B, P7-B, P8-B, P9-B, P10-B, P11-B, P12-B, P13-B, P14-B, P15-B, P16-B, P17-B, P18-B, P19-B.

20

Пример В6. Активность в отношении *Bemisia tabaci* (табачная белокрылка)

Листовые диски хлопчатника помещали на агар в 24-луночные микротитровальные планшеты и опрыскивали водными растворами тестируемых соединений, полученными из 10000 ppm исходных растворов в DMSO. После высушивания листовые диски заражали взрослыми особями белокрылки. Через 6 дней после инкубирования образцы проверяли в отношении смертности.

Следующие соединения обеспечивали по меньшей мере 80% смертность при норме применения 200 ppm: P1, P2, P4, P5, P6, P7, P8, P9, P10, P11, P12, P13, P14, P15, P16, P17, P18, P19, P1-A, P2-A, P4-A, P5-A, P6-A, P7-A, P8-A, P9-A, P10-A, P12-A, P13-A, P14-A, P15-A, P16-A, P17-A, P18-A, P19-A, P1-B, P2-B, P4-B, P5-B, P6-B, P7-B, P8-B, P9-B, P10-B, P11-B, P12-B, P13-B, P14-B, P15-B, P16-B, P17-B, P18-B, P19-B.

30

Пример В7. Активность в отношении *Euschistus heros* (неотропический коричневый клоп-щитник)

Листья сои на агаре в 24-луночных микротитровальных планшетах опрыскивали водными растворами тестируемых соединений, полученными из 10000 ppm исходных растворов в DMSO. После высушивания листья заражали нимфами N-2. Образцы оценивали в отношении смертности и ингибирования роста по сравнению с необработанными образцами через 5 дней после заражения.

Следующие соединения обеспечивали эффект, составляющий по меньшей мере 80%, в по меньшей мере одной из двух категорий (смертность или ингибирование роста) при норме применения 200 ppm: P1, P2, P5, P6, P7, P8, P9, P13, P14, P15, P18, P19, P1-A, P7-A, P8-A, P14-A, P19-A, P1-B, P5-B, P7-B, P17-B, P18-B, P19-B.

Пример В8. Активность в отношении *Frankliniella occidentalis* (западный цветочный трипс)

Листовые диски подсолнечника помещали на агар в 24-луночные микротитровальные планшеты и опрыскивали водными растворами тестируемых соединений, полученными из 10000 ppm исходных растворов в DMSO. После высушивания листовые диски заражали популяцией *Frankliniella* разных возрастов. Через 7 дней после заражения образцы оценивали в отношении смертности.

Следующие соединения обеспечивали по меньшей мере 80% смертность при норме применения 200 ppm: P1, P7, P11-A, P1-B, P7-B, P19-B.

Пример В9. Активность в отношении *Plutella xylostella* (моль капустная)

С помощью пипетки 24-луночные микротитровальные планшеты с искусственной питательной средой обрабатывали водными растворами тестируемых соединений, полученными из 10000 ppm исходных растворов в DMSO. После высушивания яйца *Plutella* помещали с помощью пипетки через пластиковый трафарет на бумагу для блоттинга в геле и накрывали ей планшет. Образцы оценивали в отношении смертности и ингибирования роста по сравнению с необработанными образцами через 8 дней после заражения.

Следующие соединения обеспечивали эффект, составляющий по меньшей мере 80%, в по меньшей мере одной из двух категорий (смертность или ингибирование роста) при норме применения 200 ppm: P7, P10, P1-A, P3-A, P4-A, P5-A, P6-A, P7-A, P8-A, P9-A,

P10-A, P11-A, P12-A, P13-A, P14-A, P15-A, P16-A, P17-A, P18-A, P19-A, P1-B, P3-B, P4-B, P5-B, P6-B, P7-B, P8-B, P9-B, P10-B, P11-B, P12-B, P13-B, P14-B, P15-B, P16-B, P17-B, P19-B.

5 Пример В10. Активность в отношении *Tetranychus urticae* (клещ двупятнистый паутинный)

10 Листовые диски бобов на агаре в 24-луночных микротитровальных планшетах опрыскивали водными растворами тестируемых соединений, полученными из 10000 ppm исходных растворов в DMSO. После высушивания листовые диски заражали популяцией клещей разных возрастов. Образцы оценивали в отношении смертности смешанной популяции (подвижные стадии) через 8 дней после заражения.

Следующие соединения обеспечивали по меньшей мере 80% смертность при норме применения 200 ppm: P7, P13, P19-A.

15 Пример В11. Активность в отношении *Chilo suppressalis* (огневка желтая рисовая)

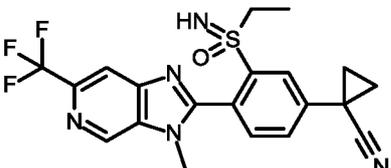
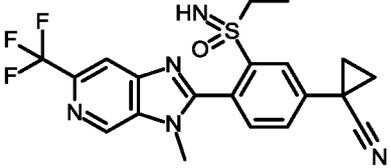
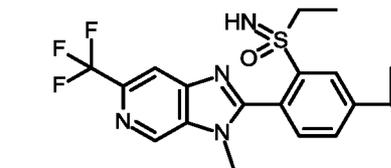
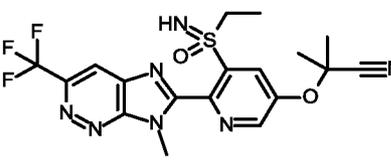
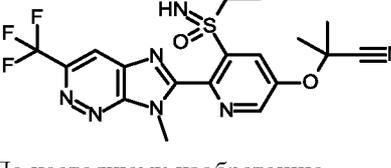
20 С помощью пипетки 24-луночные микротитровальные планшеты с искусственной питательной средой обрабатывали водными растворами тестируемых соединений, полученными из 10000 ppm исходных растворов в DMSO. После высушивания планшеты заражали личинками L2 (6-8 на лунку). Образцы оценивали в отношении смертности, противодействия питанию и ингибирования роста по сравнению с необработанными образцами через 6 дней после заражения. Контроль *Chilo suppressalis* образцом тестируемого соединения присутствовал, если по меньшей мере одна из категорий, представляющих собой смертность, противодействие питанию и ингибирование роста, была выше, чем у необработанного образца.

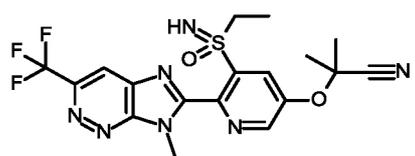
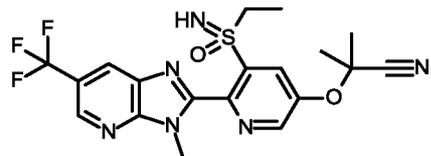
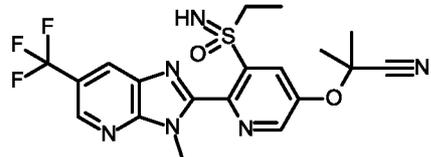
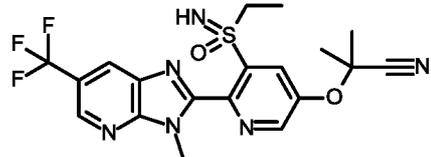
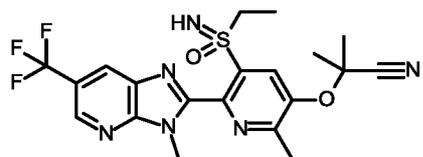
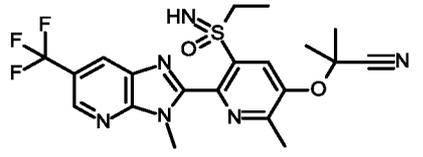
25 Например, следующие соединения обеспечивали по меньшей мере 80% контроль при норме применения 200 ppm: P10, P2-A, P6-A, P8-A, P12-A, P13-A, P14-A, P16-A, P6-B, P8-B, P10-B, P12-B, P13-B, P14-B, P16-B.

