



ФЕДЕРАЛЬНАЯ СЛУЖБА
ПО ИНТЕЛЛЕКТУАЛЬНОЙ СОБСТВЕННОСТИ

(51) МПК

C07D 403/12 (2006.01)
C07D 403/14 (2006.01)
C07D 401/14 (2006.01)
C07D 405/12 (2006.01)
C07D 405/14 (2006.01)
C07D 409/12 (2006.01)
C07D 409/14 (2006.01)
C07D 413/12 (2006.01)
C07D 417/12 (2006.01)
C07D 417/14 (2006.01)

C07D 411/14 (2006.01)
A01N 43/40 (2006.01)
A01N 43/56 (2006.01)
A01N 43/60 (2006.01)
A01N 43/647 (2006.01)
A01N 43/78 (2006.01)
A01N 43/08 (2006.01)
A01N 43/10 (2006.01)
A01P 3/00 (2006.01)

(12) ОПИСАНИЕ ИЗОБРЕТЕНИЯ К ПАТЕНТУ

(52) СПК

C07D 403/12 (2006.01); C07D 403/14 (2006.01); C07D 401/14 (2006.01); C07D 405/12 (2006.01); C07D 405/14 (2006.01); C07D 409/12 (2006.01); C07D 409/14 (2006.01); C07D 413/12 (2006.01); C07D 417/12 (2006.01); C07D 417/14 (2006.01); C07D 411/14 (2006.01); A01N 43/40 (2006.01); A01N 43/56 (2006.01); A01N 43/60 (2006.01); A01N 43/647 (2006.01); A01N 43/78 (2006.01); A01N 43/08 (2006.01); A01N 43/10 (2006.01)

(21)(22) Заявка: 2015102834, 10.06.2013

(24) Дата начала отсчета срока действия патента:
10.06.2013

Дата регистрации:
11.10.2018

Приоритет(ы):

(30) Конвенционный приоритет:
29.06.2012 US 61/666,531;
13.03.2013 US 61/780,401;
03.05.2013 US 61/819,217

(43) Дата публикации заявки: 20.08.2016 Бюл. № 23

(45) Опубликовано: 11.10.2018 Бюл. № 29

(85) Дата начала рассмотрения заявки РСТ на национальной фазе: 29.01.2015

(86) Заявка РСТ:
US 2013/044951 (10.06.2013)

(87) Публикация заявки РСТ:
WO 2014/004064 (03.01.2014)

Адрес для переписки:

129090, Москва, ул. Б. Спасская, 25, строение 3, ООО "Юридическая фирма Городисский и Партнеры"

(72) Автор(ы):

БЕРЕЗНАК Джеймс Фрэнсис (US),
ГАТТРИДЖ Стивен (US),
ТАГГИ Эндрю Эдмунд (US),
РЕДДИ Рависекхара П. (IN),
КЕМПБЕЛЛ Мэттью Джеймс (US),
КАР Моумита (IN),
ДЕСАЕГЕР Йохан А. Дж. (US)

(73) Патентообладатель(и):

Е.И.ДЮПОН ДЕ НЕМУР ЭНД
КОМПАНИ (US)

(56) Список документов, цитированных в отчете о поиске: WO 2008/148570 A1, 11.12.2008. WO 2007/141009 A1, 13.12.2007. EP 1574511 A1, 14.09.2005. RU 2004107485 A, 27.03.2005. US 20110136831 A1, 09.06.2011.

(54) ФУНГИЦИДНЫЕ ГЕТЕРОЦИКЛИЧЕСКИЕ КАРБОКСАМИДЫ

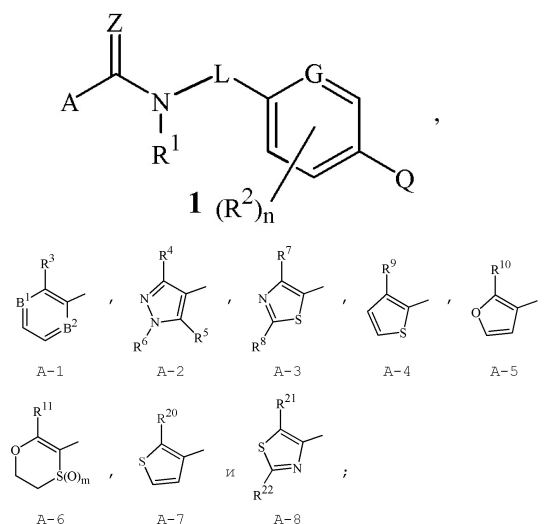
(57) Реферат:

Изобретение относится к соединению, выбранному из формулы 1, и его соли, где А представляет собой радикал, выбранный из

группы, состоящей из А-1, А-2, А-3, А-4, А-6, А-7 и А-8; R¹ представляет собой Н или циклопропил; Z представляет собой О или S; L представляет

собой $-C(R^{12a})R^{12b}-C(R^{13a})R^{13b}-$, где атом углерода, связанный с R^{12a} и R^{12b} , также связан с атомом азота карбоксамида в формуле 1; или 1,2-фенилен, необязательно имеющий до 4 заместителей, независимо выбранных из галогена и C_1 - C_2 алкила; G представляет собой N или $C-R^{2a}$; каждый R^2 независимо представляет собой галоген, нитро, циано, C_1 - C_2 алкил или C_1 - C_2 галогеналкил; n равняется 0, 1, 2 или 3; R^{2a} представляет собой H, галоген, C_1 - C_2 алкил, C_1 - C_2 галогеналкил или C_1 - C_2 алкокси; B^1 представляет собой CH или N; B^2 представляет собой CH или N; R^3 представляет собой галоген, C_1 - C_3 алкил или C_1 - C_3 галогеналкил; R^4 представляет собой C_1 - C_3 галогеналкил; R^5 представляет собой C_1 - C_3 галогеналкил; R^6 представляет собой H; R^7 представляет собой C_1 - C_2 алкил; R^8 представляет собой C_1 - C_3 алкил или C_1 - C_3 галогеналкил; R^9 представляет собой галоген, C_1 - C_3 алкил или C_1 - C_3 галогеналкил; R^{11} представляет собой C_1 - C_3 алкил; m равняется 0, 1 или 2; каждый из R^{12a} и R^{12b} независимо представляет собой H, C_1 - C_2 алкил; R^{12a} и R^{12b} , взятые вместе, представляют собой C_2 - C_4 алкандиил; R^{13a} представляет собой H, галоген, C_1 - C_2 алкил, C_1 - C_2 алкокси или

C_1 - C_2 алкоксиамино; R^{13b} представляет собой H, галоген; или R^{13a} и R^{13b} , взятые вместе, представляют собой C_2 - C_4 алкандиил; Q представляет собой 5-членное ненасыщенное гетероциклическое кольцо, содержащее члены кольца, выбранные из атомов углерода и до 3 гетероатомов, независимо выбранных из до 1 атома O, до 3 атомов N, где до 1 члена кольца, представляющего собой атом углерода, независимо выбран из $C(=O)$, причем кольцо необязательно замещено одним заместителем R^{14c} , R^{14n} , R^{15c} или R^{15n} ; R^{20} представляет собой C_1 - C_3 алкил; R^{21} представляет собой C_1 - C_3 алкил или C_1 - C_3 галогеналкил; и R^{22} представляет собой H. Соединения по изобретению предназначены для применения в качестве фунгицидов. 5 н. и 10 з.п. ф-лы, 6347 табл., 11 пр.





FEDERAL SERVICE
FOR INTELLECTUAL PROPERTY

(51) Int. Cl.

C07D 403/12 (2006.01)
C07D 403/14 (2006.01)
C07D 401/14 (2006.01)
C07D 405/12 (2006.01)
C07D 405/14 (2006.01)
C07D 409/12 (2006.01)
C07D 409/14 (2006.01)
C07D 413/12 (2006.01)
C07D 417/12 (2006.01)
C07D 417/14 (2006.01)

C07D 411/14 (2006.01)
A01N 43/40 (2006.01)
A01N 43/56 (2006.01)
A01N 43/60 (2006.01)
A01N 43/647 (2006.01)
A01N 43/78 (2006.01)
A01N 43/08 (2006.01)
A01N 43/10 (2006.01)
A01P 3/00 (2006.01)

(12) **ABSTRACT OF INVENTION**

(52) CPC

C07D 403/12 (2006.01); *C07D 403/14* (2006.01); *C07D 401/14* (2006.01); *C07D 405/12* (2006.01); *C07D 405/14* (2006.01); *C07D 409/12* (2006.01); *C07D 409/14* (2006.01); *C07D 413/12* (2006.01); *C07D 417/12* (2006.01); *C07D 417/14* (2006.01); *C07D 411/14* (2006.01); *A01N 43/40* (2006.01); *A01N 43/56* (2006.01); *A01N 43/60* (2006.01); *A01N 43/647* (2006.01); *A01N 43/78* (2006.01); *A01N 43/08* (2006.01); *A01N 43/10* (2006.01)

(21)(22) Application: 2015102834, 10.06.2013

(24) Effective date for property rights:
10.06.2013

Registration date:
11.10.2018

Priority:

(30) Convention priority:
29.06.2012 US 61/666,531;
13.03.2013 US 61/780,401;
03.05.2013 US 61/819,217

(43) Application published: 20.08.2016 Bull. № 23

(45) Date of publication: 11.10.2018 Bull. № 29

(85) Commencement of national phase: 29.01.2015

(86) PCT application:
US 2013/044951 (10.06.2013)

(87) PCT publication:
WO 2014/004064 (03.01.2014)

Mail address:

129090, Moskva, ul. B. Spasskaya, 25, stroenie 3,
OOO "Yuridicheskaya firma Gorodisskij i
Partnery"

(72) Inventor(s):

BEREZNAK Dzhejms Frensis (US),
GATTRIDZH Stiven (US),
TAGGI Endryu Edmund (US),
REDDI Ravisekkhara P. (IN),
KEMPBELL Mettyu Dzhejms (US),
KAR Moumita (IN),
DESAEGER Jokhan A. Dzh. (US)

(73) Proprietor(s):

E.I.DYUPON DE NEMUR END KOMPANI
(US)

(54) **FUNGICIDAL HETEROCYCLIC CARBOXAMIDES**

(57) Abstract:

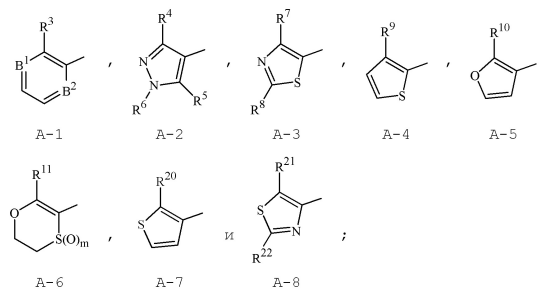
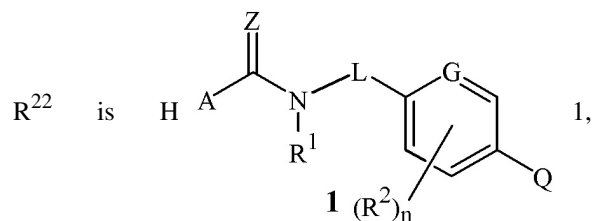
FIELD: chemistry.

SUBSTANCE: invention relates to a compound selected from formula 1 and a salt thereof, wherein A is a radical selected from the group consisting of A-1, A-2, A-3, A-4, A-6, A-7 and A-8; R¹ is H or

cyclopropyl; Z is O or S; L is -C(R^{12a})R^{12b}-C(R^{13a})R^{13b}-, where the carbon atom bound to R^{12a} and R^{12b} is also linked to the nitrogen atom of the carboxamide in formula 1; or 1,2-phenylene optionally having up to 4 substituents independently

selected from halogen and C₁-C₂alkyl; G is N or CR^{2a}, each R² is independently halogen, nitro, cyano, C₁-C₂alkyl or C₁-C₂haloalkyl; n is 0, 1, 2, or 3; R^{2a} is H, halogen, C₁-C₂alkyl, C₁-C₂haloalkyl or C₁-C₂alkoxy; B¹ is CH or N; B² is CH or N; R³ is halogen, C₁-C₃alkyl or C₁-C₃haloalkyl; R⁴ is C₁-C₃haloalkyl; R⁵ is H; R⁶ is C₁-C₂alkyl; R⁷ is C₁-C₃alkyl or C₁-C₃haloalkyl; R⁸ is H or C₁-C₂alkyl; R⁹ is halogen, C₁-C₃alkyl or C₁-C₃haloalkyl; R¹¹ is C₁-C₃alkyl; m is 0, 1, or 2; each of R^{12a} and R^{12b} is independently H, C₁-C₂alkyl; R^{12a} and R^{12b}, taken together, are C₂-C₄alkanediyl; R^{13a} is H, halogen, C₁-C₂alkyl, C₁-C₂alkoxy or C₁-C₂alkoxyamino; R^{13b} is H, halogen; or R^{13a} and R^{13b}, taken together, are C₂-C₄alkanediyl; Q is a 5-membered unsaturated heterocyclic ring containing ring members selected from carbon atoms and up to 3 heteroatoms independently selected from up to 1 O atom to 3 N atoms, wherein up to 1 ring member representing a

carbon atom is independently selected from C(=O), wherein the ring is optionally substituted with one substituent R^{14c}, R¹⁴ⁿ, R^{15c} or and R¹⁵ⁿ; R²⁰ is C₁-C₃alkyl; R²¹ is C₁-C₃alkyl or C₁-C₃haloalkyl; and



A-1, A-2, A-3, A-4, A-6, A-7 and A-8.

EFFECT: compounds of the invention are intended for use as fungicides.

15 cl, 6347 tbl, 11 ex

R U 2 6 6 9 3 5 8 C 2

R U 2 6 6 9 3 5 8 C 2

ОБЛАСТЬ ИЗОБРЕТЕНИЯ

Настоящее изобретение относится к определенным гетероциклическим карбоксиамам, их N-оксидам, солям и композициям и способам их применения в качестве фунгицидов и нематоцидов.

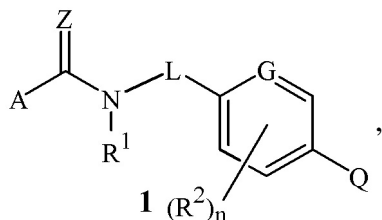
ПРЕДПОСЫЛКИ ИЗОБРЕТЕНИЯ

Контроль болезней растений, вызванных патогенными для растений грибами, чрезвычайно важен для достижения высокой производительности сельскохозяйственных культур. Болезнь растений, повреждающая декоративные, овощные, полевые, зерновые и плодовые сельскохозяйственные культуры, может вызывать значительное снижение продуктивности и в связи с этим приводить к повышению затрат для потребителя. Для этих целей коммерчески доступно множество продуктов, однако остается потребность в новых соединениях, которые являются более эффективными, менее дорогими, менее токсичными, более безопасными для окружающей среды или имеют различные участки приложения действия.

Контроль нематод-паразитов растений также чрезвычайно важен для достижения высокой производительности сельскохозяйственных культур. Вызываемое нематодами повреждение корней может обуславливать значительное снижение урожайности и качества сельскохозяйственных культур и в связи с этим приводит в результате к повышению затрат для потребителя. Также остается потребность в новых соединениях, которые являются более эффективными, менее дорогими, менее токсичными, более безопасными для окружающей среды или имеют различные механизмы действия.

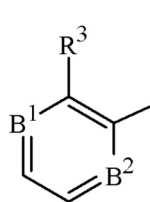
КРАТКОЕ ОПИСАНИЕ ИЗОБРЕТЕНИЯ

Настоящее изобретение направлено на соединения формулы 1 (включая все стереоизомеры), их N-оксиды и соли, сельскохозяйственные композиции, содержащие их, и их применение в качестве фунгицидов:

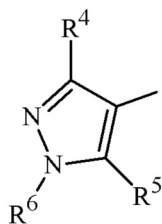


где

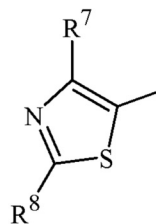
A представляет собой радикал, выбранный из группы, состоящей из



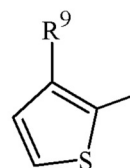
A-1



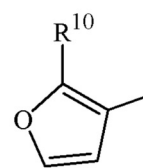
A-2



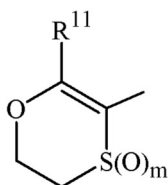
A-3



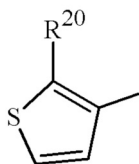
A-4



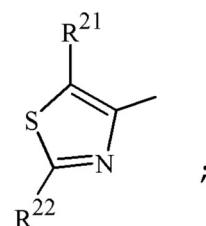
A-5



A-6



A-7



A-8

Z представляет собой O или S;

R^1 представляет собой H, циклопропил или C_1 - C_2 алкокси;

5 L представляет собой $-C(R^{12a})R^{12b}-C(R^{13a})R^{13b}-$, где атом углерода, связанный с R^{12a} и R^{12b} , также связан с атомом азота карбоксамида в формуле 1; или 1,2-фенилен, необязательно имеющий до 4 заместителей, независимо выбранных из галогена и C_1 - C_2 алкила;

G представляет собой N или $C-R^{2a}$;

10 каждый R^2 независимо представляет собой галоген, нитро, циано, C_1 - C_2 алкил, C_1 - C_2 галогеналкил, C_1 - C_2 алкокси или C_1 - C_2 галогеналкокси;
n равняется 0, 1, 2 или 3;

R^{2a} представляет собой H, галоген, нитро, циано, C_1 - C_2 алкил, C_1 - C_2 галогеналкил,
15 C_1 - C_2 алкокси или C_1 - C_2 галогеналкокси;

V^1 представляет собой CH или N;

V^2 представляет собой CH или N;

20 R^3 представляет собой галоген, C_1 - C_3 алкил или C_1 - C_3 галогеналкил;

R^4 представляет собой галоген, C_1 - C_3 алкил или C_1 - C_3 галогеналкил;

R^5 представляет собой H, галоген, C_1 - C_3 алкил или C_1 - C_3 галогеналкил;

R^6 представляет собой C_1 - C_2 алкил;

25 R^7 представляет собой галоген, C_1 - C_3 алкил или C_1 - C_3 галогеналкил;

R^8 представляет собой H, C_1 - C_2 алкил или C_1 - C_2 галогеналкил;

R^9 представляет собой галоген, C_1 - C_3 алкил или C_1 - C_3 галогеналкил;

30 R^{10} представляет собой галоген, C_1 - C_3 алкил или C_1 - C_3 галогеналкил;

R^{11} представляет собой галоген, C_1 - C_3 алкил или C_1 - C_3 галогеналкил;

m равняется 0, 1 или 2;

каждый из R^{12a} и R^{12b} независимо представляет собой H, C_1 - C_2 алкил или
35 C_1 - C_2 галогеналкил; или

R^{12a} и R^{12b} , взятые вместе, представляют собой C_2 - C_4 алкандиил;

R^{13a} представляет собой H, галоген, C_1 - C_2 алкил, C_1 - C_2 галогеналкил, C_1 - C_2 алкокси,
40 C_1 - C_2 галогеналкокси, C_1 - C_2 алкилтио или C_1 - C_2 алкоксиамино;

R^{13b} представляет собой H, галоген, C_1 - C_2 алкил или C_1 - C_2 галогеналкил; или

R^{13a} и R^{13b} , взятые вместе, представляют собой C_2 - C_4 алкандиил;

45 Q представляет собой 5-членное ненасыщенное гетероциклическое кольцо, содержащее члены кольца, выбранные из атомов углерода и до 4 гетероатомов, независимо выбранных из до 1 атома O, до 1 атома S и до 4 атомов N, где до 2 членов кольца, представляющих собой атом углерода, независимо выбраны из $C(=O)$, причем кольцо необязательно замещено одним заместителем при члене кольца, удаленном

относительно члена кольца, соединяющего гетероароматическое кольцо с остальной частью формулы 1, причем указанный необязательный заместитель выбран из R^{14c} при членах кольца, представляющих собой атом углерода, и из R^{14n} при членах кольца, представляющих собой атом азота, при этом гетероциклическое кольцо дополнительно
 5 необязательно замещено заместителями, выбранными из R^{15c} при членах кольца, представляющих собой атом углерода, и R^{15n} при членах кольца, представляющих собой атом азота;

каждый R^{14c} независимо представляет собой галоген, циано, C_1 - C_3 алкил, C_1 - C_3 галогеналкил, C_1 - C_3 алкокси, C_1 - C_3 галогеналкокси, C_2 - C_3 алкоксикарбонил или C_2 - C_4 алкилкарбонил; или фенильное кольцо, которое необязательно имеет до 5 заместителей, независимо выбранных из R^{16} ; или гетероароматическое кольцо, которое
 15 необязательно имеет до 4 заместителей, независимо выбранных из R^{17c} при членах кольца, представляющих собой атом углерода, и из R^{17n} при членах кольца, представляющих собой атом азота;

каждый R^{14n} независимо представляет собой C_1 - C_3 алкил, C_1 - C_3 галогеналкил или C_1 - C_3 алкокси; или фенильное кольцо, которое необязательно имеет до 5 заместителей, независимо выбранных из R^{18} ; или гетероароматическое кольцо, которое необязательно имеет до 4 заместителей, независимо выбранных из R^{19c} при членах кольца, представляющих собой атом углерода, и из R^{19n} при членах кольца, представляющих
 25 собой атом азота;

каждый R^{15c} независимо представляет собой галоген, C_1 - C_3 алкил, C_1 - C_3 галогеналкил или C_1 - C_3 алкокси;

каждый R^{15n} независимо представляет собой C_1 - C_3 алкил, C_1 - C_3 галогеналкил или C_1 - C_3 алкокси;

каждый из R^{16} , R^{17c} , R^{18} и R^{19c} независимо представляет собой галоген, циано, C_1 - C_2 алкил, C_1 - C_2 галогеналкил, C_1 - C_2 алкокси или C_1 - C_2 галогеналкокси;

каждый из R^{17n} и R^{19n} независимо представляет собой C_1 - C_2 алкил, C_1 - C_2 галогеналкил или C_1 - C_2 алкокси;

R^{20} представляет собой галоген, C_1 - C_3 алкил или C_1 - C_3 галогеналкил;

R^{21} представляет собой галоген, C_1 - C_3 алкил или C_1 - C_3 галогеналкил; и

R^{22} представляет собой H, C_1 - C_2 алкил или C_1 - C_2 галогеналкил;

при условии, что соединения формулы 1 являются отличными от следующих: 2-метил-N-[2-[4-(1H-пиразол-1-ил)фенил]этил]-5-тиазолкарбоксамид (регистрационный номер CAS 1280893-34-6), N-[2-[4-(3,5-диметил-1H-пиразол-1-ил)фенил]этил]-1,3,5-триметил-1H-пиразол-4-карбоксамид (регистрационный номер CAS 1252412-06-8), 2-бром-N-[2-[4-(1H-пиразол-1-ил)фенил]этил]бензамид (регистрационный номер CAS 1169974-02-0), 3-метил-N-[2-[4-(1H-пиразол-1-ил)фенил]этил]-2-тиофенкарбоксамид (регистрационный номер CAS 1133718-61-2), 2-метил-N-[2-[4-(1H-пиразол-1-ил)фенил]этил]бензамид (регистрационный номер CAS 1015521-08-0), 2-йод-N-[2-[4-(1H-пиразол-1-ил)фенил]

этил]бензамид (регистрационный номер CAS 1011617-47-2), 2-фтор-N-[2-[4-(1H-пиразол-1-ил)фенил]этил]бензамид (регистрационный номер CAS 1011617-27-8), 2-хлор-N-[2-[4-(1H-пиразол-1-ил)фенил]этил]бензамид (регистрационный номер CAS 1008348-80-8), 5-хлор-1,3-диметил-N-[2-[4-(2-метил-4-тиазолил)фенил]этил]-1H-пиразол-4-карбоксамид (регистрационный номер CAS 1295481-75-2), 2-метил-N-[2-[4-(2-метил-4-тиазолил)фенил]этил]бензамид (регистрационный номер CAS 1030712-80-1), 2-метил-N-[2-[4-(2-метил-4-тиазолил)фенил]этил]-3-фуранкарбоксамид (регистрационный номер CAS 1010219-61-0), 2-фтор-N-[2-[4-(2-метил-4-тиазолил)фенил]этил]бензамид (регистрационный номер CAS 927077-70-1), 2-бром-N-[2-[4-(2-метил-4-тиазолил)фенил]этил]бензамид (регистрационный номер CAS 926832-81-7), 2-йод-N-[2-[4-(2-метил-4-тиазолил)фенил]этил]бензамид (регистрационный номер CAS 926764-00-3), N-[2-[4-(2-метил-4-тиазолил)фенил]этил]-2-(трифторметил)бензамид (регистрационный номер CAS 926763-25-9) и 2-хлор-N-[2-[4-(2-метил-4-тиазолил)фенил]этил]бензамид (регистрационный номер CAS 926716-39-4).

Более конкретно, настоящее изобретение относится к соединению формулы 1 (включая все стереоизомеры), его N-оксиду или соли.

Настоящее изобретение также относится к фунгицидной композиции, содержащей (а) соединение по настоящему изобретению (т.е. в фунгицидно эффективном количестве) и (б) по меньшей мере один дополнительный компонент, выбранный из группы, состоящей из поверхностно-активных веществ, твердых разбавителей и жидких разбавителей.

Настоящее изобретение также относится к фунгицидной композиции, содержащей (а) соединение по настоящему изобретению и (б) по меньшей мере один другой фунгицид (т.е. фунгицид, отличный от соединения формулы 1, его N-оксида или соли) (например, по меньшей мере один другой фунгицид, имеющий другое место приложения действия).

Настоящее изобретение дополнительно относится к способу контроля болезней растений, вызванных патогенными для растений грибами, включающему применение по отношению к растению или его части или к семенам растения фунгицидно эффективного количества соединения по настоящему изобретению (например, в виде композиции, описанной в данном документе).

Вышеописанный способ также может быть описан как способ защиты растения или семян растения от болезней, вызванных патогенными грибами, включающий применение фунгицидно эффективного количества соединения формулы 1, его N-оксида или соли (например, в виде композиции, описанной в данном документе), по отношению к растению (или его части) или семенам растения (непосредственно или через окружающую среду (например, среду для выращивания) растения или семян растения).

Настоящее изобретение также предусматривает способ контроля растительной нематоды, включающий осуществление контакта нематоды или ее среды обитания с нематоцидно эффективным количеством соединения формулы 1, его N-оксида или соли (например, в виде композиции, описанной в данном документе), где

L представляет собой $-C(R^{12a})R^{12b}-C(R^{13a})R^{13b}-$, где атом углерода, связанный с R^{12a} и R^{12b} , также связан с атомом азота карбоксамида в формуле 1;

и A, R^1 , R^2 , R^{12a} , R^{12b} , R^{13a} , R^{13b} , n, G, Q и Z определены в кратком описании настоящего изобретения.

ПОДРОБНОЕ ОПИСАНИЕ ИЗОБРЕТЕНИЯ

Используемые в настоящем документе выражения “содержит”, “содержащий”, “включает”, “включающий”, “имеет”, “имеющий”, “вмещает”, “вмещающий”,

“характеризующийся тем, что” или любые другие их вариации распространяются на неисключительное включение, если явно не указано какое-либо ограничение. Например, композиция, смесь, процесс, способ, изделие или прибор, которые содержат перечень элементов, не обязательно ограничиваются только этими элементами, но могут включать
5 другие элементы, которые не перечислены явно или присущи такой композиции, смеси, процессу, способу, изделию или прибору.

Переходная фраза “состоящий из” исключает любой неуказанный элемент, стадию или ингредиент. При наличии в пункте формулы изобретения такая фраза будет закрывать пункт формулы изобретения для включения материалов, отличных от тех,
10 которые перечислены, за исключением примесей, обычно связанных с ними. Если фраза “состоящий из” появляется в отличительной части пункта формулы, а не сразу после ограничительной части, она ограничивает только элемент, изложенный в той отличительной части; при этом другие элементы в целом не исключаются из пункта формулы изобретения.

Переходная фраза “практически состоящий из” применяется для обозначения композиции, способа или прибора, что включает материалы, стадии, признаки, компоненты или элементы, в дополнение к буквально раскрываемым, при условии, что эти дополнительные материалы, стадии, признаки, компоненты или элементы существенно не влияют на основную и новую характеристику(и) заявляемого
15 изобретения. Выражение “практически состоящий из” занимает среднюю позицию между “содержащий” и “состоящий из”.

Если заявители определили объем изобретения или его части таким неограничивающим выражением, как “содержащий”, явно следует понимать, что (если не указано иное) описание следует толковать как также описывающее такое изобретение
25 с применением выражений “практически состоящий из” или “состоящий из”.

Кроме того, если прямо не указано обратное, “или” относится к включающему “или”, а не к исключаящему “или”. Например, условие А или В выполняется любым из следующих условий: А истинно (или присутствует), а В ошибочно (или не присутствует), А ошибочно (или не присутствует), а В истинно (или присутствует), и А и В истинно
30 (или присутствуют).

Также подразумевается, что единственное число элемента или компонента настоящего изобретения является неограничивающим в отношении числа случаев присутствия (т.е. встречаемости) элемента или компонента. Поэтому единственное число следует понимать как включающее нечто одно или по меньшей мере одно, а единственное число
35 для обозначения элемента или компонента также включает множественное число, исключая случаи, когда явно подразумевается единственное число.

Как изложено в настоящем раскрытии и формуле изобретения, “растение” включает членов царства Растения, в частности, семенные растения (Spermatopsida), на всех жизненных стадиях, включая молодые растения (например, прорастающие семена, развивающиеся в проростки) и зрелые, репродуктивные стадии (например, растения, образующие цветки и семена). Части растений включают органы, обладающие геотропизмом, обычно растущие под поверхностью среды для выращивания (например, почвы), такие как корни, клубни, луковичы и клубнелуковичы, а также органы, растущие над средой для выращивания, такие как листва (включая стебли и листья), цветы, плоды
45 и семена.

Как изложено в данном документе, выражение “проросток”, применяемое или отдельно, или в комбинации слов, означает молодое растение, развивающееся из зародыша семени.

Как изложено в настоящем раскрытии, выражения “патогенный гриб” и “патогенный для растений гриб” включают патогены из классов базидиомицетов, аскомицетов, оомицетов и дейтеромицетов, которые являются возбудителями широкого спектра болезней растений, имеющих экономическое значение, поражающих декоративные, дернообразующие, овощные, полевые, зерновые и плодовые сельскохозяйственные культуры. В контексте настоящего раскрытия “защита растения от болезни” или “контроль болезни растения” включает предупредительное действие (нарушение цикла инфицирования, колонизации, развития симптомов и образования спор гриба) и/или лечебное действие (подавление колонизации тканей растения-хозяина).

В контексте настоящего раскрытия “контроль нематод” означает подавление развития нематод-вредителей (включая гибель, уменьшение питания и/или нарушение спаривания), и связанные с этим выражения определяются аналогично. Контроль болезни растения относится к защите растений путем предупреждения и/или лечения от болезней, вызываемых патогенами.

В перечисленных выше пояснениях выражение “алкил”, применяемое либо отдельно, либо в сложных словах, таких как “галогеналкил”, включает алкил с неразветвленной или разветвленной цепью, такой как метил, этил, н-пропил или изопропил. “Алкандиил”, также известный как алкилен, включает двухвалентные радикалы алканов с неразветвленной или разветвленной цепью, которые в случае R^{12a} и R^{12b} или R^{13a} и R^{13b} , взятые вместе, связаны посредством разных атомов углерода с остальной частью молекулы. Примеры “алкандиила” включают $-CH_2CH_2-$, $-CH_2CH_2CH_2-$, $-CH_2CH(CH_3)-$ и различные изомеры бутандиила.

“Алкокси” включает, например, метокси, этокси, н-пропилокси и изопропилокси. “Алкоксиамино” включает метоксиамин и этоксиамин. “Алкилтио” включает метилтио и этилтио.

Выражение “галоген”, либо отдельно, либо в сложных словах, таких как “галогеналкил”, или при использовании в описаниях, таких как “алкил, замещенный галогеном”, включает фтор, хлор, бром или йод. Кроме того, при использовании в сложных словах, таких как “галогеналкил”, или при использовании в описаниях, таких как “алкил, замещенный галогеном”, указанный алкил может быть частично или полностью замещен атомами галогена, которые могут быть одинаковыми или разными. Примеры “галогеналкила” или “алкила, замещенного галогеном” включают F_3C- , $ClCH_2-$, CF_3CH_2- и CF_3CCl_2- . Выражение “галогеналкокси” определено аналогично выражению “галогеналкил”. Примеры “галогеналкокси” включают CF_3O- , CCl_3CH_2O- , $HCF_2CH_2CH_2O-$ и CF_3CH_2O- .

“Алкилкарбонил” означает фрагменты алкила с неразветвленной или разветвленной цепью, связанные с фрагментом $C(=O)$. Примеры “алкилкарбонила” включают $CH_3C(=O)-$, $CH_3CH_2CH_2C(=O)-$ и $(CH_3)_2CHC(=O)-$. Примеры “алкоксикарбонила” включают $CH_3OC(=O)-$ и $CH_3CH_2OC(=O)-$.