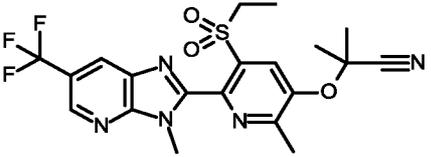
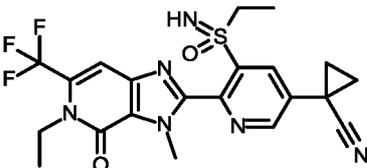
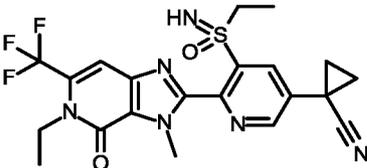
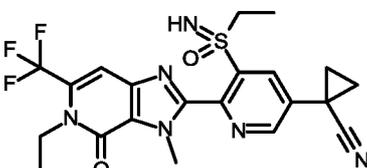
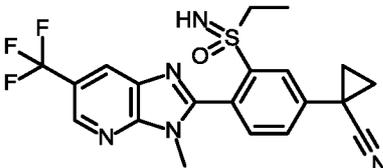
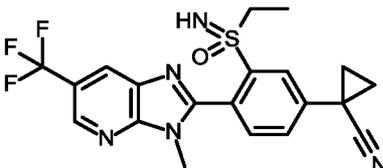
30 Пример В12. Сравнение инсектицидной активности соединений P18-A/P18-B, P15-A/P15-B, P9-A/P9-B, P5-A/P5-B, P14-A/P14-B, P6-A/P6-B и P13-A/P13-B, представляющих собой отдельные энантиомеры, по настоящему изобретению со структурно сопоставимыми рацемическими сульфоксиминовыми соединениями из уровня техники

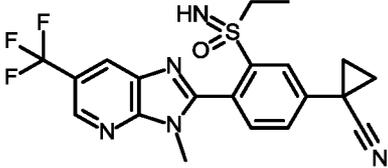
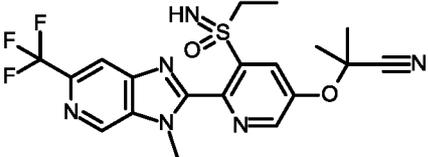
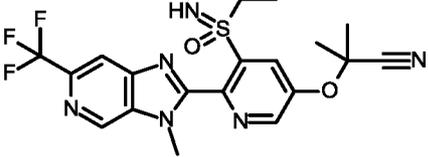
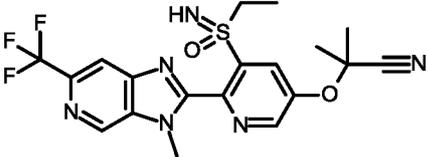
Активность соединений P18-A, P18-B, P15-A, P15-B, P9-A, P9-B, P5-A, P5-B, P14-A, P14-B, P6-A, P6-B, P13-A и P13-B согласно примерам получения и соединения P13 из WO 19/234158, соединения P2 из WO 20/084075, соединения P3 из WO 20/084075, соединения P4 из WO 20/084075, соединения P14 из WO 19/234158, соединения P15 из WO 19/234158, соответственно соединения P1 из WO 20/084075 в отношении *Diabrotica balteata* (пример В3) сведена в таблице В12.

Таблица В12.

Соединение	Концентрация (ppm)	Насекомое	Смертность (%)
Соединение P18-A 	50	<i>Diabrotica balteata</i>	100
По настоящему изобретению			
Соединение P18-B 	50	<i>Diabrotica balteata</i>	100
По настоящему изобретению			
Описано в WO 19/234158 как соединение P13 	50	<i>Diabrotica balteata</i>	0
рац- Из уровня техники			
Соединение P15-A 	12,5	<i>Diabrotica balteata</i>	80
По настоящему изобретению			
Соединение P15-B 	12,5	<i>Diabrotica balteata</i>	100
По настоящему изобретению			

<p>Описано в WO 20/084075 как соединение P2</p>  <p>рац- Из уровня техники</p>	12,5	<i>Diabrotica balteata</i>	0
<p>Соединение P9-A</p>  <p>По настоящему изобретению</p>	50	<i>Diabrotica balteata</i>	80
<p>Соединение P9-B</p>  <p>По настоящему изобретению</p>	50	<i>Diabrotica balteata</i>	100
<p>Описано в WO 20/084075 как соединение P3</p>  <p>рац- Из уровня техники</p>	50	<i>Diabrotica balteata</i>	80
<p>Соединение P5-A</p>  <p>По настоящему изобретению</p>	3,125	<i>Diabrotica balteata</i>	80
<p>Соединение P5-B</p>  <p>По настоящему изобретению</p>	3,125	<i>Diabrotica balteata</i>	100

<p>Описано в WO 20/084075 как соединение P4 рац-</p>  <p>Из уровня техники</p>	3,125	<i>Diabrotica balteata</i>	0
<p>Соединение P14-A</p>  <p>По настоящему изобретению</p>	50	<i>Diabrotica balteata</i>	80
<p>Соединение P14-B</p>  <p>По настоящему изобретению</p>	50	<i>Diabrotica balteata</i>	50
<p>Описано в WO 19/234158 как соединение P14 рац- Из уровня техники</p> 	50	<i>Diabrotica balteata</i>	0
<p>Соединение P6-A</p>  <p>По настоящему изобретению</p>	50	<i>Diabrotica balteata</i>	80
<p>Соединение P6-B</p>  <p>По настоящему изобретению</p>	50	<i>Diabrotica balteata</i>	80

<p>Описано в WO 19/234158 как соединение P15</p>  <p>рац- Из уровня техники</p>	50	<i>Diabrotica balteata</i>	0
<p>Соединение P13-A</p>  <p>По настоящему изобретению</p>	50	<i>Diabrotica balteata</i>	80
<p>Соединение P13-B</p>  <p>По настоящему изобретению</p>	50	<i>Diabrotica balteata</i>	100
<p>Описано в WO 20/084075 как соединение P1</p>  <p>рац- Из уровня техники</p>	50	<i>Diabrotica balteata</i>	0

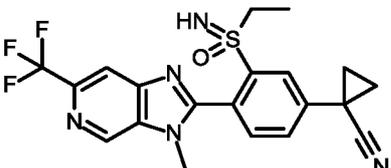
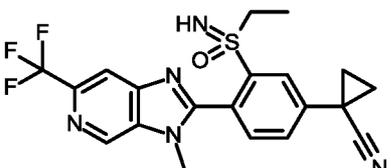
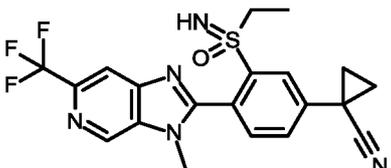
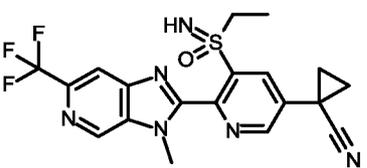
В таблице В12 показано, что соединения P18-A, P18-B, P15-A, P15-B, P9-A, P9-B, P5-A, P5-B, P14-A, P14-B, P6-A, P6-B, P13-A и P13-B, представляющие собой отдельные энантимеры (либо элюируются первыми/вторыми при хиральном разделении [таблица Z], либо энантимерно чистые/энантимерно обогащенные в результате стереоселективного синтеза [таблица Y]), по настоящему изобретению преимущественно проявляют по сути лучшее инсектицидное действие в отношении *Diabrotica balteata*, чем соединение из уровня техники.

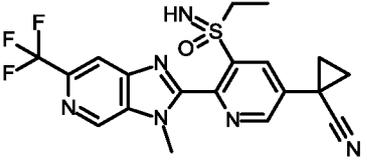
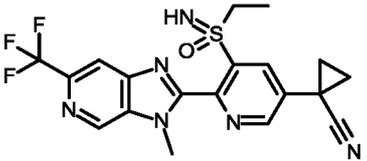
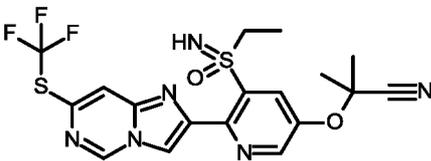
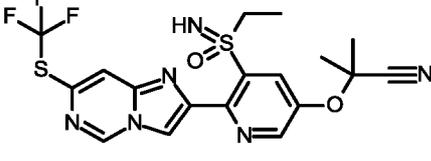
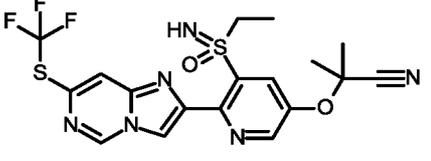
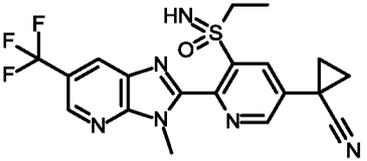
10 Пример В13. Сравнение инсектицидной активности соединений P18-A/P18-B, P10-A/P10-B, P7-A/P7-B и P16-A/P16-B, представляющих собой отдельные энантимеры, по

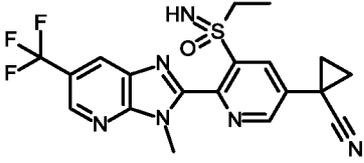
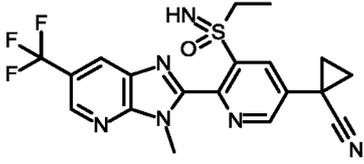
настоящему изобретению со структурно сопоставимыми рацемическими сульфоксиминовыми соединениями из уровня техники

Активность соединений P18-A, P18-B, P10-A, P10-B, P7-A, P7-B, P16-A и P16-B согласно примерам получения и соединения P13 из WO 19/234158, соединения Y-6.001 из WO 19/234158, соединения P11 из WO 20/084075, соответственно соединения P6 из WO 19/234158 в отношении *Bemisia tabaci* (пример B6) сведена в таблице B13.

Таблица B13.

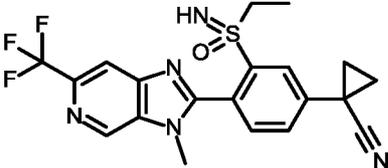
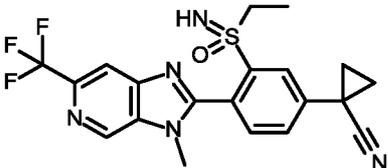
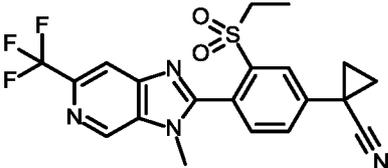
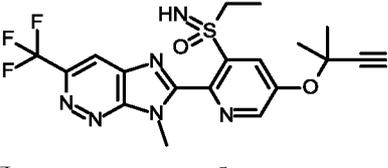
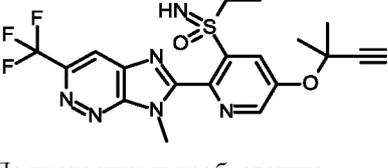
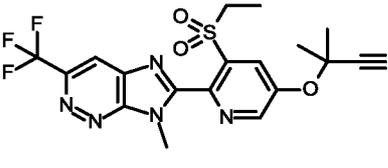
Соединение	Концентрация (ppm)	Насекомое	Смертность (%)
Соединение P18-A 	12,5	<i>Bemisia tabaci</i>	100
По настоящему изобретению			
Соединение P18-B 	12,5	<i>Bemisia tabaci</i>	80
По настоящему изобретению			
Описано в WO 19/234158 как соединение P13 	12,5	<i>Bemisia tabaci</i>	0
рац- Из уровня техники			
Соединение P10-A 	12,5	<i>Bemisia tabaci</i>	80
По настоящему изобретению			

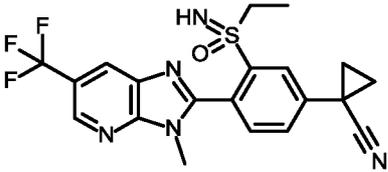
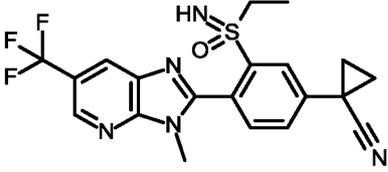
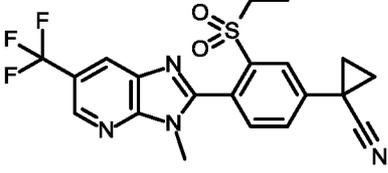
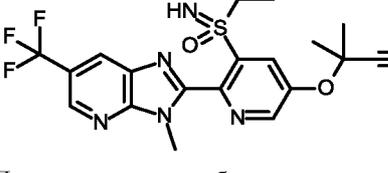
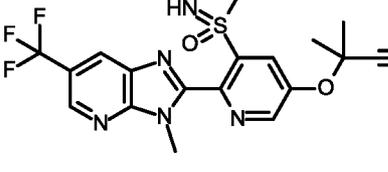
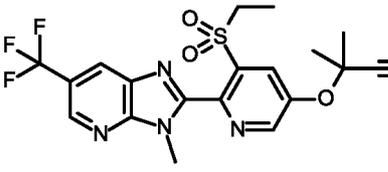
<p>Соединение P10-B</p> 	12,5	<i>Bemisia tabaci</i>	100
По настоящему изобретению			
<p>Описанное в WO 19/234158 как соединение Y-6.001</p>  <p>рац- Из уровня техники</p>	12,5	<i>Bemisia tabaci</i>	50
По настоящему изобретению			
<p>Соединение P7-A</p> 	50	<i>Bemisia tabaci</i>	80
По настоящему изобретению			
<p>Соединение P7-B</p> 	50	<i>Bemisia tabaci</i>	80
По настоящему изобретению			
<p>Описано в WO 20/084075 как соединение P11</p>  <p>рац- Из уровня техники</p>	50	<i>Bemisia tabaci</i>	50
По настоящему изобретению			
<p>Соединение P16-A</p>  <p>По настоящему изобретению</p>	12,5	<i>Bemisia tabaci</i>	100