Общее число атомов углерода в группе заместителя обозначают приставкой “Ci-Cj”, в которой i и j являются числами от 1 до 4. Например, C₁-C₃алкокси обозначает CH_3O- , CH_3CH_2O- , $CH_3CH_2CH_2O$ и $(CH_3)_2CHO-$.

Используемые в данном документе следующие определения применяются, если не указано иное. Выражение “необязательно замещенный” используется взаимозаменяемо с фразой “замещенный или незамещенный”. Если не указано другое, необязательно замещенная группа может иметь заместитель в каждом замещаемом положении группы,

и каждое замещение не зависит от другого.

Если соединение замещено заместителем, содержащим индекс, который указывает на то, что число указанных заместителей может превышать 1, указанные заместители (если их число превышает 1) независимо выбраны из группы определенных заместителей,

например, $(R^2)_n$, где n равняется 0, 1, 2, 3 или 4. Если группа содержит заместитель,

которым может быть водород, например R^{2a} , то если этот заместитель представляет собой водород, это понимают как равнозначное тому, что указанная группа является незамещенной. Если переменная группа, как показано, необязательно присоединена в положении, например, $(R^2)_n$, где n может равняться 0, то водород может находиться в данном положении, даже если не указан в определении переменной группы. Если одно или несколько положений в группе указаны как “без заместителей” или “незамещенные”, то атомы водорода присоединены с насыщением любой свободной валентности.

Как упоминается в настоящем раскрытии и формуле изобретения, “ненасыщенное гетероциклическое кольцо” представляет собой гетероциклическое кольцо, где по меньшей мере два атома-члена кольца связаны между собой двойной связью. Если не указано иное, “ненасыщенное гетероциклическое кольцо” (например, заместитель Q) может быть частично ненасыщенным или полностью ненасыщенным. Выражение “полностью ненасыщенное гетероциклическое кольцо” означает гетероциклическое кольцо из атомов, в котором связи между атомами углерода и/или атомами азота в кольце являются одинарными или двойными связями в соответствии с теорией валентных связей и, кроме того, связи между атомами углерода и/или атомами азота в кольце включают наибольшее возможное число двойных связей, при этом двойные связи не должны быть кумулированными (т.е. без $C=C=C$, $N=C=C$ и т.д.). Выражение “частично ненасыщенное гетероциклическое кольцо” обозначает гетероциклическое кольцо, содержащее по меньшей мере один член кольца, связанный со смежным членом кольца посредством двойной связи, и которое теоретически может содержать число некумулятивных двойных связей между смежными членами кольца (т.е. в своей полностью ненасыщенной соответствующей форме), большее, чем число присутствующих двойных связей (т.е. в своей частично ненасыщенной форме). Если полностью ненасыщенное гетероциклическое кольцо удовлетворяет правилу Хюккеля, то указанное кольцо также называют “гетероароматическим кольцом” или “ароматическим гетероциклическим кольцом”.

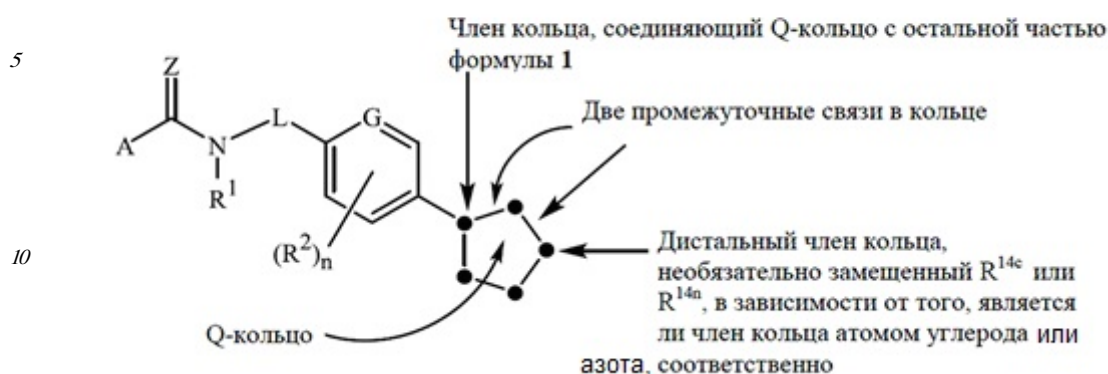
В кратком описании настоящего изобретения ненасыщенное гетероциклическое кольцо Q, как указано, является 5-членным, причем члены кольца выбраны из атомов углерода и до 4 гетероатомов, независимо выбранных из до 1 атома O, до 1 атома S и до 4 атомов N, где до 2 атомов углерода независимо выбраны из $C(=O)$.

Гетероциклическое кольцо необязательно замещено одним заместителем, выбранным из R^{14c} или R^{14n} , при одном члене кольца, удаленном относительно члена кольца, соединяющего гетероароматическое кольцо с остальной частью формулы 1. Как изображено в приложении 1, в пятичленном гетероциклическом кольце Q член кольца, удаленный относительно члена кольца, соединяющего кольцо с остальной частью формулы 1, связан через две связи в кольце с соединяющим членом кольца.

Гетероциклическое кольцо Q дополнительно необязательно замещено заместителями, выбранными из R^{15c} при членах кольца, представляющих собой атом углерода, и R^{15n} при членах кольца, представляющих собой атом азота.

Приложение 1

Необязательное R^{14c} или R^{14n} замещение на Q-кольце формулы 1



15 Определенные гетероциклы, образующие Q, могут содержать два расположенных удаленно члена кольца, доступных для замещения. В этой ситуации только один из расположенных удаленно членов кольца может быть замещен R^{14c} или R^{14n} ; другой расположенный удаленно член кольца может быть замещен R^{15c} или R^{15n} . Если ни один из расположенных удаленно членов кольца в гетероцикле, образующем Q, не доступен

20 для замещения, то любые заместители в гетероцикле выбраны из R^{15c} или R^{15n} . Если расположенный удаленно член кольца может содержать два заместителя, один заместитель может быть выбран из R^{14c} или R^{14n} , а другой заместитель может быть выбран из R^{15c} или R^{15n} . Другими словами, кольцо Q ограничено одним заместителем,

25 R^{14c} или R^{14n} , и этот заместитель должен быть связан с расположенным удаленно членом кольца; в ином случае кольцо Q может быть замещено R^{15c} или R^{15n} при любом доступном члене кольца.

30 Если точка присоединения в группе (например, кольцо) изображена как нефиксированная (например, как показано на 5-членных ненасыщенных гетероциклических кольцах от Q-1 до Q-21 в приложении 3), то группа может быть присоединена к остальной части формулы 1 посредством любого доступного атома углерода или атома азота группы путем замены атома водорода. Если точка

35 присоединения заместителя в группе (например, кольцо) изображена как нефиксированная (например, как показано для R^{14} и R^{15} в 5-членных ненасыщенных гетероциклических кольцах от Q-1 до Q-21 в приложении 3), то заместитель может быть присоединен к любому доступному атому углерода или атому азота путем замены атома водорода.

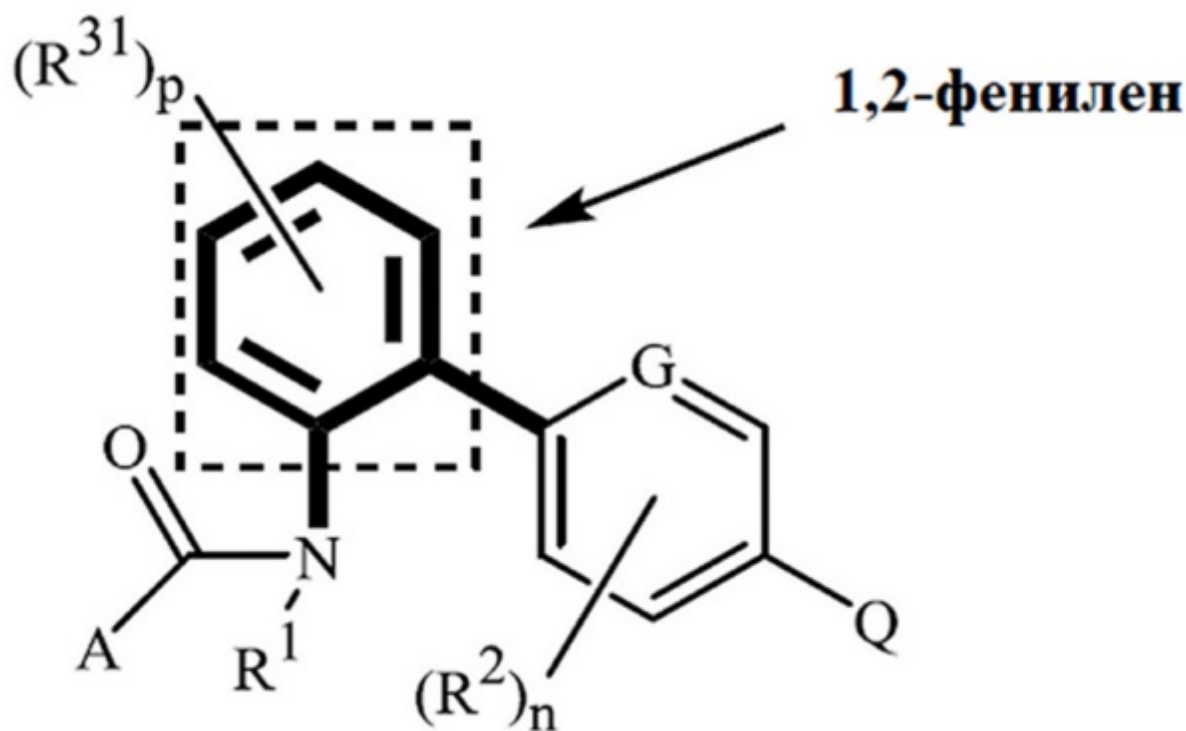
40 В уровне техники известен широкий ряд способов синтеза для обеспечения получения ароматических и неароматических гетероциклических колец и кольцевых систем; для углубленного обзора см. восьмой том издания Comprehensive Heterocyclic Chemistry, A.R. Katritzky and C.W. Rees editors-in-chief, Pergamon Press, Oxford, 1984, и двенадцатый том издания Comprehensive Heterocyclic Chemistry II, A.R. Katritzky, C.W. Rees and E.F.V. Scriven editors-in-chief, Pergamon Press, Oxford, 1996.

45 Как указано в кратком описании настоящего изобретения и в других разделах настоящего раскрытия, связывающая группа L в формуле 1 может представлять собой $-C(R^{12a})R^{12b}-C(R^{13a})R^{13b}-$, где атом углерода, связанный с R^{12a} и R^{12b} , также связан с атомом азота карбоксамида в формуле 1. В этом случае карбоксамид представляет

собой обычный карбоксамид, если Z представляет собой O, или тиокарбоксамид, если Z представляет собой S. Специалисту в данной области техники будет понятно, что расположение скобок в “-C(R^{12a})R^{12b}-C(R^{13a})R^{13b}-” носит стилистический характер, и альтернативные варианты, такие как “-C(R^{12a})(R^{12b})-C(R^{13a})(R^{13b})-”, “-CR^{12a}R^{12b}-CR^{13a}R^{13b}-” и их вариации, обозначают один и тот же молекулярный компонент.

Также, как указано в кратком описании настоящего изобретения и в других разделах настоящего раскрытия, связывающая группа L в формуле 1 может представлять собой 1,2-фенилен, необязательно имеющий до 4 заместителей, независимо выбранных из галогена и C₁-C₂алкила. Как показано в приложении 1a, “1,2-фенилен”, как понимают, относится к бензольному кольцу, соединенному с остальной частью молекулы (например, формула 1) в орто-положениях (откуда следует “1,2-”) и необязательно замещенному галогеном и C₁-C₂алкилом (т.е. “R³¹”) по четырем оставшимся положениям в кольце.

Приложение 1a



где каждый R³¹ независимо представляет собой галоген или C₁-C₂алкил, а p равняется 0, 1, 2, 3 или 4.

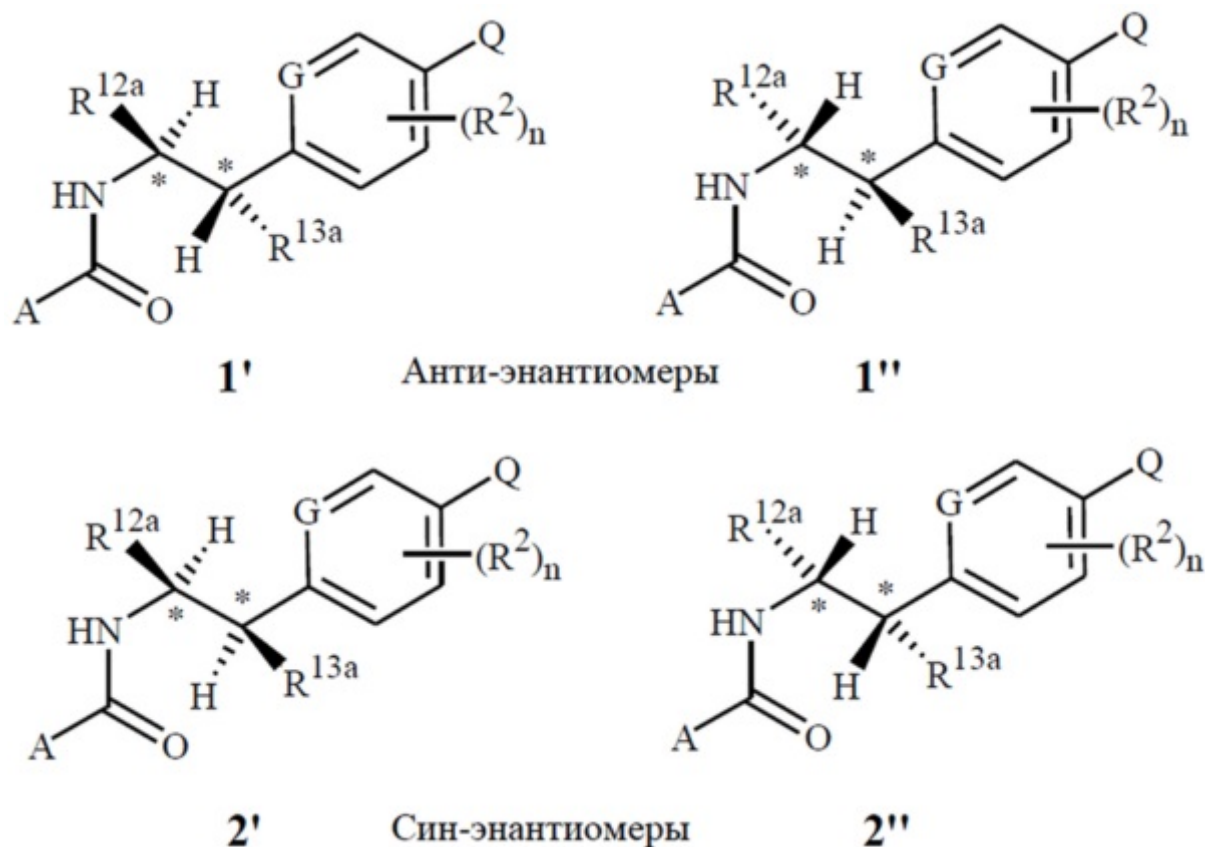
Связывающая группа L, представляющая собой необязательно замещенный 1,2-фенилен, дополнительно проиллюстрирована формулой 1d на схемах 16 и 18 и описаниями молекулярной структуры, прилагающимися к таблицам 1-2304 и 6338 и таблицам индексов 4, 5 и 6.

Выражение “1,2-фенилен” в случае, когда оно относится к настоящему изобретению, может быть альтернативно описано как “1,2-дифенилен”, где отрывок “ди” относится к 1,2-ди-замещению кольца, соединяющего его с остальной частью молекулы (формула 1). Хотя в настоящем раскрытии разъясняется подразумеваемое значение, отрывок “ди” может в ином случае трактоваться как относящийся к числу фенильных колец, и, следовательно, именно выражение “1,2-фенилен” используется во всем настоящем

раскрытии и формуле изобретения.

Соединения по настоящему изобретению могут существовать в виде одного или нескольких стереоизомеров. Различные стереоизомеры включают энантимеры, диастереомеры, атропоизомеры и геометрические изомеры. Специалист в данной области техники поймет, что один стереоизомер может быть более активным и/или может проявлять положительные эффекты при обогащении им по сравнению с другим стереоизомером(ами) или при отделении от другого стереоизомера(ов). Кроме того, специалист в данной области техники знает как отделять, обогащать и/или избирательно получать указанные стереоизомеры. Соединения по настоящему изобретению могут присутствовать в виде смеси стереоизомеров, отдельных стереоизомеров или в виде оптически активной формы. Например, если R^{12b} и R^{13b} оба представляют собой H, а R^{12a} и R^{13a} являются отличными от H, то формула 1 имеет хиральные центры при атомах углерода, с которыми R^{12b} и R^{13b} связаны, что обеспечивает возможность существования двух рацемических диастереомеров, обозначаемых как анти и син. Каждый рацемический диастереомер состоит из пары энантимеров, т.е. анти-диастереомер состоит из энантимеров 1' и 1'', а син-диастереомер состоит из энантимеров 2' и 2'', как показано ниже в приложении 2, при этом хиральные центры обозначены звездочкой (*).