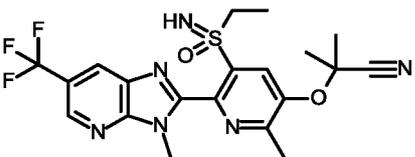
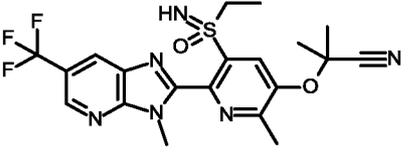
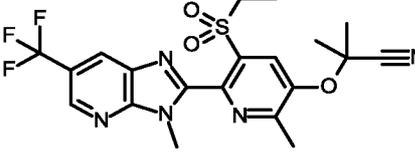
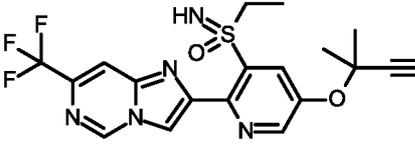
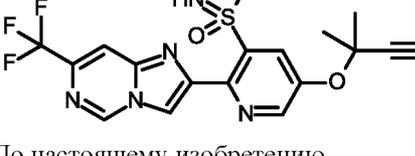
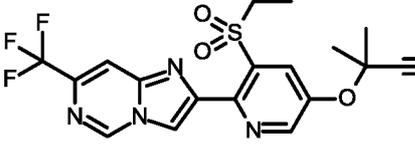
Соединение P16-B 	12,5	<i>Bemisia tabaci</i>	80
По настоящему изобретению Описано в WO 19/234158 как соединение P6  рац- Из уровня техники	12,5	<i>Bemisia tabaci</i>	50

- В таблице B13 показано, что соединения P18-A, P18-B, P10-A, P10-B, P7-A, P7-B, P16-A и P16-B, представляющие собой отдельные энантимеры (либо элюируются первыми/вторыми при хиральном разделении [таблица Z], либо энантимерно чистые/энантимерно обогащенные в результате стереоселективного синтеза [таблица Y]), по настоящему изобретению преимущественно проявляют по сути лучшее инсектицидное действие в отношении *Bemisia tabaci*, чем соединение из уровня техники.
- 5
- 10 Пример B14. Сравнение инсектицидной активности соединений P18-A/P18-B, P15-A/P15-B, P6-A/P6-B, P9-A/P9-B, P5-A/P5-B и P11-A/P11-B, представляющих собой отдельные энантимеры, по настоящему изобретению со структурно сопоставимыми рацемическими сульфоновыми соединениями из уровня техники
- 15 Активность соединений P18-A, P18-B, P15-A, P15-B, P6-A, P6-B, P9-A, P9-B, P5-A, P5-B, P11-A и P11-B согласно примерам получения и соединения P15 из WO 16/026848, соединения P2 из WO 21/219810, соединения 6.009 из WO 16/096584, соединения P3 из WO 21/219810, соединения P4 из WO 21/219810, соответственно соединения P13 из WO 18/206348 в отношении *Myzus persicae* (системное действие, пример B5) сведена в таблице B14.

Таблица В14.

Соединение	Концентрация (ppm)	Насекомое	Смертность (%)
Соединение P18-A 	1,5	<i>Myzus persicae</i> (системное действие)	100
По настоящему изобретению			
Соединение P18-B 	1,5	<i>Myzus persicae</i> (системное действие)	80
По настоящему изобретению			
Описано в WO 16/026848 как соединение P15 	1,5	<i>Myzus persicae</i> (системное действие)	50
Из уровня техники			
Соединение P15-A 	1,5	<i>Myzus persicae</i> (системное действие)	80
По настоящему изобретению			
Соединение P15-B 	1,5	<i>Myzus persicae</i> (системное действие)	100
По настоящему изобретению			
Описано в WO 21/219810 как соединение P2 	1,5	<i>Myzus persicae</i> (системное действие)	50
Из уровня техники			

Соединение P6-A 	6	<i>Myzus persicae</i> (системное действие)	80
По настоящему изобретению			
Соединение P6-B 	6	<i>Myzus persicae</i> (системное действие)	100
По настоящему изобретению			
Описано в WO 16/096584 как соединение 6.009 	6	<i>Myzus persicae</i> (системное действие)	0
Из уровня техники			
Соединение P9-A 	24	<i>Myzus persicae</i> (системное действие)	100
По настоящему изобретению			
Соединение P9-B 	24	<i>Myzus persicae</i> (системное действие)	100
По настоящему изобретению			
Описано в WO 21/219810 как соединение P3 	24	<i>Myzus persicae</i> (системное действие)	50
Из уровня техники			

Соединение P5-A 	24	<i>Myzus persicae</i> (системное действие)	100
По настоящему изобретению			
Соединение P5-B 	24	<i>Myzus persicae</i> (системное действие)	100
По настоящему изобретению			
Описано в WO 21/219810 как соединение P4 	24	<i>Myzus persicae</i> (системное действие)	0
Из уровня техники			
Соединение P11-A 	24	<i>Myzus persicae</i> (системное действие)	100
По настоящему изобретению			
Соединение P11-B 	24	<i>Myzus persicae</i> (системное действие)	100
По настоящему изобретению			
Описано в WO 18/206348 как соединение P13 	24	<i>Myzus persicae</i> (системное действие)	0
Из уровня техники			

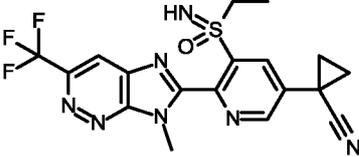
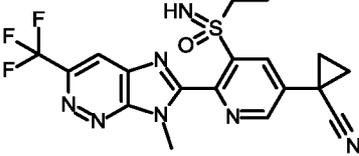
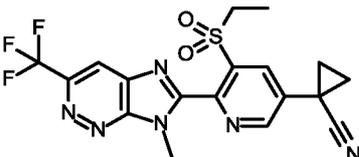
В таблице В14 показано, что соединения P18-A, P18-B, P15-A, P15-B, P6-A, P6-B, P9-A, P9-B, P5-A, P5-B, P11-A и P11-B, представляющие собой отдельные энантимеры (либо элюируются первыми/вторыми при хиральном разделении [таблица Z], либо энантимерно чистые/энантимерно обогащенные в результате стереоселективного синтеза [таблица Y]), по настоящему изобретению преимущественно проявляют по

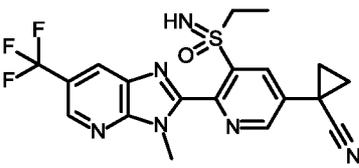
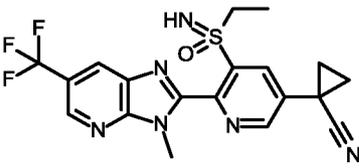
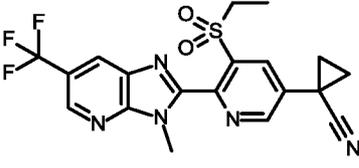
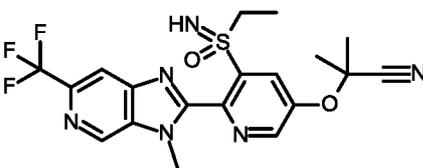
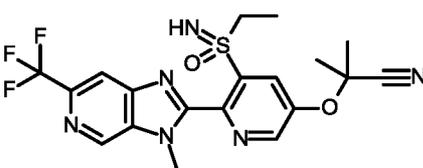
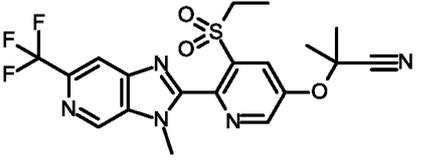
сути лучшее инсектицидное действие в отношении *Myzus persicae* (системную активность), чем соединение из уровня техники.

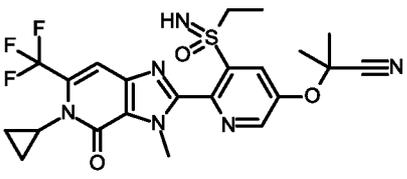
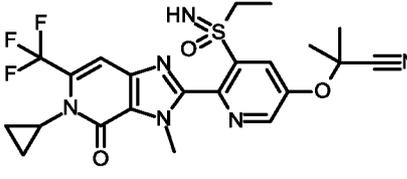
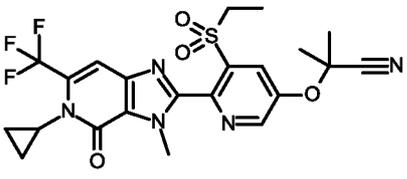
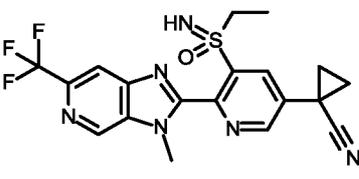
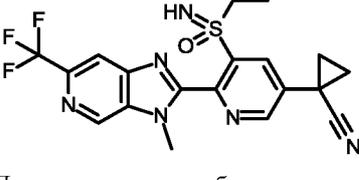
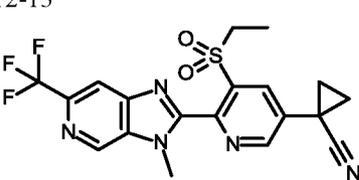
Пример В15. Сравнение инсектицидной активности соединений P2-A/P2-B, P16-A/P16-B, P13-A/P13-B, P1-A/P1-B и P10-A/P10-B, представляющих собой отдельные энантиомеры, по настоящему изобретению со структурно сопоставимыми рацемическими сульфоновыми соединениями из уровня техники

Активность соединений P2-A, P2-B, P16-A, P16-B, P13-A, P13-B, P1-A, P1-B, P10-A и P10-B согласно примерам получения и соединения Н-1 из WO 18/108726, соединения P9 из WO 16/096584 или соединения 11-13 из EP 3252046B1, соединения P18 из WO 18/197315, соединения P7 из WO 21/219810, соответственно соединения P16 из WO 16/026848 или соединения 12-13 из EP 3252046B1 в отношении *Myzus persicae* (воздействие при поедании/контактное действие, пример В4) сведена в таблице В15.

Таблица В15.

Соединение	Концентрация (ppm)	Насекомое	Смертность (%)
Соединение P2-A 	3,125	<i>Myzus persicae</i> (воздействие при поедании/контактное действие)	100
По настоящему изобретению			
Соединение P2-B 	3,125	<i>Myzus persicae</i> (воздействие при поедании/контактное действие)	50
По настоящему изобретению			
Описано в WO 18/108726 как соединение Н-1 	3,125	<i>Myzus persicae</i> (контактное действие)	80
Из уровня техники			

<p>Соединение P16-A</p> 	3,125	<i>Myzus persicae</i> (воздействие при поедании/контактное действие)	100
По настоящему изобретению			
<p>Соединение P16-B</p> 	3,125	<i>Myzus persicae</i> (воздействие при поедании/контактное действие)	100
По настоящему изобретению			
<p>Описано в WO 16/096584 как соединение P9 или в EP 3252046B1 как соединение 11-13</p> 	3,125	<i>Myzus persicae</i> (воздействие при поедании/контактное действие)	80
Из уровня техники			
<p>Соединение P13-A</p> 	12,5	<i>Myzus persicae</i> (воздействие при поедании/контактное действие)	80
По настоящему изобретению			
<p>Соединение P13-B</p> 	12,5	<i>Myzus persicae</i> (воздействие при поедании/контактное действие)	100
По настоящему изобретению			
<p>Описанное в WO 18/197315 как соединение P18</p> 	12,5	<i>Myzus persicae</i> (контактное действие)	65
Из уровня техники			

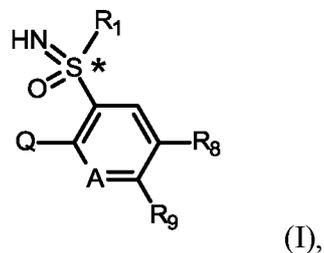
Соединение P1-A 	50	<i>Myzus persicae</i> (контактное действие)	100
По настоящему изобретению			
Соединение P1-B 	50	<i>Myzus persicae</i> (контактное действие)	100
По настоящему изобретению			
Описано в WO 21/219810 как соединение P7 	50	<i>Myzus persicae</i> (контактное действие)	0
Из уровня техники			
Соединение P10-A 	0,781	<i>Myzus persicae</i> (воздействие при поедании/контактное действие)	80
По настоящему изобретению			
Соединение P10-B 	0,781	<i>Myzus persicae</i> (воздействие при поедании/контактное действие)	80
По настоящему изобретению			
Описано в WO 16/026848 как соединение P16 или в EP 3252046B1 как соединение 12-13 	0,781	<i>Myzus persicae</i> (воздействие при поедании/контактное действие)	0
Из уровня техники			

В таблице В15 показано, что соединения P2-A, P2-B, P16-A, P16-B, P13-A, P13-B, P1-A, P1-B, P10-A и P10-B, представляющие собой отдельные энантимеры (либо элюируются первыми/вторыми при хиральном разделении [таблица Z], либо

энантимерно чистые/энантимерно обогащенные в результате стереоселективного синтеза [таблица Y]), по настоящему изобретению преимущественно проявляют по сути лучшее инсектицидное действие в отношении *Myzus persicae* (активность при поедании/контактную активность), чем соединение из уровня техники.

ФОРМУЛА ИЗОБРЕТЕНИЯ

1. Соединение формулы (I),



5 где

A представляет собой CH или N;

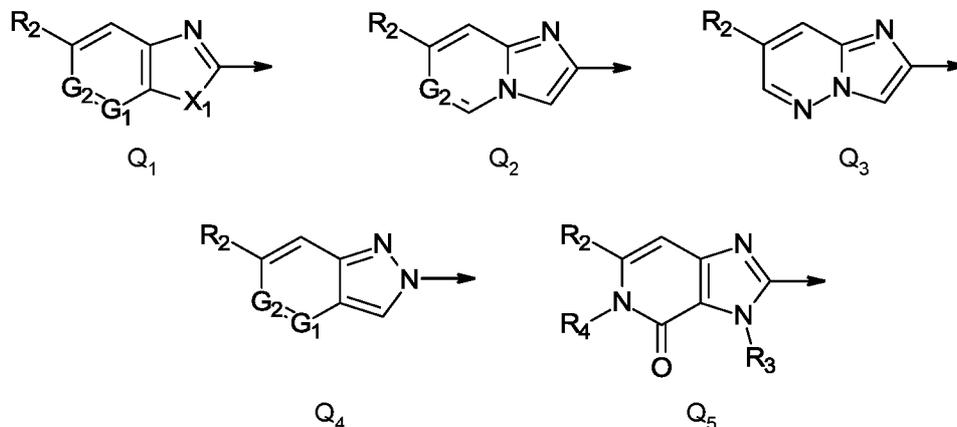
R₁ представляет собой C₁-C₄алкил;

S* представляет собой стереогенный атом серы, который находится в R- или S-конфигурации;

10 R₈ представляет собой цианоизопропокси, цианоизопропил или цианоциклопропил;

R₉ представляет собой водород или C₁-C₄алкил;

Q представляет собой радикал, выбранный из группы, состоящей из формул Q₁ - Q₅,



где стрелка обозначает точку присоединения к кольцу, содержащему радикал A;

15 и где

X₁ представляет собой O, S или NR₃;

R₃ представляет собой C₁-C₄алкил;

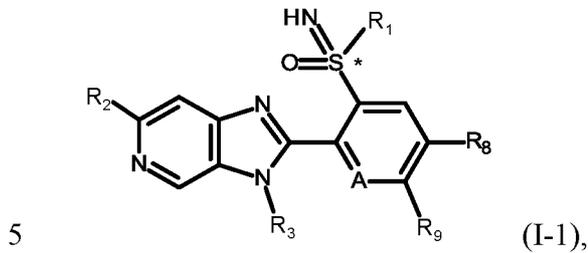
R₂ представляет собой галоген, C₁-C₆галогеналкил, C₁-C₄галогеналкилсульфанил, C₁-C₄галогеналкилсульфинил, C₁-C₄галогеналкилсульфонил или C₁-C₆галогеналкокси;