Приложение 2



Рисунки молекул, изображенные в данном документе, созданы с соблюдением стандартных правил создания изображений в стереохимии. Для того чтобы показать стереоконфигурацию, связи, направленные вверх от плоскости рисунка и к наблюдателю, изображены в виде сплошных клиньев, причем широкие концы клиньев соединены с атомом, расположенным над плоскостью рисунка по направлению к наблюдателю. Связи, находящиеся ниже плоскости рисунка и направленные от наблюдателя, изображены пунктирными клиньями, причем узкий конец клина соединен с атомом,

находящимся в отдалении от наблюдателя. Линии постоянной толщины показывают связи, противоположно или нейтрально направленные по отношению к связям, показанным в виде сплошных или пунктирных клиньев; линии постоянной толщины также показывают связи в молекулах или частях молекул, в которых не указана конкретная стереоконфигурация.

Настоящее изобретение включает рацемические смеси, например, равные количества энантиомеров формул 1' и 1". Кроме того, настоящее изобретение включает соединения, обогащенные по сравнению с рацемической смесью энантиомером формулы 1. Также включены практически чистые энантиомеры соединений формулы 1, например, формулы 1' или формулы 1".

После обогащения энантиомеров один энантиомер присутствует в большем количестве, чем другой, и степень обогащения может быть определена энантиомерным избытком ("ее"), который определяют как $(2x-1) \cdot 100\%$, где x является мольной долей преобладающего энантиомера в смеси (например, ее 20% соответствует соотношению энантиомеров 60:40).

Предпочтительно, композиции по настоящему изобретению характеризуются энантиомерным избытком более активного изомера, составляющим по меньшей мере 50%; более предпочтительно энантиомерным избытком, составляющим по меньшей мере 75%; еще более предпочтительно энантиомерным избытком, составляющим по меньшей мере 90%; и наиболее предпочтительно энантиомерным избытком, составляющим по меньшей мере 94%. Особый интерес представляют энантиомерно чистые варианты осуществления более активного изомера.

Соединения формулы 1 могут содержать дополнительные хиральные центры.

Например, заместители и другие составляющие молекулы, такие как R^2 , могут сами по себе содержать хиральные центры. Настоящее изобретение включает рацемические смеси, а также обогащенные и практически чистые стереоконфигурации по данным дополнительным хиральным центрам.

Соединения по настоящему изобретению могут существовать в виде одного или нескольких конформационных изомеров в связи с ограниченным вращением вокруг амидной связи (например, C(O)-N) в формуле 1. Настоящее изобретение относится к смесям конформационных изомеров. К тому же, настоящее изобретение относится к соединениям, которые обогащены одним конформером по сравнению с другими.

Специалисту в данной области будет понятно, что не все содержащие азот гетероциклы могут образовывать N-оксиды, поскольку азоту нужна доступная неподеленная пара для окисления до оксида; специалисту в данной области будут известны такие содержащие азот гетероциклы, которые могут образовывать N-оксиды. Способы синтеза для получения N-оксидов гетероциклов хорошо известны специалистам в данной области техники, в том числе окисление гетероциклов и третичных аминов перекислотами, такими как перуксусная и мета-хлорпербензойная кислота (MCPBA), перекисью водорода, гидроперекисями алкилов, такими как гидроперекись трет-бутила, перборатом натрия и диоксиранами, такими как диметилдиоксиран. Такие способы получения N-оксидов были подробно описаны и рассмотрены в литературе, см., например: T.L. Gilchrist в *Comprehensive Organic Synthesis*, vol. 7, pp 748-750, S.V. Ley, Ed., Pergamon Press; M. Tisler and B. Stanovnik в *Comprehensive Heterocyclic Chemistry*, vol. 3, pp 18-20, A.J. Boulton and A. McKillop, Eds., Pergamon Press; M.R. Grimmett and B.R.T. Keene в *Advances in Heterocyclic Chemistry*, vol. 43, pp 149-161, A.R. Katritzky, Ed., Academic Press; M. Tisler and B. Stanovnik в *Advances in Heterocyclic Chemistry*, vol. 9, pp 285-291, A.R. Katritzky and A.J. Boulton, Eds., Academic Press; и G.W.H. Cheeseman and E.S.G. Werstiuk в

Advances in Heterocyclic Chemistry, vol. 22, pp 390-392, A.R. Katritzky and A.J. Boulton, Eds., Academic Press.

Специалисту в данной области техники известно, что поскольку в окружающей среде и в физиологических условиях соли химических соединений находятся в равновесии с их соответствующими несолевыми формами, то соли обладают такой же биологической применимостью, что и несолевые формы. Таким образом, широкий спектр солей соединений формулы 1 можно применять для контроля болезней растений, вызванных патогенными для растений грибами (т.е. являются подходящими с точки зрения сельского хозяйства). Соли соединений формулы 1 включают соли присоединения кислоты с неорганическими или органическими кислотами, такими как бромистоводородная, соляная, азотная, фосфорная, серная, уксусная, масляная, фумаровая, молочная, малеиновая, малоновая, щавелевая, пропионовая, салициловая, винная, 4-толуолсульфоновая или валериановая кислоты. Если соединение формулы 1 содержит кислотный фрагмент, такой как карбоновая кислота или фенол, соли также включают в себя образованные органическими или неорганическими основаниями, такими как пиридин, триэтиламин или аммиак, или амиды, гидриды, гидроксиды или карбонаты натрия, калия, лития, кальция, магния или бария. Соответственно, настоящее изобретение включает соединения, выбранные из формулы 1, ее N-оксидов и подходящих с точки зрения сельского хозяйства солей.

Соединения, выбранные из формулы 1, его стереоизомеры, таутомеры, N-оксиды и соли, как правило, существуют более чем в одной форме, и формула 1, таким образом, включает все кристаллические и некристаллические формы соединений, которые представляет формула 1. Некристаллические формы включают варианты осуществления, которые представляют собой твердые вещества, такие как воск и смолы, а также варианты осуществления, которые представляют собой жидкости, такие как растворы и расплавы. Кристаллические формы включают варианты осуществления, которые представляют собой практически отдельный кристаллический тип, и варианты осуществления, которые представляют собой смесь полиморфов (т.е. различных кристаллических типов). Выражение “полиморф” относится к определенной кристаллической форме химического соединения, которое может кристаллизоваться в различные кристаллические формы, причем данные формы имеют разные расположения и/или конформации молекул в кристаллической решетке. Хотя полиморфы могут иметь одинаковый химический состав, они также могут отличаться по составу в связи с присутствием или отсутствием совместно кристаллизованной воды или других молекул, которые могут быть слабо или сильно связаны в решетке. Полиморфы могут отличаться по таким химическим, физическим и биологическим свойствам, как форма кристалла, плотность, жесткость, цвет, химическая стабильность, точка плавления, гигроскопичность, суспендируемость, скорость растворения и биологическая доступность. Специалисту в данной области будет понятно, что полиморф соединения, представленного формулой 1, может проявлять положительные эффекты (например, возможность применения для получения полезных составов, улучшенная биологическая эффективность) по сравнению с другим полиморфом или смесью полиморфов того же соединения, представленного формулой 1. Получение и выделение конкретного полиморфа соединения, представленного формулой 1, может быть достигнуто способами, известными специалистам в данной области техники, включая, например, кристаллизацию с использованием выбранных растворителей и температур.

Варианты осуществления настоящего изобретения, описанные в кратком описании настоящего изобретения, включают следующие (где формула 1, используемая в

следующих вариантах осуществления, включает ее N-оксиды и соли).

Вариант осуществления 1. Соединение формулы 1, где А представляет собой А-1, А-2, А-3, А-4, А-5, А-6 или А-7.

Вариант осуществления 1a. Соединение формулы 1, где А представляет собой А-1, А-2, А-3, А-4, А-5 или А-6.

Вариант осуществления 1b. Соединение формулы 1, где А представляет собой А-1, А-2, А-3 или А-4.

Вариант осуществления 1c. Соединение формулы 1, где А представляет собой А-1, А-2 или А-4.

Вариант осуществления 2. Соединение формулы 1, где А представляет собой А-1 или А-2.

Вариант осуществления 3. Соединение формулы 1, где А представляет собой А-1.

Вариант осуществления 4. Соединение формулы 1, где А представляет собой А-2.

Вариант осуществления 5. Соединение формулы 1, где А представляет собой А-3.

Вариант осуществления 6. Соединение формулы 1, где А представляет собой А-4.

Вариант осуществления 7. Соединение формулы 1, где А представляет собой А-5.

Вариант осуществления 8. Соединение формулы 1, где А представляет собой А-6.

Вариант осуществления 8a. Соединение формулы 1, где А представляет собой А-7.

Вариант осуществления 8b. Соединение формулы 1, где А представляет собой А-8.

Вариант осуществления 9. Соединение формулы 1 или согласно любому из вариантов осуществления 1-3, где B^1 представляет собой СН.

Вариант осуществления 10. Соединение формулы 1 или согласно любому из вариантов осуществления 1-3, где B^1 представляет собой N.

Вариант осуществления 11. Соединение формулы 1 или согласно любому из вариантов осуществления 1-3 или 9 и 10, где B^2 представляет собой СН.

Вариант осуществления 12. Соединение формулы 1 или согласно любому из вариантов осуществления 1-3 или 9 и 10, где B^2 представляет собой N.

Вариант осуществления 13. Соединение формулы 1 или согласно любому из вариантов осуществления 1-3 или 9-12, где R^3 представляет собой галоген, C_1 - C_2 алкил или C_1 - C_2 галогеналкил.

Вариант осуществления 14. Соединение согласно варианту осуществления 13, где R^3 представляет собой галоген, CH_3 или C_1 галогеналкил.

Вариант осуществления 15. Соединение согласно варианту осуществления 14, где R^3 представляет собой F, Cl, Br, CH_3 , CHF_2 или CF_3 .

Вариант осуществления 15a. Соединение согласно варианту осуществления 15, где R^3 представляет собой F, Cl, Br, CH_3 или CF_3 .

Вариант осуществления 15b. Соединение согласно варианту осуществления 15, где R^3 представляет собой Cl, Br, CH_3 , CHF_2 или CF_3 .

Вариант осуществления 15c. Соединение согласно варианту осуществления 15a или 15b, где R^3 представляет собой Cl, Br, CH_3 или CF_3 .

Вариант осуществления 16. Соединение формулы 1 или согласно любому из вариантов осуществления 1, 1a, 1b, 1c, 2, 4 или 9-15c, где R^4 представляет собой галоген, C_1 - C_2 алкил или C_1 - C_2 галогеналкил.

Вариант осуществления 17. Соединение согласно варианту осуществления 16, где R^4 представляет собой галоген, CH_3 или C_1 галогеналкил.

Вариант осуществления 18. Соединение согласно варианту осуществления 17, где R^4 представляет собой F, Cl, Br, CH_3 , CHF_2 или CF_3 .

Вариант осуществления 19. Соединение формулы 1 или согласно любому из вариантов осуществления 1, 1a, 1b, 1c, 2, 4 или 9-18, где R^5 представляет собой H, галоген, C_1 - C_2 алкил или C_1 - C_2 галогеналкил.

Вариант осуществления 20. Соединение согласно варианту осуществления 16, где R^5 представляет собой H, галоген, CH_3 или C_1 галогеналкил.

Вариант осуществления 21. Соединение согласно варианту осуществления 17, где R^5 представляет собой H, F, Cl, Br, CH_3 , CHF_2 или CF_3 .

Вариант осуществления 22. Соединение формулы 1 или согласно любому из вариантов осуществления 1, 1a, 1b, 1c, 2, 4 или 9-21, где R^6 представляет собой CH_3 .

Вариант осуществления 23. Соединение формулы 1 или согласно любому из вариантов осуществления 1, 1a, 1b, 5 или 9-22, где R^7 представляет собой галоген, C_1 - C_2 алкил или C_1 - C_2 галогеналкил.

Вариант осуществления 24. Соединение согласно варианту осуществления 23, где R^7 представляет собой галоген, CH_3 или C_1 галогеналкил.

Вариант осуществления 25. Соединение согласно варианту осуществления 24, где R^7 представляет собой F, Cl, Br, CH_3 , CHF_2 или CF_3 .

Вариант осуществления 26. Соединение формулы 1 или согласно любому из вариантов осуществления 1, 1a, 1b, 5 или 9-25, где R^8 представляет собой H или CH_3 .

Вариант осуществления 27. Соединение формулы 1 или согласно любому из вариантов осуществления 1, 1a, 1b, 1c, 6 или 9-26, где R^9 представляет собой галоген, C_1 - C_2 алкил или C_1 - C_2 галогеналкил.

Вариант осуществления 28. Соединение согласно варианту осуществления 27, где R^9 представляет собой галоген, CH_3 или C_1 галогеналкил.

Вариант осуществления 29. Соединение согласно варианту осуществления 28, где R^9 представляет собой F, Cl, Br, CHF_2 или CF_3 .

Вариант осуществления 30. Соединение формулы 1 или согласно любому из вариантов осуществления 1, 1a, 7 или 9-29, где R^{10} представляет собой галоген, C_1 - C_2 алкил или C_1 - C_2 галогеналкил.

Вариант осуществления 31. Соединение согласно варианту осуществления 30, где R^{10} представляет собой галоген, CH_3 или C_1 галогеналкил.

Вариант осуществления 32. Соединение согласно варианту осуществления 31, где R^{10} представляет собой F, Cl, Br, CH_3 , CHF_2 или CF_3 .

Вариант осуществления 33. Соединение формулы 1 или согласно любому из вариантов осуществления 1, 1a или 8-32, где R^{11} представляет собой галоген, C_1 - C_2 алкил или

C₁-C₂галогеналкил.

Вариант осуществления 34. Соединение согласно варианту осуществления 33, где R¹¹ представляет собой галоген, CH₃ или C₁галогеналкил.

Вариант осуществления 35. Соединение согласно варианту осуществления 34, где R¹¹ представляет собой F, Cl, Br, CH₃, CHF₂ или CF₃.

Вариант осуществления 35a. Соединение формулы 1 или согласно варианту осуществления 1 или 8a, где R²⁰ представляет собой галоген, C₁-C₂алкил или C₁-C₂галогеналкил.

Вариант осуществления 35b. Соединение согласно варианту осуществления 35a, где R²⁰ представляет собой галоген, CH₃ или C₁галогеналкил.

Вариант осуществления 35c. Соединение согласно варианту осуществления 35b, где R²⁰ представляет собой F, Cl, Br, CH₃, CHF₂ или CF₃.

Вариант осуществления 35d. Соединение формулы 1 или согласно варианту осуществления 8b, где R²¹ представляет собой галоген, C₁-C₂алкил или C₁-C₂галогеналкил.

Вариант осуществления 35e. Соединение согласно варианту осуществления 35d, где R²¹ представляет собой галоген, CH₃ или C₁галогеналкил.

Вариант осуществления 35f. Соединение согласно варианту осуществления 35e, где R²¹ представляет собой F, Cl, Br, CH₃, CHF₂ или CF₃.

Вариант осуществления 35g. Соединение формулы 1 или согласно любому из вариантов осуществления 8b, 35d, 35e или 35f, где R²² представляет собой H или CH₃.

Вариант осуществления 35h. Соединение формулы 1 или согласно любому из вариантов осуществления 1-35g, где соединение является отличным от 3-(дифторметил)-N-[3'-фтор-4'-[3-(трифторметил)-1H-пиразол-1-ил][1,1'-бифенил]-2-ил]-2-пиридинкарбоксамида или 3-(дифторметил)-N-[3',5'-дифтор-4'-[3-трифторметил)-1H-пиразол-1-ил][1,1'-бифенил]-2-ил]-2-пиридинкарбоксамида.

Вариант осуществления 35i. Соединение формулы 1 или согласно любому из вариантов осуществления 1-35h, где если A представляет собой A-1, R³ представляет собой CHF₂, а B¹ представляет собой CH, то B² представляет собой CH.

Вариант осуществления 35j. Соединение формулы 1 или согласно любому из вариантов осуществления 1-35i, где если A представляет собой A-1, а R³ представляет собой CHF₂, то B² представляет собой CH.

Вариант осуществления 36. Соединение формулы 1 или согласно любому из вариантов осуществления 1-35j, где R¹ представляет собой H.

Вариант осуществления 37. Соединение формулы 1 или согласно любому из вариантов осуществления 1-36, где L представляет собой -C(R^{12a})R^{12b}-C(R^{13a})R^{13b}-.

Вариант осуществления 38. Соединение формулы 1 или согласно любому из вариантов осуществления 1-37, где каждый из R^{12a} и R^{12b} независимо представляет собой H, C₁-C₂алкил или C₁-C₂галогеналкил.

Вариант осуществления 38a. Соединение формулы 1 или согласно любому из

вариантов осуществления 1-38, где R^{13a} представляет собой H, галоген, C_1 - C_2 алкил, C_1 - C_2 галогеналкил; C_1 - C_2 алкокси или C_1 - C_2 галогеналкокси; а R^{13b} представляет собой H, галоген, C_1 - C_2 алкил или C_1 - C_2 галогеналкил.

5 Вариант осуществления 38b. Соединение формулы 1 или согласно любому из вариантов осуществления 1-38a, где R^{12a} представляет собой H или CH_3 .

Вариант осуществления 39. Соединение согласно варианту осуществления 38b, где R^{12a} представляет собой H.

10 Вариант осуществления 40. Соединение формулы 1 или согласно любому из вариантов осуществления 1-39, где R^{12b} представляет собой H или CH_3 .

Вариант осуществления 41. Соединение согласно варианту осуществления 40, где R^{12b} представляет собой H.

15 Вариант осуществления 42. Соединение формулы 1 или согласно любому из вариантов осуществления 1-41, где R^{13a} представляет собой H, CH_3 или OCH_3 .

Вариант осуществления 43. Соединение согласно варианту осуществления 42, где R^{13a} представляет собой H или CH_3 .

20 Вариант осуществления 44. Соединение согласно варианту осуществления 43, где R^{13a} представляет собой H.

Вариант осуществления 45. Соединение формулы 1 или согласно любому из вариантов осуществления 1-44, где R^{13b} представляет собой H или CH_3 .

25 Вариант осуществления 46. Соединение согласно варианту осуществления 45, где R^{13b} представляет собой H.

Вариант осуществления 47. Соединение формулы 1 или согласно любому из вариантов осуществления 1-36, где если L включает 1,2-фенилен, указанный 1,2-фенилен необязательно имеет до 2 заместителей, независимо выбранных из F, Cl, Br и CH_3 .

30 Вариант осуществления 48. Соединение согласно варианту осуществления 47, где если L включает 1,2-фенилен, указанный 1,2-фенилен необязательно имеет до 2 заместителей, независимо выбранных из F и CH_3 .

Вариант осуществления 49. Соединение согласно варианту осуществления 48, где если L включает 1,2-фенилен, указанный 1,2-фенилен является незамещенным (за исключением связей с остальной частью формулы 1).

Вариант осуществления 50. Соединение формулы 1 или согласно любому из вариантов осуществления 1-36 или 47-49, где L включает 1,2-фенилен.

40 Вариант осуществления 51. Соединение формулы 1 или согласно любому из вариантов осуществления 1-50, где G представляет собой $C-R^{2a}$.

Вариант осуществления 52. Соединение формулы 1 или согласно любому из вариантов осуществления 1-51, где R^{2a} представляет собой H, галоген, нитро, C_1 - C_2 алкил, C_1 - C_2 галогеналкил, C_1 - C_2 алкокси или C_1 - C_2 галогеналкокси.

45 Вариант осуществления 52a. Соединение согласно варианту осуществления 52, где R^{2a} представляет собой H, галоген, C_1 - C_2 алкил, C_1 - C_2 галогеналкил, C_1 - C_2 алкокси или C_1 - C_2 галогеналкокси.

Вариант осуществления 52b. Соединение согласно варианту осуществления 52a, где R^{2a} представляет собой H, галоген, C_1 - C_2 алкил или C_1 - C_2 галогеналкил.

Вариант осуществления 52с. Соединение согласно варианту осуществления 52b, где R^{2a} представляет собой H, F, Cl, Br или CH_3 .

Вариант осуществления 53. Соединение согласно варианту осуществления 52с, где R^{2a} представляет собой H, F или Cl.

Вариант осуществления 54. Соединение согласно варианту осуществления 53, где R^{2a} представляет собой H.

Вариант осуществления 55. Соединение согласно варианту осуществления 53, где R^{2a} представляет собой F или Cl.

Вариант осуществления 56. Соединение согласно варианту осуществления 55, где R^{2a} представляет собой F.

Вариант осуществления 57. Соединение согласно варианту осуществления 55, где R^{2a} представляет собой Cl.

Вариант осуществления 58. Соединение формулы 1 или согласно любому из вариантов осуществления 1-50, где G представляет собой N.

Вариант осуществления 59. Соединение формулы 1 или согласно любому из вариантов осуществления 1-58, где каждый R^2 независимо представляет собой галоген, нитро, C_1 - C_2 алкил, C_1 - C_2 галогеналкил, C_1 - C_2 алкокси или C_1 - C_2 галогеналкокси.

Вариант осуществления 59a. Соединение согласно варианту осуществления 59, где каждый R^2 независимо представляет собой галоген, C_1 - C_2 алкил, C_1 - C_2 галогеналкил, C_1 - C_2 алкокси или C_1 - C_2 галогеналкокси.

Вариант осуществления 59b. Соединение формулы 1 или согласно любому из вариантов осуществления 1-58, где каждый R^2 независимо представляет собой галоген, циано, C_1 - C_2 алкил или C_1 - C_2 галогеналкил.

Вариант осуществления 59с. Соединение согласно варианту осуществления 59a или 59b, где каждый R^2 независимо представляет собой F, Cl, Br или CH_3 .

Вариант осуществления 60. Соединение согласно варианту осуществления 59с, где каждый R^2 независимо представляет собой F или Cl.

Вариант осуществления 61. Соединение согласно варианту осуществления 60, где каждый R^2 представляет собой F.

Вариант осуществления 62. Соединение согласно варианту осуществления 60, где каждый R^2 представляет собой Cl.

Вариант осуществления 63. Соединение формулы 1 или согласно любому из вариантов осуществления 1-62, где n равняется 0, 1 или 2.

Вариант осуществления 64. Соединение формулы 1 или согласно любому из вариантов осуществления 1-63, в котором, когда G представляет собой N или R^{2a} представляет собой H, кольцо, содержащее G, замещено по меньшей мере одним из вариантов R^2 .

Вариант осуществления 64a. Соединение формулы 1 или согласно любому из вариантов осуществления 1-64, где если (1) L представляет собой $-C(R^{12a})R^{12b}-C(R^{13a})R^{13b}-$, а (2) G представляет собой N или R^{2a} представляет собой H,

то кольцо, содержащее G, замещено R^2 в орто-положении относительно связи с L.

Вариант осуществления 65. Соединение формулы 1 или согласно любому из вариантов осуществления 1-64а, где если L включает 1,2-фенилен, то кольцо, содержащее G,

замещено по меньшей мере одним R^2 в орто-положении относительно связи с Q.

Вариант осуществления 66. Соединение согласно варианту осуществления 65, где если L включает 1,2-фенилен, то кольцо, содержащее G, замещено двумя R^2 в орто-положении относительно связи с Q.

Вариант осуществления 66а. Соединение формулы 1 или согласно любому из вариантов осуществления 1-66, где соединение является отличным от N-[2-[2-циано-4-[3-(трифторметил)-1Н-пиразол-1-ил]фенил]этил]-3-(дифторметил)-1-метил-1Н-пиразол-4-карбоксамида или N-[2-[2-циано-4-[3-(трифторметил)-1Н-пиразол-1-ил]фенил]этил]-3-(трифторметил)-2-пиридинкарбоксамида.

Вариант осуществления 66b. Соединение формулы 1 или согласно любому из вариантов осуществления 1-66а, где если L представляет собой $-C(R^{12a})R^{12b}-C(R^{13a})R^{13b}-$, а кольцо, содержащее G, замещено R^2 или R^{2a} в орто-положении относительно связи с L, то указанный R^2 или R^{2a} является отличным от CN (циано).

Вариант осуществления 66с. Соединение формулы 1 или согласно любому из вариантов осуществления 1-66b, где если кольцо, содержащее G, замещено R^2 или R^{2a} в орто-положении относительно связи с L, то указанный R^2 или R^{2a} является отличным от CN (циано).

Вариант осуществления 67. Соединение формулы 1 или согласно любому из вариантов осуществления 1-66с, где гетероциклическое кольцо Q содержит по меньшей мере один член кольца, представляющий собой атом азота.

Вариант осуществления 68. Соединение согласно варианту осуществления 67, где гетероциклическое кольцо Q содержит два члена кольца, представляющих собой атом азота.

Вариант осуществления 69. Соединение формулы 1 или согласно любому из вариантов осуществления 1-68, где гетероциклическое кольцо Q является полностью ненасыщенным (т.е. является гетероароматическим).

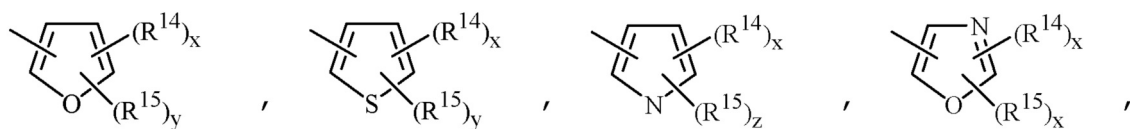
Вариант осуществления 70. Соединение формулы 1 или согласно любому из вариантов осуществления 1-66с, где гетероциклическое кольцо Q выбрано из фурана, тиафена, пиррола, оксазола, тиазола, имидазола, изоксазола, изотиазола, пиразола, 1,2,4-оксадиазола, 1,2,3-оксадиазола, 1,3,4-оксадиазола, 1,2,4-тиадиазола, 1,2,3-тиадиазола, 1,3,4-тиадиазола, 1,2,3-триазола, 1,2,4-триазола, тетразола, 4,5-дигидроизоксазола и 4,5-дигидропиразола.

Вариант осуществления 71. Соединение согласно варианту осуществления 70, где гетероциклическое кольцо Q выбрано из соединений, отличных от 4,5-дигидроизоксазола и 4,5-дигидропиразола.

Вариант осуществления 72. Соединение согласно варианту осуществления 70, где гетероциклическое кольцо Q выбрано из пиразола.

Вариант осуществления 73. Соединение согласно варианту осуществления 70, где Q выбрано из Q-1-Q-21, изображенных в приложении 3.

Приложение 3

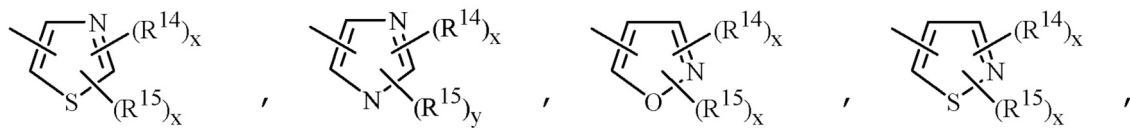


Q-1

Q-2

Q-3

Q-4

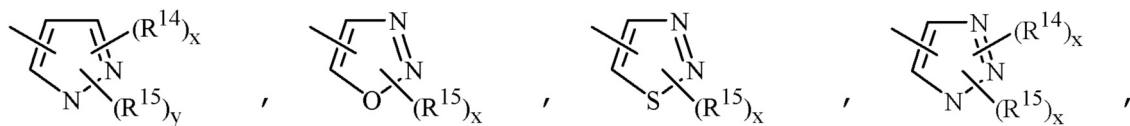


Q-5

Q-6

Q-7

Q-8

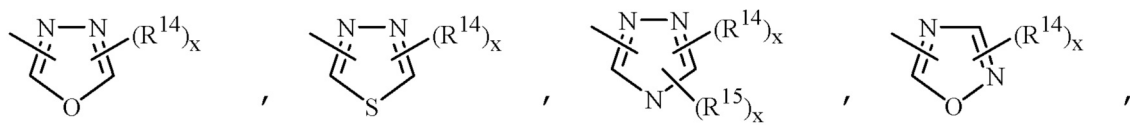


Q-9

Q-10

Q-11

Q-12

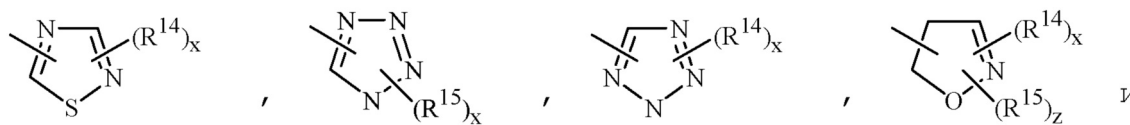


Q-13

Q-14

Q-15

Q-16



Q-17

Q-18

Q-19

Q-20



Q-21

где

R^{14} связан с членом кольца, удаленным относительно члена кольца, соединяющего кольцо Q с остальной частью формулы 1, и независимо выбран из R^{14c} при членах кольца, представляющих собой атом углерода, и R^{14n} при членах кольца, представляющих собой атом азота;

каждый R^{15} независимо выбран из R^{15c} при членах кольца, представляющих собой атом углерода, и R^{15n} при членах кольца, представляющих собой атом азота;

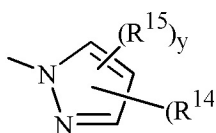
каждый x независимо равняется 0 или 1;

каждый y независимо равняется 0, 1 или 2; и

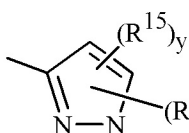
каждый z независимо равняется 0, 1, 2 или 3.

Вариант осуществления 74. Соединение согласно варианту осуществления 73, где Q выбран из Q-1-Q-19.

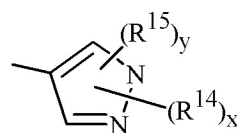
Вариант осуществления 75. Соединение согласно варианту осуществления 73, где Q выбран из



Q-9A



Q-9B



Q-9C

Вариант осуществления 76. Соединение согласно варианту осуществления 75, где Q представляет собой Q-9A или Q-9B.

Вариант осуществления 77. Соединение согласно варианту осуществления 76, где Q представляет собой Q-9A.

Вариант осуществления 78. Соединение согласно любому из вариантов осуществления 75-77, где y равняется 0 или 1.

Вариант осуществления 78a. Соединение формулы 1 или согласно любому из вариантов осуществления 1-78, где если L включает 1,2-фенилен, а 5-членное

ненасыщенное гетероциклическое кольцо Q замещено R^{15c} или R^{15n} в орто-положении (т.е. в смежном положении в кольце) относительно связи, соединяющей кольцо Q с остальной частью формулы 1, то кольцо, содержащее G, замещено по меньшей мере одним R^2 в орто-положении относительно связи с Q.

Вариант осуществления 78b. Соединение формулы 1 или согласно любому из вариантов осуществления 1-78, где если L включает 1,2-фенилен, то 5-членное ненасыщенное гетероциклическое кольцо Q не замещено R^{15c} или R^{15n} в каком-либо орто-положении (т.е. в смежном положении в кольце) относительно связи, соединяющей кольцо с остальной частью формулы 1.

Вариант осуществления 78с. Соединение формулы 1 или согласно любому из вариантов осуществления 1-78, где 5-членное ненасыщенное гетероциклическое кольцо Q не замещено R^{15c} или R^{15n} в каком-либо орто-положении (т.е. в смежном положении в кольце) относительно связи, соединяющей кольцо с остальной частью формулы 1.

Вариант осуществления 79. Соединение формулы 1 или согласно любому из вариантов осуществления 1-78с, где каждый R^{14c} независимо представляет собой галоген, циано, C_1 - C_3 алкил, C_1 - C_3 галогеналкил, C_1 - C_3 алкокси, C_1 - C_3 галогеналкокси или C_2 - C_3 алкоксикарбонил; или фенильное кольцо, которое необязательно имеет до 5 заместителей, независимо выбранных из R^{16} ; или гетероароматическое кольцо, которое необязательно имеет до 4 заместителей, независимо выбранных из R^{17c} при членах кольца, представляющих собой атом углерода, и из R^{17n} при членах кольца, представляющих собой атом азота.

Вариант осуществления 79a. Соединение согласно варианту осуществления 79, где каждый R^{14c} независимо представляет собой галоген, циано, C_1 - C_2 алкил, C_1 - C_2 галогеналкил, C_1 - C_2 алкокси или C_1 - C_2 галогеналкокси.

Вариант осуществления 80. Соединение согласно варианту осуществления 79a, где каждый R^{14c} независимо представляет собой галоген, CH_3 или C_1 галогеналкил.

Вариант осуществления 81. Соединение согласно варианту осуществления 80, где каждый R^{14c} независимо представляет собой F, Cl, Br, CH_3 , CHF_2 или CF_3 .

Вариант осуществления 82. Соединение формулы 1 или согласно любому из вариантов

осуществления 1-81, где каждый R^{14n} независимо представляет собой C_1 - C_2 алкил или C_1 - C_2 галогеналкил.

Вариант осуществления 83. Соединение согласно варианту осуществления 82, где
5 каждый R^{14n} представляет собой C_1 - C_2 алкил.