20 G₁ и G₂ независимо друг от друга представляют собой N или CH;

R₄ представляет собой C₁-C₄алкил, C₁-C₄галогеналкил, C₃-C₆циклоалкил или C₁-C₄алкокси; или

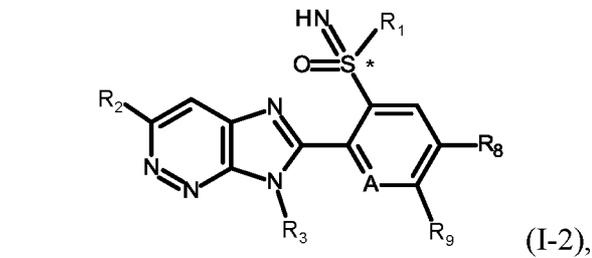
агротехнически приемлемая соль, стереоизомер, энантиомер, таутомер или N-оксид соединения формулы I.

2. Соединение формулы I по п. 1, представленное соединениями формулы I-1,



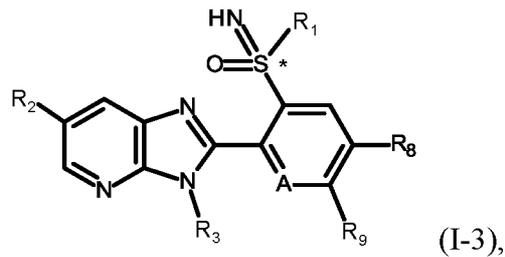
где R_1 , R_2 , R_3 , R_8 , R_9 , S^* и A определены для формулы I в п. 1.

3. Соединение формулы I по п. 1, представленное соединениями формулы I-2,



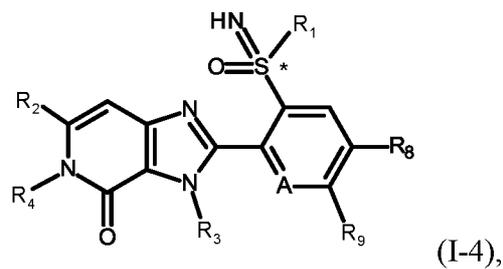
где R_1 , R_2 , R_3 , R_8 , R_9 , S^* и A определены для формулы I в п. 1.

4. Соединение формулы I по п. 1, представленное соединениями формулы I-3,



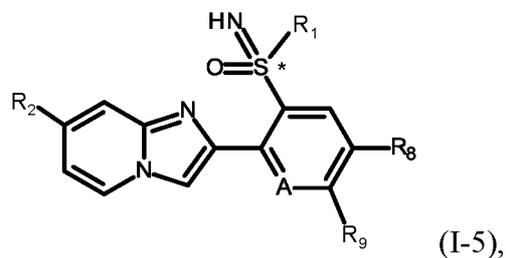
где R_1 , R_2 , R_3 , R_8 , R_9 , S^* и A определены для формулы I в п. 1.

5. Соединение формулы I по п. 1, представленное соединениями формулы I-4,



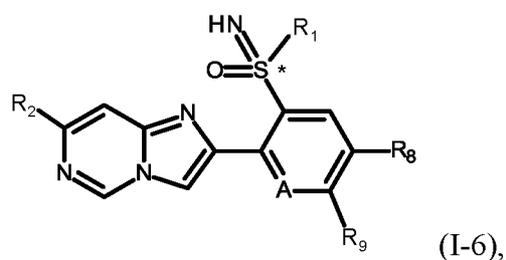
где $R_1, R_2, R_3, R_4, R_8, R_9, S^*$ и A определены для формулы I в п. 1.

6. Соединение формулы I по п. 1, представленное соединениями формулы I-5,



5 где R_1, R_2, R_8, R_9, S^* и A определены для формулы I в п. 1.

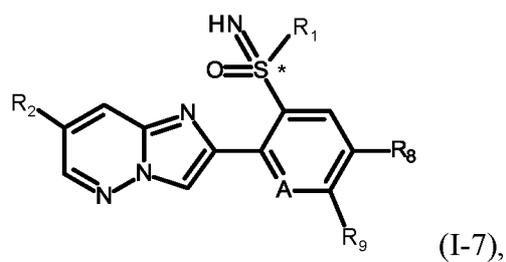
7. Соединение формулы I по п. 1, представленное соединениями формулы I-6,



где R_1, R_2, R_8, R_9, S^* и A определены для формулы I в п. 1.

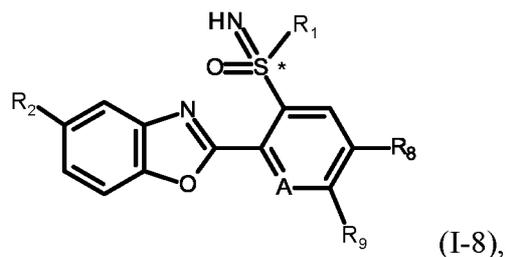
10

8. Соединение формулы I по п. 1, представленное соединениями формулы I-7,



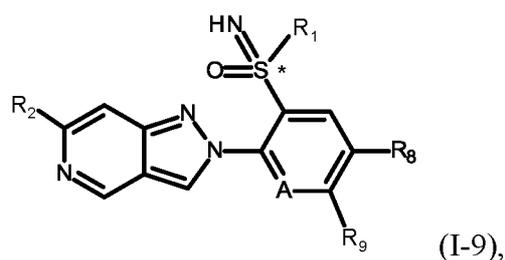
где R_1, R_2, R_8, R_9, S^* и A определены для формулы I в п. 1.

15 9. Соединение формулы I по п. 1, представленное соединениями формулы I-8,



где R_1, R_2, R_8, R_9, S^* и A определены для формулы I в п. 1.

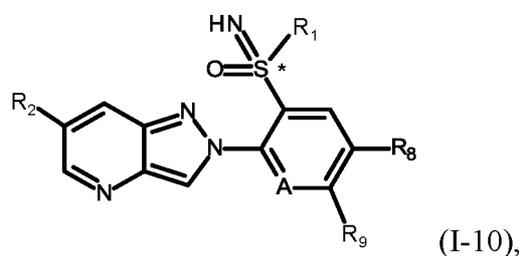
10. Соединение формулы I по п. 1, представленное соединениями формулы I-9,



где R_1 , R_2 , R_8 , R_9 , S^* и A определены для формулы I в п. 1.

5

11. Соединение формулы I по п. 1, представленное соединениями формулы I-10,



где R_1 , R_2 , R_8 , R_9 , S^* и A определены для формулы I в п. 1.

- 10 12. Соединение формулы I по любому из предыдущих пунктов, где
 A представляет собой CH или N , предпочтительно A представляет собой N ;
 S^* представляет собой стереогенный атом серы, который находится в R - или S -
конфигурации;
 R_1 представляет собой этил, пропил или изопропил; предпочтительно R_1 представляет
15 собой этил;
 R_2 представляет собой трифторметил, пentaфторэтил или трифторметилсульфанил;
предпочтительно R_2 представляет собой трифторметил;
 R_8 представляет собой 1-циано-1-метилэтокси, 1-циано-1-метилэтил или 1-
цианоциклопропил;
20 R_9 представляет собой водород или метил; предпочтительно R_9 представляет собой
водород; и
в случае соединений формулы I, где Q представляет собой Q_1 или Q_4 , G_1 представляет
собой N , и G_2 представляет собой CH , или G_1 представляет собой CH , и G_2
представляет собой N , или одновременно G_1 и G_2 представляют собой N ; и в случае
25 соединений, где Q представляет собой Q_2 , G_2 представляет собой N или CH ; и

в случае соединений формул I-1, I-2, I-3 и I-4 R₃ представляет собой метил; и в случае соединений формулы I-4 R₄ представляет собой этил, метокси или циклопропил.