Вариант осуществления 84. Соединение согласно варианту осуществления 83, где
каждый R^{14n} представляет собой CH_3 .

Вариант осуществления 85. Соединение формулы 1 или согласно любому из вариантов
10 осуществления 1-84, где каждый R^{15c} независимо представляет собой галоген,
 C_1 - C_2 алкил, C_1 - C_2 галогеналкил или C_1 - C_2 алкокси.

Вариант осуществления 86. Соединение согласно варианту осуществления 85, где
каждый R^{15c} независимо представляет собой галоген, CH_3 или C_1 галогеналкил.

Вариант осуществления 87. Соединение согласно варианту осуществления 86, где
15 каждый R^{15c} независимо представляет собой F, Cl, Br, CH_3 , CHF_2 или CF_3 .

Вариант осуществления 88. Соединение формулы 1 или согласно любому из вариантов
осуществления 1-87, где каждый R^{15n} независимо представляет собой C_1 - C_2 алкил или
20 C_1 - C_2 галогеналкил.

Вариант осуществления 89. Соединение согласно варианту осуществления 88, где
каждый R^{15n} представляет собой C_1 - C_2 алкил.

Вариант осуществления 90. Соединение согласно варианту осуществления 89, где
25 каждый R^{15n} представляет собой CH_3 .

Вариант осуществления 91. Соединение формулы 1 или согласно любому из вариантов
осуществления 1-79, где каждый из R^{16} , R^{17c} , R^{18} и R^{19c} независимо представляет собой
галоген, C_1 - C_2 алкил, C_1 - C_2 галогеналкил или C_1 - C_2 алкокси.

Вариант осуществления 92. Соединение согласно варианту осуществления 91, где
30 каждый из R^{16} , R^{17c} , R^{18} и R^{19c} независимо представляет собой галоген, CH_3 или
 C_1 галогеналкил.

Вариант осуществления 93. Соединение согласно варианту осуществления 92, где
35 каждый R^{16} , R^{17c} , R^{18} и R^{19c} независимо представляет собой F, Cl, Br, CH_3 , CHF_2 или
 CF_3 .

Вариант осуществления 94. Соединение формулы 1 или согласно любому из вариантов
осуществления 1-79 или 91-93, где каждый из R^{17n} и R^{19n} независимо представляет собой
40 C_1 - C_2 алкил или C_1 - C_2 галогеналкил.

Вариант осуществления 95. Соединение согласно варианту осуществления 94, где
каждый из R^{17n} и R^{19n} независимо представляет собой C_1 - C_2 алкил.

Вариант осуществления 96. Соединение согласно варианту осуществления 95, где
45 каждый из R^{17n} и R^{19n} представляет собой CH_3 .

Вариант осуществления 97. Соединение формулы 1 или согласно любому из вариантов
осуществления 1-96, где Z представляет собой O.

Варианты осуществления настоящего изобретения, включая вышеуказанные варианты

осуществления 1-97, а также любые другие варианты осуществления, описанные в данном документе, могут сочетаться любым способом, а описания переменных характеристик в вариантах осуществления подходят не только для соединений формулы 1, но также исходных соединений и промежуточных соединений, пригодных для

5 получения соединений формулы 1. Кроме того, варианты осуществления настоящего изобретения, включая вышеуказанные варианты осуществления 1-97, а также любые другие варианты осуществления, описанные в настоящем документе, и любая их комбинация, подходят для композиций и способов по настоящему изобретению.

В качестве варианта осуществления настоящего изобретения следует отметить

10 соединение формулы 1, или его N-оксид или соль, или связанную с ним композицию, способ, или исходное или промежуточное соединение, где А представляет собой А-1, А-2, А-3, А-4, А-5 или А-6; Z представляет собой О; каждый R^2 независимо представляет собой галоген, циано, C_1 - C_2 алкил или C_1 - C_2 галогеналкил; R^{2a} представляет собой Н,

15 галоген, C_1 - C_2 алкил или C_1 - C_2 галогеналкил; каждый из R^{12a} и R^{12b} независимо представляет собой Н, C_1 - C_2 алкил или C_1 - C_2 галогеналкил; R^{13a} представляет собой Н, галоген, C_1 - C_2 алкил, C_1 - C_2 галогеналкил, C_1 - C_2 алкокси или C_1 - C_2 галогеналкокси; и

20 каждый R^{14c} независимо представляет собой галоген, циано, C_1 - C_3 алкил, C_1 - C_3 галогеналкил, C_1 - C_3 алкокси, C_1 - C_3 галогеналкокси или C_2 - C_3 алкоксикарбонил; или фенильное кольцо, необязательно имеющее до 5 заместителей, независимо выбранных из R^{16} ; или гетероароматическое кольцо, необязательно имеющее до 4

25 заместителей, независимо выбранных из R^{17c} при членах кольца, представляющих собой атом углерода, и из R^{17n} при членах кольца, представляющих собой атом азота. Также следует отметить варианты осуществления, включая варианты осуществления 1-97, в том числе их комбинации, используемые как ограничения для описанных выше отмеченных вариантов осуществления.

30 Комбинации вариантов осуществления 1-97 дополнительно иллюстрируются при помощи следующего.

Вариант осуществления А. Соединение формулы 1, где Z представляет собой О;

35 L представляет собой $-C(R^{12a})R^{12b}-C(R^{13a})R^{13b}-$ или 1,2-фенилен, необязательно имеющий до 2 заместителей, независимо выбранных из F, Cl, Br и CH_3 ;

каждый R^2 независимо представляет собой F, Cl, Br или CH_3 ;

R^{2a} представляет собой Н, F, Cl, Br или CH_3 ;

40 R^3 представляет собой F, Cl, Br, CH_3 , CHF_2 или CF_3 ;

R^4 представляет собой F, Cl, Br, CH_3 , CHF_2 или CF_3 ;

R^5 представляет собой Н, F, Cl, Br, CH_3 , CHF_2 или CF_3 ;

45 R^6 представляет собой CH_3 ;

R^7 представляет собой F, Cl, Br, CH_3 , CHF_2 или CF_3 ;

R^8 представляет собой Н или CH_3 ;

R^9 представляет собой F, Cl, Br, CH_3 , CHF_2 или CF_3 ;

R^{10} представляет собой F, Cl, Br, CH_3 , CHF_2 или CF_3 ;

R^{11} представляет собой F, Cl, Br, CH_3 , CHF_2 или CF_3 ;

R^{12a} представляет собой H или CH_3 ;

R^{12b} представляет собой H;

R^{13a} представляет собой H, CH_3 или OCH_3 ;

R^{13b} представляет собой H;

каждый из R^{16} , R^{17c} , R^{18} и R^{19c} независимо представляет собой F, Cl, Br, CH_3 , CHF_2 или CF_3 ; и

каждый из R^{17n} и R^{19n} представляет собой CH_3 .

Вариант осуществления В. Соединение варианта осуществления А, где А представляет собой А-1, А-2, А-3 или А-4;

каждый R^{14c} независимо представляет собой F, Cl, Br, CH_3 , CHF_2 или CF_3 ;

каждый R^{14n} представляет собой CH_3 ;

каждый R^{15c} независимо представляет собой F, Cl, Br, CH_3 , CHF_2 или CF_3 ; и

каждый R^{15n} представляет собой CH_3 .

Вариант осуществления С. Соединение варианта осуществления В, где

А представляет собой А-1, А-2 или А-4;

B^2 представляет собой N; и

Q представляет собой Q-9A или Q-9B.

Вариант осуществления D. Соединение согласно варианту осуществления С, где

L представляет собой $-C(R^{12a})R^{12b}-C(R^{13a})R^{13b}-$;

R^{2a} представляет собой H, F или Cl; и

каждый R^2 представляет собой F или Cl;

при условии, что если G представляет собой N или R^{2a} представляет собой H, то

кольцо, содержащее G, замещено R^2 в орто-положении относительно связи с L.

Вариант осуществления E. Соединение согласно варианту осуществления С, где

L представляет собой 1,2-фенилен, необязательно имеющий до 2 заместителей, независимо выбранных из F, Cl, Br и CH_3 ;

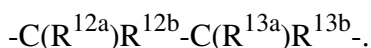
R^{2a} представляет собой H, F или Cl;

каждый R^2 представляет собой F или Cl; и

кольцо, содержащее G, замещено по меньшей мере одним R^2 в орто-положении относительно связи с Q.

Вариант осуществления F. Соединение формулы 1, в котором, когда G представляет собой N или R^{2a} представляет собой H, кольцо, содержащее G, замещено по меньшей мере одним из вариантов R^2 .

Вариант осуществления G. Соединение формулы 1, где L представляет собой



Конкретные варианты осуществления включают соединения формулы 1, выбранные из группы, состоящей из

3-хлор-N-[2-[2-хлор-4-(3-трифторметил)-1H-пиразол-1-ил]фенил-1-метилэтил]-2-
 5 пиразинкарбоксамида (соединения 1),

N-[2-[2-хлор-4-[3-(трифторметил)-1H-пиразол-1-ил]фенил]этил-3-(трифторметил)-2-
 пиридинкарбоксамида (соединения 40),

N-[3',5'-дифтор-4'-[3-(трифторметил)-1H-пиразол-1-ил][1,1'-бифенил]-2-ил]-3-
 (трифторметил)-2-пиридинкарбоксамида (соединения 172),

3-(дифторметил)-N-[3',5'-дифтор-4'-[3-(трифторметил)-1H-пиразол-1-ил][1,1'-бифенил]
 10 -2-ил]-1-метил-1H-пиразол-4-карбоксамида (соединения 173) и

N-[2-[3-хлор-5-[3-(трифторметил)-1H-пиразол-1-ил]-2-пиридинил]этил]-2-
 (трифторметил)бензамида (соединения 85).

Настоящее изобретение предусматривает фунгицидную композицию, содержащую
 15 соединение формулы 1 (включая все его стереоизомеры, N-оксиды и соли) (в фунгицидно
 эффективном количестве) и по меньшей мере один другой фунгицид. В качестве
 вариантов осуществления таких композиций следует отметить композиции, содержащие
 соединение, соответствующее какому-либо из вариантов осуществления соединения,
 описанных выше.

Настоящее изобретение предусматривает фунгицидную композицию, содержащую
 20 соединение формулы 1 (включая все его стереоизомеры, N-оксиды и соли) (т.е. в
 фунгицидно эффективном количестве) и по меньшей мере один дополнительный
 компонент, выбранный из группы, состоящей из поверхностно-активных веществ,
 твердых разбавителей и жидких разбавителей. В качестве вариантов осуществления
 25 таких композиций следует отметить композиции, содержащие соединение,
 соответствующее какому-либо из вариантов осуществления соединения, описанных
 выше.

Настоящее изобретение предусматривает способ контроля болезней растений,
 вызванных патогенными для растений грибами, включающий применение по отношению
 30 к растению или его части или к семени растения фунгицидно эффективного количества
 соединения формулы 1 (включая все его стереоизомеры, N-оксиды и соли). В качестве
 вариантов осуществления такого способа следует отметить способы, включающие
 применение фунгицидно эффективного количества соединения, соответствующего
 какому-либо из вариантов осуществления соединения, описанных выше. Особо следует
 35 отметить варианты осуществления, в которых соединения применяют в виде композиций
 по настоящему изобретению.

Настоящее изобретение также предусматривает способ контроля растительной нематоды,
 включающий обеспечение контакта растительной нематоды или ее
 40 среды обитания с нематоцидно эффективным количеством соединения формулы 1, его
 N-оксида или соли (например, в виде композиции, описанной в данном документе), где
 L представляет собой $-C(R^{12a})R^{12b}-C(R^{13a})R^{13b}-$. В качестве вариантов осуществления
 данного способа следует отметить способы, включающие применение нематоцидно
 эффективного количества соединения, соответствующего вариантам осуществления
 45 соединения, описанным выше. В качестве вариантов осуществления данного способа
 следует особо отметить способы, включающие применение нематоцидно эффективного
 количества соединения формулы 1, его N-оксида или соли, где A представляет собой
 A-1.

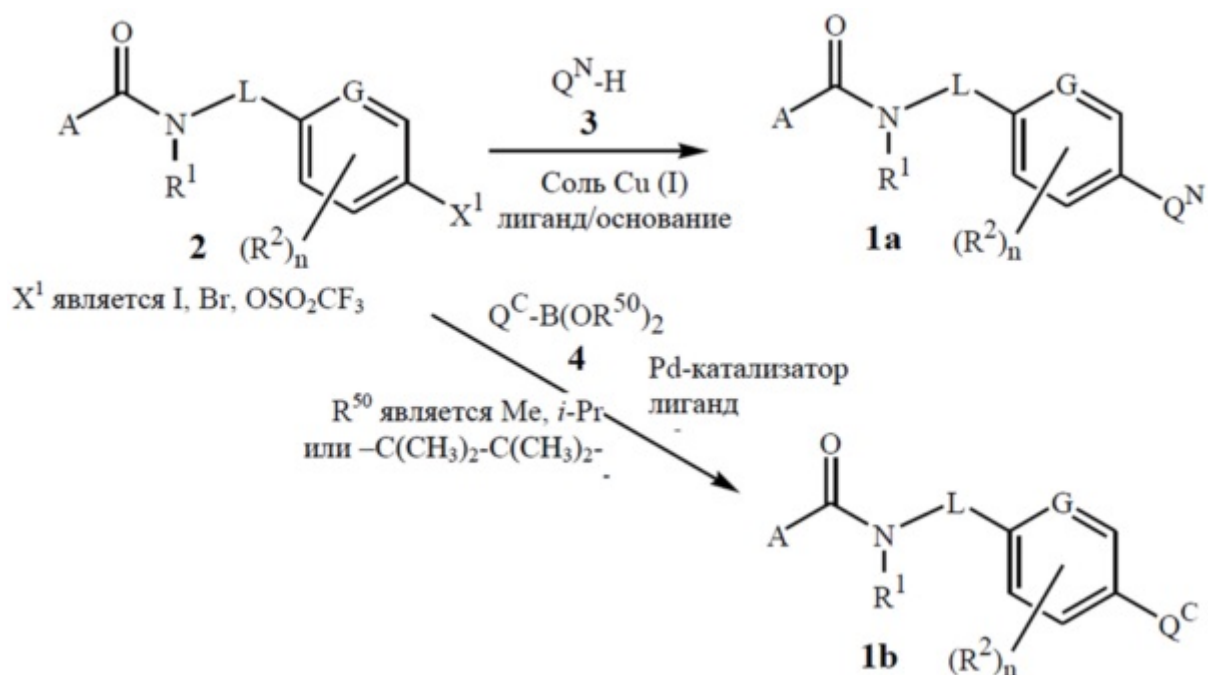
Один или несколько из следующих способов и вариаций, которые описаны на схемах

1-19, можно применять для получения соединений формулы 1. Определения A, R¹, L, G, R² и n в соединениях формул 1-38, представленных ниже, являются такими, как определено выше в кратком описании настоящего изобретения, если не указано иное. Формулы 1a-1f являются различными разновидностями формулы 1, и все заместители в формулах 1a-1f являются такими, как определено выше для формулы 1, если не указано иное. Формулы 7a-7c являются различными разновидностями формулы 7, и все заместители в формулах 7a-7c являются такими, как определено для формулы 7, если не указано иное. Формулы 13a-13e являются различными разновидностями формулы 13, и все заместители в формулах 13a-13e являются такими, как определено для формулы 13, если не указано иное. Формула 16a является гомологичной формуле 16, и все заместители в формуле 16a являются такими, как определено для формулы 16, если не указано иное. Формула 19a является разновидностью формулы 19, и все заместители в формуле 19a являются такими, как определено для формулы 19, если не указано иное. Формула 23a является разновидностью формулы 23, и все заместители для формулы 23a такие, как для формулы 23, если не указано иное.

Как показано на схеме 1, соединения формулы 1a (т.е. формулы 1, где Z представляет собой O, а Q представляет собой связанный посредством азота гетероцикл, обозначенный Q^N) могут быть получены посредством сочетания Бухвальда-Хартвига соединений формулы 2 с гетероциклами формулы 3, где азот кольца связан с атомом водорода. Эти реакции сочетания, как правило, проводят в инертном растворителе в присутствии подходящего лиганда, соли меди(I), такой как CuI или CuBr, и основания, такого как карбонат натрия или калия. Типичными лигандами являются 1,2-диаминоциклогексан и фенантролин. Подходящими растворителями для реакции являются диоксан, 1,2-диэтоксиэтан или толуол, и реакцию осуществляют при температурах в диапазоне от комнатной температуры до температуры флегмы в течение периода времени в диапазоне 1-48 часов. Условия сочетаний Бухвальда-Хартвига широко освещены в литературе (см., например, Tetrahedron Letters, 2010, 52(38), 5052 и Journal of Medicinal Chemistry 2010, 53(10), 31-8). Гетероциклы формулы 3 коммерчески доступны или могут быть получены с помощью способов, хорошо известных в данной области техники.

Как также показано на схеме 1, соединения формулы 1b (т.е. формулы 1, где Z представляет собой O, а Q представляет собой связанный посредством углерода гетероцикл, обозначенный Q^C) могут быть получены посредством сочетания Сузуки соединений формулы 2 с содержащими бор промежуточными соединениями формулы 4, где углерод кольца связан с бором, в присутствии Pd(0) или солей Pd(II), подходящего лиганда и основания. Подходящими основаниями для данного преобразования являются карбонат калия или карбонат цезия, тогда как соли Pd(II), такие как Pd(OAc)₂ или PdCl₂, применяют совместно с лигандами, такими как трифенилфосфин или 1,1'-бис(дифенилфосфино)ферроцен (dppf). Условия реакций сочетания Сузуки широко освещены в литературе (см., например, Angewandte Chemie International Edition, 2006, 45, 3484 и Tetrahedron Letters, 2002, 58(14), 2885). Содержащие бор промежуточные соединения формулы 4 коммерчески доступны или могут быть получены из соответствующих галидов или трифторметансульфонатов с помощью способов, известных в литературе (см., например, патентную публикацию по PCT WO 2007/043278, патент США № 8080566, Organic Letters, 2011, 13(6), 1366 и Organic Letters, 2012, 14(2), 600).

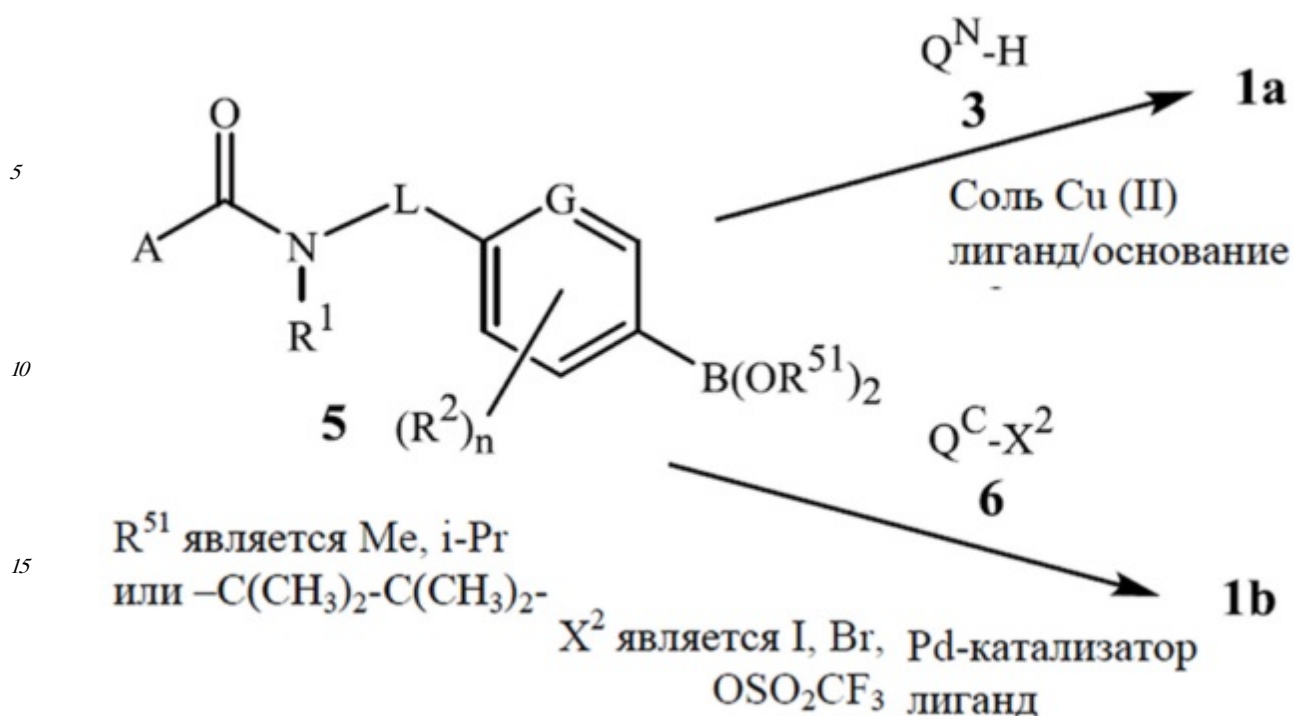
Схема 1



Альтернативно, как показано на схеме 2, соединения формулы 1a могут быть получены из содержащих бор промежуточных соединений 5 с применением условий сочетания Чана-Лама с содержащими азот гетероциклами формулы 3 в присутствии соли Cu(II), кислорода и основания при температурах в диапазоне от температуры окружающей среды до температуры флегмы в течение 24-72 часов. Примерами солей Cu(II), которые можно использовать, являются Cu(OAc)₂, CuBr₂ и CuI₂. Подходящие основания включают пиридин, хинолин и триэтиламин. Подходящие растворители включают дихлорметан, хлороформ, диэтиловый эфир и тетрагидрофуран. Типичные условия см. в Tetrahedron Letters, 1998, 38, 2941 и в патентной публикации по PCT WO2003/072547.

Как также показано на схеме 2, соединения формулы 1b могут быть получены посредством сочетания соединений формулы 5 с соединениями формулы 6, где углерод кольца связан с X². Условия для осуществления таких сочетаний аналогичны условиям сочетания Сузуки, описанным на схеме 1. Соединения формулы 6 коммерчески доступны или могут быть без труда получены с помощью методик, описанных в литературе.

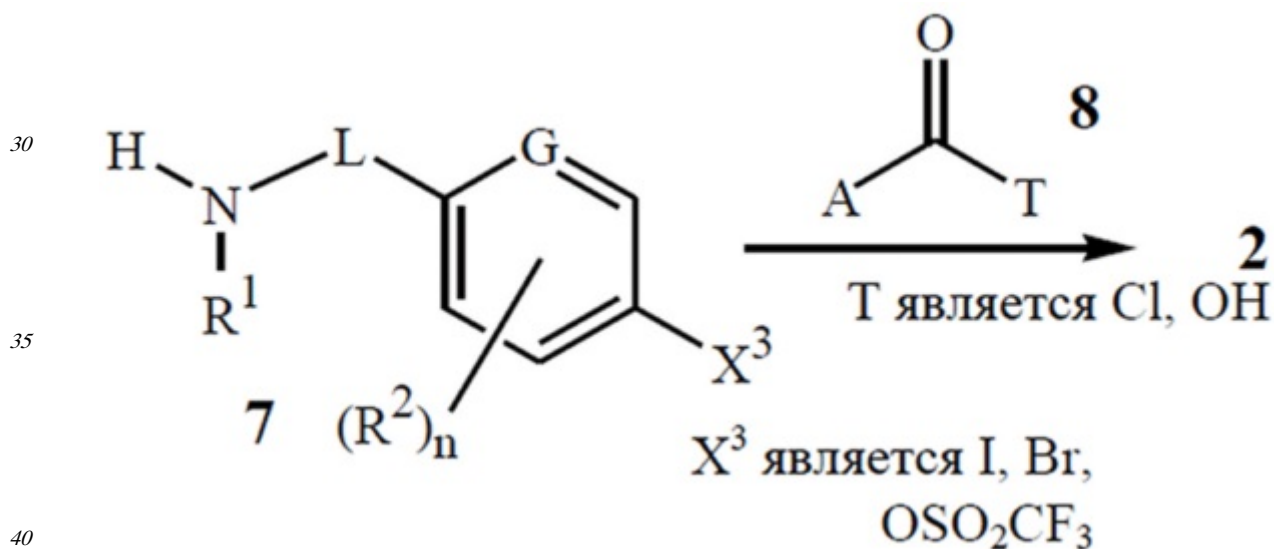
Схема 2



Соединения формулы 5 могут быть получены из соединений формулы 2 с помощью способов, приведенных на схеме 1 для получения соединений формулы 4.

Как показано на схеме 3, соединения формулы 2 могут быть получены посредством ацилирования производных аминов формулы 7. Данные типы ацилирования широко освещены в литературе. (См., например, March, Advanced Organic Chemistry, 3rd ed., John Wiley and Sons, New York, 1985, p.1152).

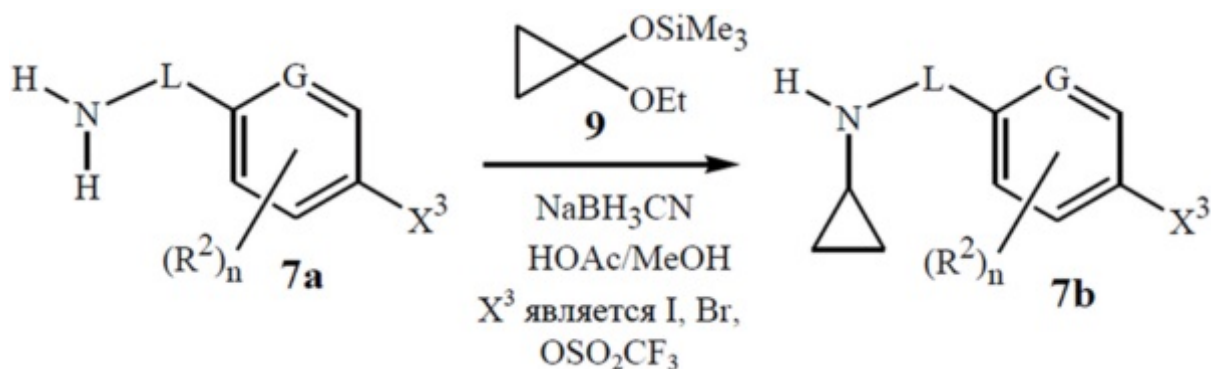
Схема 3



Как показано на схеме 4, соединения формулы 7b (т.е. формулы 7, где R^1 представляет собой циклопропил) могут быть получены путем осуществления реакции первичных аминов формулы 7a (т.е. формулы 7, где R^1 представляет собой H) с 1-этокси-1-(триметилсилилокси)циклопропаном (9) в уксусной кислоте/метаноле в присутствии цианоборогидрида натрия. Типичные способы см. в Journal of Medicinal Chemistry 2008, 51(11), 3238 и в публикации патентного документа США 2009/0176844. Первичные амины формулы 7a получают с помощью способов, известных в данной области техники,

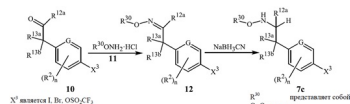
таких как способы, которые можно найти в патентных публикациях по PCT WO 2007/141009, WO 2010/075200, WO 2011/124093 и WO 2009/158426, публикации патентного документа США 2009/0069296, EP 1574511 и Applied Radiation & Isotopes, 1993, 44(5), 821.

Схема 4



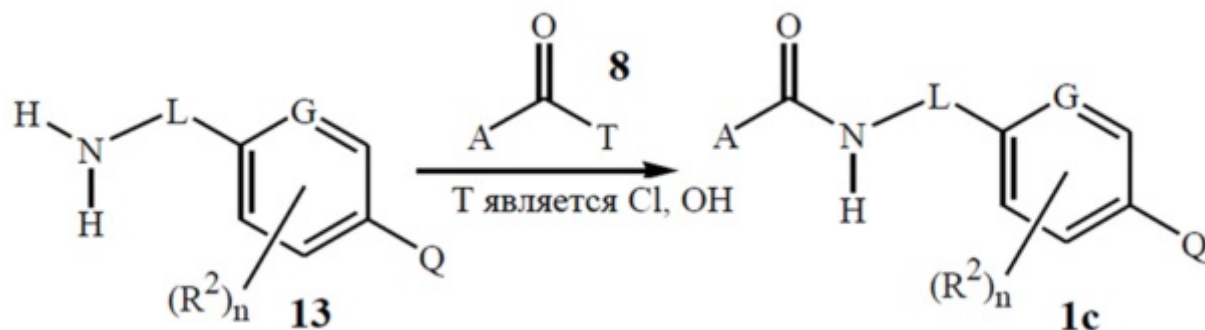
Как показано на схеме 5, соединения формулы **7c** (т.е. формулы 7, где R^1 представляет собой OR^{30} (т.е. C_1 - C_2 алкокси), а L представляет собой $-CH(R^{12a})-C(R^{13a})R^{13b}-$) могут быть получены посредством реакции кетонов формулы 10 с алкоксиаминами формулы 11 с получением оксимов формулы 12 с последующим восстановлением цианоборогидридом натрия. Условия оксимирования и последующего восстановления цианоборогидридом натрия можно найти в публикации патентного документа США 2011/0230537 и патентных публикациях по PCT WO 2011/147690 и WO 2010/063700. Кетоны формулы 10 либо коммерчески доступны, либо могут быть без труда получены с применением широко освещенных способов (см., например, патентные публикации по PCT WO 2011/133875 и WO 2007/063013 и публикацию патентного документа США 2006/0154973).

Схема 5



Как показано на схеме 6, соединения формулы **1c** (т.е. формулы 1, где Z представляет собой O, а R^1 представляет собой H) могут быть получены посредством ацилирования аминов формулы 13 с помощью способов, приведенных для схемы 3.

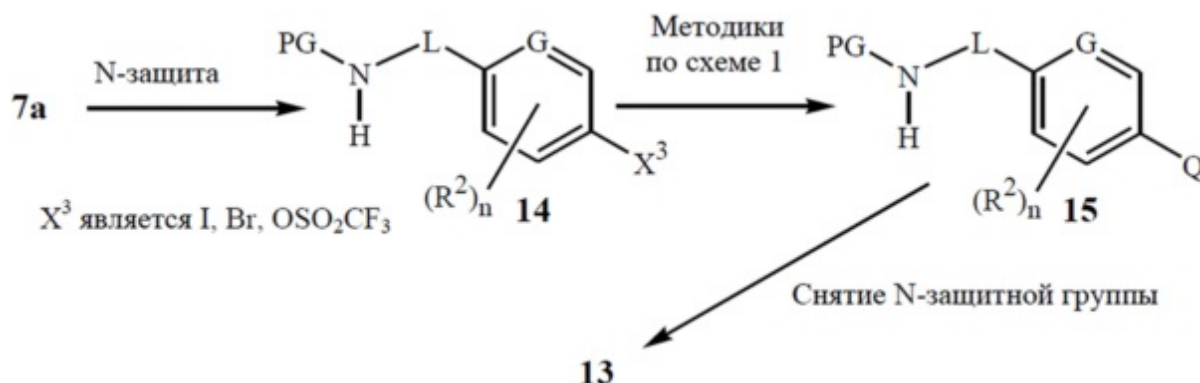
Схема 6



Как показано на схеме 7, амины формулы **13** могут быть получены из аминов формулы **7a**. Сначала производят защиту N в аминах формулы **7a** с помощью защитной группы PG, такой как трет-бутоксикарбонил или бензилоксикарбонил, с получением соединений формулы 14. Преобразование соединений формулы 14 в соединения формулы

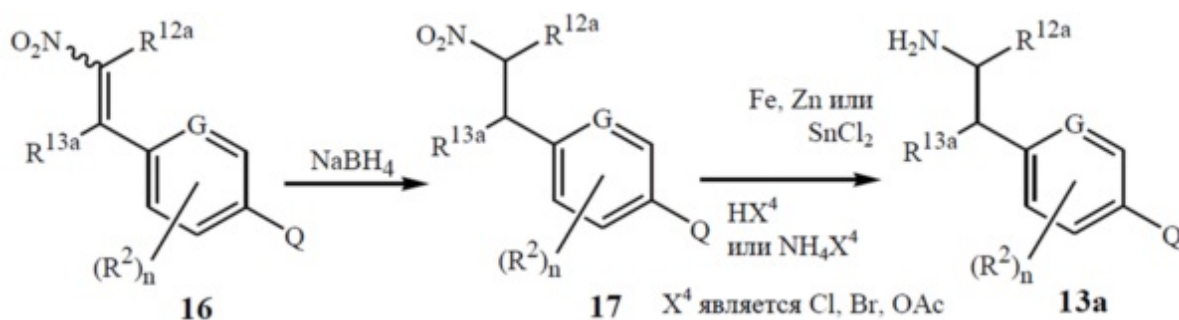
15 можно осуществлять посредством реакций сочетания, описанных на схеме 1. Путем снятия защиты с N в соединениях формулы 15 получают амины формулы 13. Способы защиты N и снятия защиты с N для применения в этой последовательности можно найти в Greene, Protective Groups in Organic Synthesis, John Wiley and Sons, New York, 1981.