13. Соединение формулы I по любому из пп. 1-12, где S* находится в R-конфигурации
5 или в энантиомерно чистой, или в энантиомерно обогащенной форме.
14. Соединение формулы I по любому из пп. 1-12, где S* находится в S-конфигурации
или в энантиомерно чистой, или в энантиомерно обогащенной форме.
- 10 15. Соединение формулы I по п. 1, выбранное из группы, состоящей из
(S)-2-[[6-[5-циклопропил-3-метил-4-оксо-6-(трифторметил)имидазо[4,5-с]пиридин-2-
ил]-5-(этилсульфонимидоил)-3-пиридил]окси]-2-метилпропаннитрила;
(R)-2-[[6-[5-циклопропил-3-метил-4-оксо-6-(трифторметил)имидазо[4,5-с]пиридин-2-
ил]-5-(этилсульфонимидоил)-3-пиридил]окси]-2-метилпропаннитрила;
15 (S)-1-[5-(этилсульфонимидоил)-6-[7-метил-3-(трифторметил)имидазо[4,5-с]пиридазин-
6-ил]-3-пиридил]циклопропанкарбонитрила;
(R)-1-[5-(этилсульфонимидоил)-6-[7-метил-3-(трифторметил)имидазо[4,5-с]пиридазин-
6-ил]-3-пиридил]циклопропанкарбонитрила;
(S)-2-[[5-(этилсульфонимидоил)-6-[7-(трифторметил)имидазо[1,2-а]пиридин-2-ил]-3-
20 пиридил]окси]-2-метилпропаннитрила;
(R)-2-[[5-(этилсульфонимидоил)-6-[7-(трифторметил)имидазо[1,2-а]пиридин-2-ил]-3-
пиридил]окси]-2-метилпропаннитрила;
(S)-2-[5-(этилсульфонимидоил)-6-[3-метил-6-(трифторметил)имидазо[4,5-с]пиридин-2-
ил]-3-пиридил]-2-метилпропаннитрила;
25 (R)-2-[5-(этилсульфонимидоил)-6-[3-метил-6-(трифторметил)имидазо[4,5-с]пиридин-2-
ил]-3-пиридил]-2-метилпропаннитрила;
(S)-2-[[5-(этилсульфонимидоил)-2-метил-6-[3-метил-6-(трифторметил)имидазо[4,5-
b]пиридин-2-ил]-3-пиридил]окси]-2-метилпропаннитрила;
(R)-2-[[5-(этилсульфонимидоил)-2-метил-6-[3-метил-6-(трифторметил)имидазо[4,5-
30 b]пиридин-2-ил]-3-пиридил]окси]-2-метилпропаннитрила;
(S)-1-[3-(этилсульфонимидоил)-4-[3-метил-6-(трифторметил)имидазо[4,5-b]пиридин-2-
ил]фенил]циклопропанкарбонитрила;

- (R)-1-[3-(этилсульфонимидоил)-4-[3-метил-6-(трифторметил)имидазо[4,5-b]пиридин-2-ил]фенил]циклопропанкарбонитрила;
- (S)-2-[[5-(этилсульфонимидоил)-6-[7-(трифторметилсульфанил)имидазо[1,2-с]пиримидин-2-ил]-3-пиридил]окси]-2-метилпропаннитрила;
- 5 (R)-2-[[5-(этилсульфонимидоил)-6-[7-(трифторметилсульфанил)имидазо[1,2-с]пиримидин-2-ил]-3-пиридил]окси]-2-метилпропаннитрила;
- (S)-1-[5-(этилсульфонимидоил)-6-[5-метокси-3-метил-4-оксо-6-(трифторметил)имидазо[4,5-с]пиридин-2-ил]-3-пиридил]циклопропанкарбонитрила;
- (R)-1-[5-(этилсульфонимидоил)-6-[5-метокси-3-метил-4-оксо-6-
- 10 (трифторметил)имидазо[4,5-с]пиридин-2-ил]-3-пиридил]циклопропанкарбонитрила;
- (S)-2-[[5-(этилсульфонимидоил)-6-[3-метил-6-(трифторметил)имидазо[4,5-b]пиридин-2-ил]-3-пиридил]окси]-2-метилпропаннитрила;
- (R)-2-[[5-(этилсульфонимидоил)-6-[3-метил-6-(трифторметил)имидазо[4,5-b]пиридин-2-ил]-3-пиридил]окси]-2-метилпропаннитрила;
- 15 (S)-1-[5-(этилсульфонимидоил)-6-[3-метил-6-(трифторметил)имидазо[4,5-с]пиридин-2-ил]-3-пиридил]циклопропанкарбонитрила;
- (R)-1-[5-(этилсульфонимидоил)-6-[3-метил-6-(трифторметил)имидазо[4,5-с]пиридин-2-ил]-3-пиридил]циклопропанкарбонитрила;
- (S)-2-[[5-(этилсульфонимидоил)-6-[7-(трифторметил)имидазо[1,2-с]пиримидин-2-ил]-3-
- 20 пиридил]окси]-2-метилпропаннитрила;
- (R)-2-[[5-(этилсульфонимидоил)-6-[7-(трифторметил)имидазо[1,2-с]пиримидин-2-ил]-3-пиридил]окси]-2-метилпропаннитрила;
- (S)-2-[5-(этилсульфонимидоил)-6-[3-метил-6-(трифторметил)имидазо[4,5-b]пиридин-2-ил]-3-пиридил]-2-метилпропаннитрила;
- 25 (R)-2-[5-(этилсульфонимидоил)-6-[3-метил-6-(трифторметил)имидазо[4,5-b]пиридин-2-ил]-3-пиридил]-2-метилпропаннитрила;
- (S)-2-[[5-(этилсульфонимидоил)-6-[3-метил-6-(трифторметил)имидазо[4,5-с]пиридин-2-ил]-3-пиридил]окси]-2-метилпропаннитрила;
- (R)-2-[[5-(этилсульфонимидоил)-6-[3-метил-6-(трифторметил)имидазо[4,5-с]пиридин-
- 30 2-ил]-3-пиридил]окси]-2-метилпропаннитрила;
- (S)-1-[6-[5-этил-3-метил-4-оксо-6-(трифторметил)имидазо[4,5-с]пиридин-2-ил]-5-(этилсульфонимидоил)-3-пиридил]циклопропанкарбонитрила;

- (R)-1-[6-[5-этил-3-метил-4-оксо-6-(трифторметил)имидазо[4,5-с]пиридин-2-ил]-5-(этилсульфонимидоил)-3-пиридил]циклопропанкарбонитрила;
- (S)-2-[[5-(этилсульфонимидоил)-6-[7-метил-3-(трифторметил)имидазо[4,5-с]пиридазин-6-ил]-3-пиридил]окси]-2-метилпропаннитрила;
- 5 (R)-2-[[5-(этилсульфонимидоил)-6-[7-метил-3-(трифторметил)имидазо[4,5-с]пиридазин-6-ил]-3-пиридил]окси]-2-метилпропаннитрила;
- (S)-1-[5-(этилсульфонимидоил)-6-[3-метил-6-(трифторметил)имидазо[4,5-b]пиридин-2-ил]-3-пиридил]циклопропанкарбонитрила;
- (R)-1-[5-(этилсульфонимидоил)-6-[3-метил-6-(трифторметил)имидазо[4,5-b]пиридин-2-ил]-3-пиридил]циклопропанкарбонитрила;
- 10 (S)-2-[[5-(этилсульфонимидоил)-2-метил-6-[3-метил-6-(трифторметил)имидазо[4,5-с]пиридин-2-ил]-3-пиридил]окси]-2-метилпропаннитрила;
- (R)-2-[[5-(этилсульфонимидоил)-2-метил-6-[3-метил-6-(трифторметил)имидазо[4,5-с]пиридин-2-ил]-3-пиридил]окси]-2-метилпропаннитрила;
- (S)-1-[3-(этилсульфонимидоил)-4-[3-метил-6-(трифторметил)имидазо[4,5-с]пиридин-2-ил]фенил]циклопропанкарбонитрила;
- (R)-1-[3-(этилсульфонимидоил)-4-[3-метил-6-(трифторметил)имидазо[4,5-с]пиридин-2-ил]фенил]циклопропанкарбонитрила;
- (S)-2-[[6-[5-этил-3-метил-4-оксо-6-(трифторметил)имидазо[4,5-с]пиридин-2-ил]-5-(этилсульфонимидоил)-3-пиридил]окси]-2-метилпропаннитрила и
- 20 (R)-2-[[6-[5-этил-3-метил-4-оксо-6-(трифторметил)имидазо[4,5-с]пиридин-2-ил]-5-(этилсульфонимидоил)-3-пиридил]окси]-2-метилпропаннитрила.

16. Пестицидная композиция, которая содержит по меньшей мере одно соединение формулы I по любому из пп. 1-15 или в соответствующих случаях его таутомер, в каждом случае в свободной форме или в форме агрохимически применимой соли, в качестве активного ингредиента и по меньшей мере одну добавку.

25

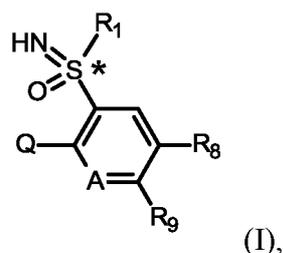
17. Способ осуществления контроля вредителей, который включает применение по отношению к вредителю, по отношению к месту обитания вредителя или по отношению к растению, восприимчивому к воздействию вредителя, пестицидно эффективного количества соединения формулы I по любому из пп. 1-15 или композиции по п. 16.

30

18. Способ защиты материала для размножения растений от нападения вредителей, который включает обработку материала для размножения или участка, где посажен материал для размножения, с помощью композиции по п. 16.

5

19. Способ получения соединения формулы (I),

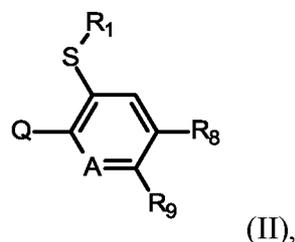


где Q, R₁, R₂, G₁, G₂, X₁, R₃, R₄, R₈, R₉ и A определены для формулы (I) в п. 1, и где S* представляет собой стереогенный атом серы в R- или S-конфигурации, при этом указанный S*-центр находится или в энантимерно чистой, или в энантимерно обогащенной форме;

10

при этом способ включает:

(C) стереоселективное окисление сульфанилового соединения формулы (II),

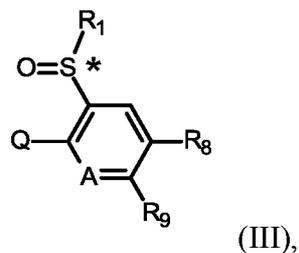


15

где Q, R₁, R₂, G₁, G₂, X₁, R₃, R₄, R₈, R₉ и A определены для формулы (I),

в присутствии окислителя, в присутствии металлического катализатора, в присутствии хирального лиганда, необязательно в присутствии подходящей добавки, в подходящем растворителе (или разбавителе)

с получением сульфанильного соединения формулы (III),

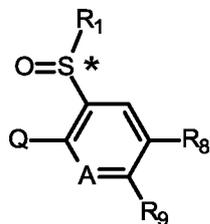


20

где Q, R₁, R₂, G₁, G₂, X₁, R₃, R₄, R₈, R₉ и A определены для формулы (I), и

где S* представляет собой стереогенный атом серы в R- или S-конфигурации, при этом указанный S*-центр находится или в энантимерно чистой, или в энантимерно обогащенной форме; и

(D) осуществление реакции сульфинильного соединения формулы (III),



5 (III),

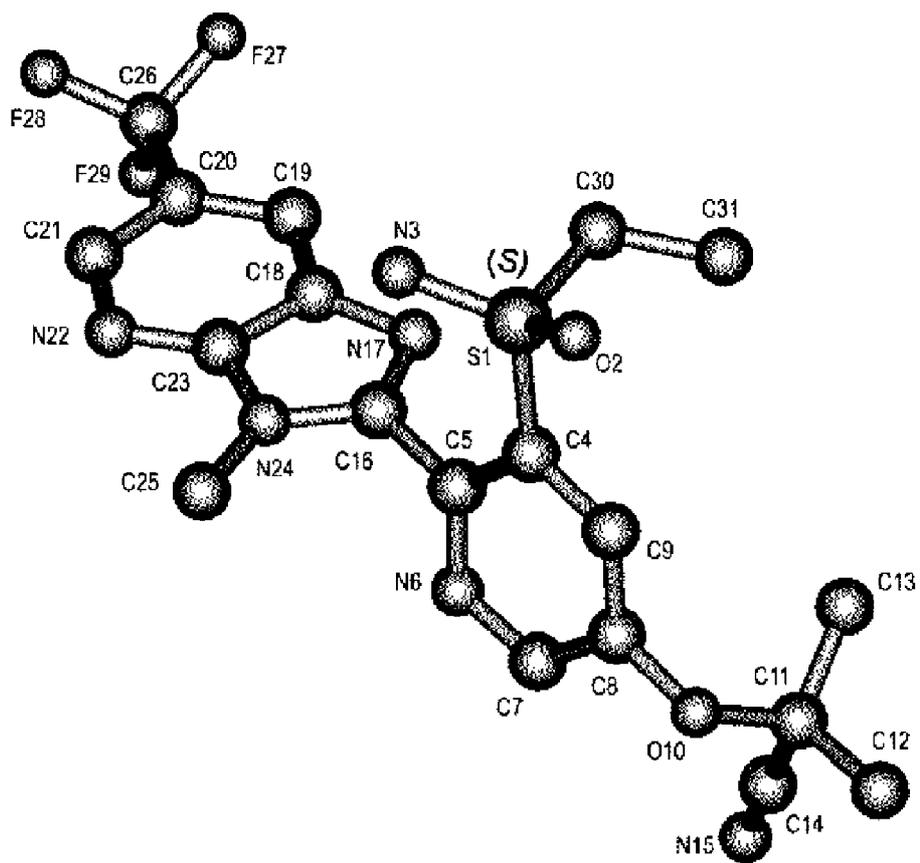
где Q, R₁, R₂, G₁, G₂, X₁, R₃, R₄, R₈, R₉ и A определены для формулы (I), и

где S* представляет собой стереогенный атом серы в R- или S-конфигурации, при этом указанный S*-центр находится или в энантимерно чистой, или в энантимерно обогащенной форме;

10 с иминирующим реагентом в присутствии катализатора, необязательно в присутствии подходящей добавки, в подходящем растворителе (или разбавителе);

с получением сульфоксиминового соединения формулы (I) стереоспецифическим способом.

15 20. Соединение по любому из пп. 1-15, или полученное, или получаемое с помощью способа по п. 19.



Фиг. 1