Схема 7



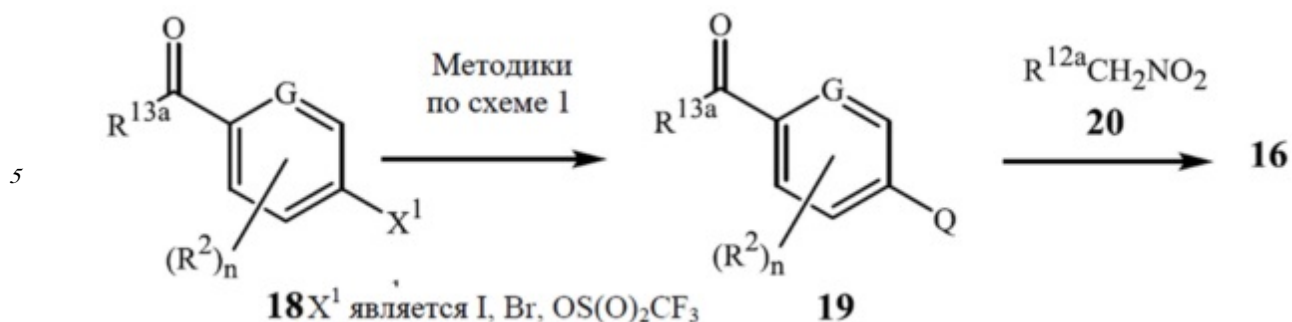
Как показано на схеме 8, амины формулы 13a (т.е. формулы 13, где L представляет собой -CH(R^{12a})-CH(R^{13a})-) могут быть получены посредством восстановления борогидридом натрия нитроолефинов формулы 16 с последующим восстановлением полученного в результате нитросоединения формулы 17. Типичные методики восстановления нитроолефинов борогидридом натрия можно найти в ACS Medicinal Chemistry Letters, 2010, 3(1), 5, и в патентной публикации по PCT WO2011/124704. Восстановление нитросоединения 17 можно осуществлять с использованием Fe, Zn или SnCl₂ в водной кислой среде при температурах в диапазоне от температуры окружающей среды до температуры флегмы. Спиртовые соразтворители, такие как метанол, этанол и изопропанол, также могут быть использованы. Как правило, используют такие кислоты, как соляная, бромистоводородная и уксусная кислоты, или хлорид аммония. Условия таких реакций восстановления можно найти в J. Labelled Compounds & Radiopharmaceuticals, 2011, 54(5), 239 и в патентной публикации по PCT WO 2011/138657. Данный способ можно применять, если R^{13a} представляет собой H, алкил или галогеналкил.

Схема 8



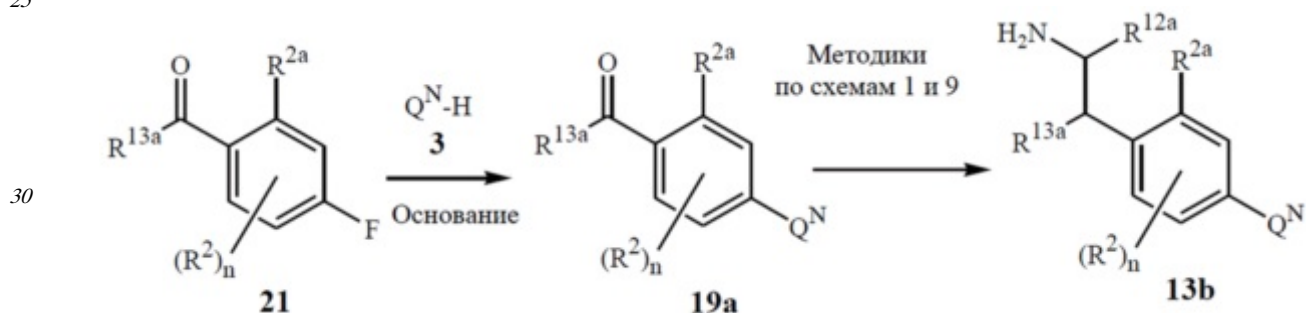
Как показано на схеме 9, нитроолефины формулы 16 могут быть получены посредством превращения соединений формулы 18 в соединения формулы 19 с помощью способов сочетания, описанных для схемы 1, с последующей конденсацией соединений формулы 19 с нитросоединениями формулы 20. Реакцию конденсации проводят в уксусной кислоте в присутствии ацетата аммония аналогично методикам, раскрытым в патентной публикации по PCT WO 2007/141009. Данный способ можно применять, если R^{13a} представляет собой H, алкил или галогеналкил.

Схема 9



10 Амины формулы 13b (т.е. формулы 13, где L представляет собой -CH(R^{12a})-CH(R^{13a})-, G представляет собой C-R^{2a}, а Q представляет собой связанный посредством азота гетероцикл, обозначенный Q^N) могут быть получены, как показано на схеме 10. Соединения формулы 21 обрабатывают гетероциклами формулы 3, где азот кольца связан с атомом водорода, в присутствии оснований, таких как гидрид натрия, карбонат калия, карбонат натрия и трет-бутоксид калия, в апротонных растворителях, таких как тетрагидрофуран, диметилсульфоксид или N,N-диметилформамид, при температурах в диапазоне от температуры окружающей среды до температуры флегмы. Полученное в результате соединения формулы 19a (т.е. формулы 19, где G представляет собой C-R^{2a}, а Q представляет собой связанный посредством азота гетероцикл, обозначенный Q^N) затем превращают в соединения формулы 13b с помощью способов, описанных на схемах 8 и 9. Данный способ можно применять, если R^{13a} представляет собой H, алкил, галогеналкил, алкокси или галогеналкокси.

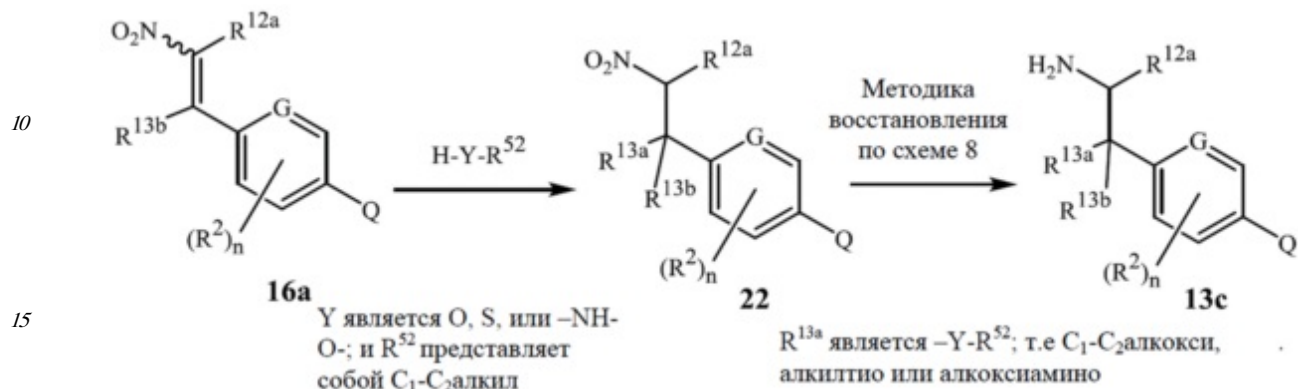
Схема 10



35 Амины формулы 13с (т.е. формулы 13, где L представляет собой -CH(R^{12a})-C(R^{13a})(R^{13b})-), в которых R^{13a} представляет собой C₁-C₂алкокси, C₁-C₂алкилтио или C₁-C₂алкоксиамино, могут быть получены, как показано на схеме 11. Путем обработки нитроолефина формулы 16a (гомологичного формуле 16, за исключением того, что заместитель в олефине, присоединенный к одному и тому же атому в кольце, содержащем G, указан как R^{13b} вместо R^{13a}) спиртовым раствором алкоксида металла (т.е. M⁺OR⁵²) получают промежуточные алкоксисоединения формулы 22, где R^{13b} представляет собой YR⁵², R⁵² представляет собой C₁-C₂алкил, а Y представляет собой O. Аналогично, путем обработки нитроолефина алкантиолом или алкоксиамином формулы H-Y-R⁵², где Y представляет собой S или -NH-O-, соответственно, получают соответствующее соединение формулы 22. Условия данных аналогичных преобразований можно найти в патентной публикации по PCT WO 2008/148570. Путем восстановления

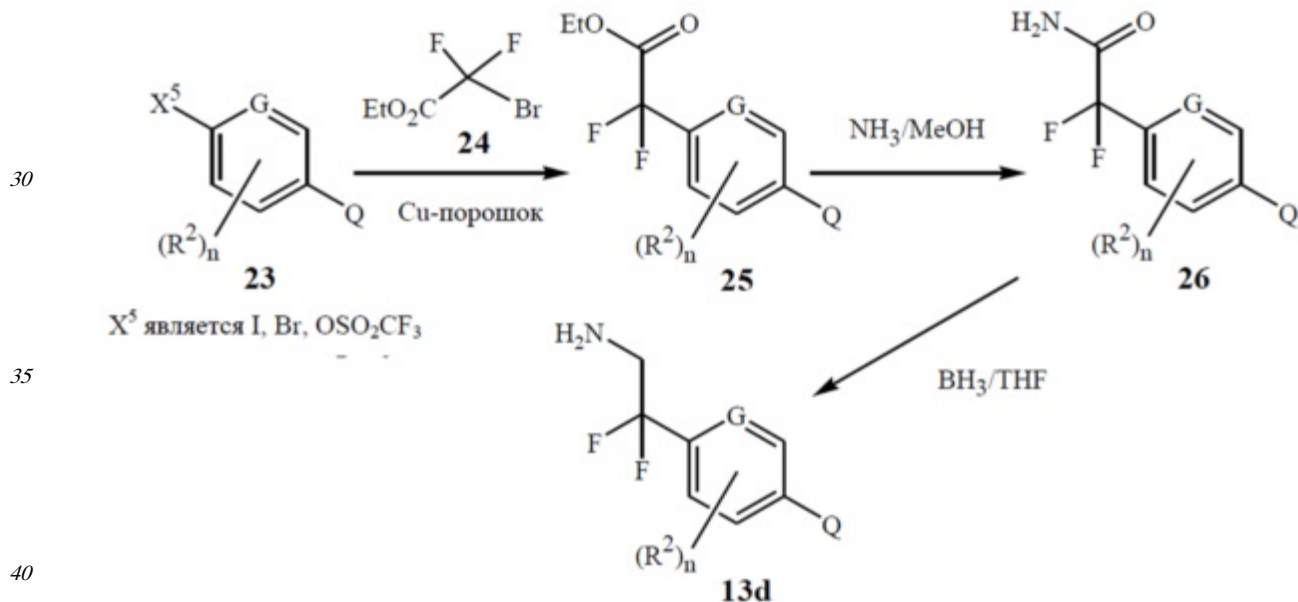
промежуточного соединения формулы 22 с помощью способа, описанного на схеме 8, получают соответствующий амин формулы 13с. Данный способ в особенности можно применять, если R^{13b} представляет собой H, алкил или галогеналкил. Соединения формулы 16а могут быть получены с помощью способов получения соединений формулы 16, например, способа со схемы 9.

Схема 11



Как показано на схеме 12, амины формулы 13d (т.е. формулы 13, где L представляет собой $-CH_2CF_2-$) могут быть получены из промежуточных соединений формулы 23 посредством обработки сложными эфирами формулы 24 в присутствии медного порошка с получением сложных эфиров формулы 25. Путем амидирования сложных эфиров формулы 25 с последующим восстановлением полученных в результате амидов формулы 26 получают амины формулы 13d. Условия осуществления этой последовательности можно найти в Bioorganic & Medicinal Chemistry Letters, 2008, (18), 2865.

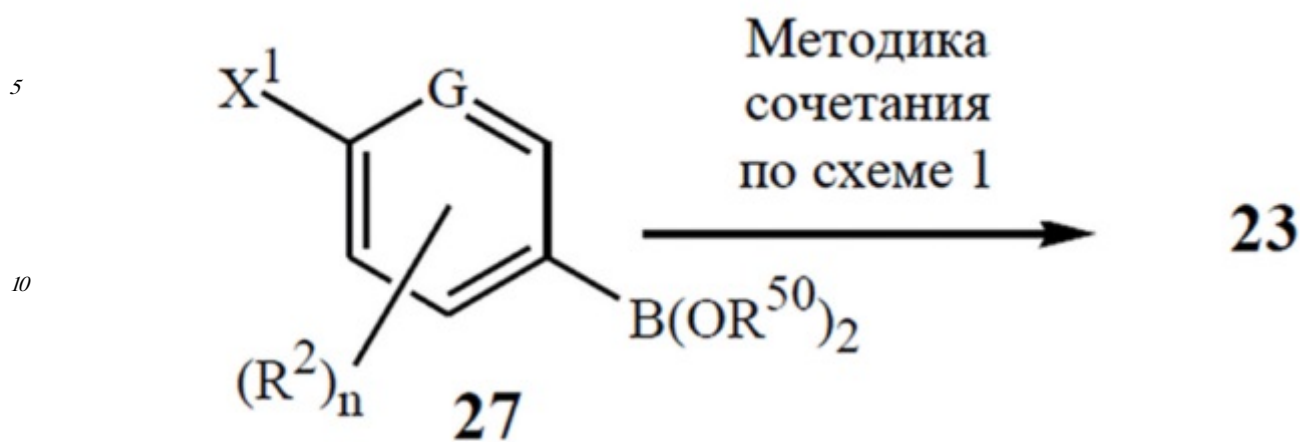
Схема 12



Как показано на схеме 13, промежуточные соединения формулы 23 могут быть получены из содержащих бор промежуточных соединений 27 путем применения описанных способов сочетания с использованием содержащих бор промежуточных соединений 4 и 5 согласно схемам 1 и 2, соответственно. Содержащие бор промежуточные соединения 27 коммерчески доступны или могут быть без труда получены с помощью способов, известных в литературе (см., например, Tetrahedron Letters, 2002, 58(14), 2885; Tetrahedron, 2010, 66(40), 8000; European Journal of Organic

Chemistry, 2011, (2), 327; European Journal of Organic Chemistry, 2009, (25), 4325).

Схема 13

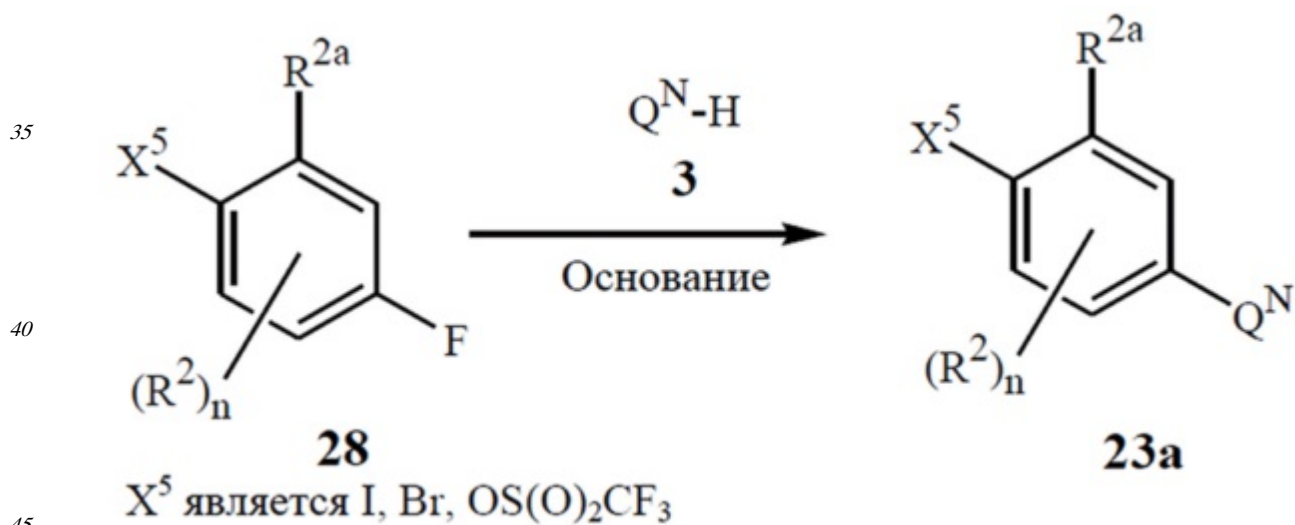


X^1 является I, Br, OSO_2CF_3

R^{50} является Me, *i*-Pr или $-C(CH_3)_2-C(CH_3)_2-$

Как показано на схеме 14, соединения формулы 23а (т.е. формулы 23, где G представляет собой $C-R^{2a}$, а Q представляет собой связанный посредством азота гетероцикл, обозначенный Q^N) также могут быть получены путем осуществления реакции арилфторидов формулы 28 с гетероциклами формулы 3, где азот кольца связан с атомом водорода, с помощью способа, аналогичного таковому, описанному для схемы 10. Арилфториды формулы 28 коммерчески доступны или могут быть получены с помощью способов, известных в области техники, связанной с синтезом органических химических соединений.

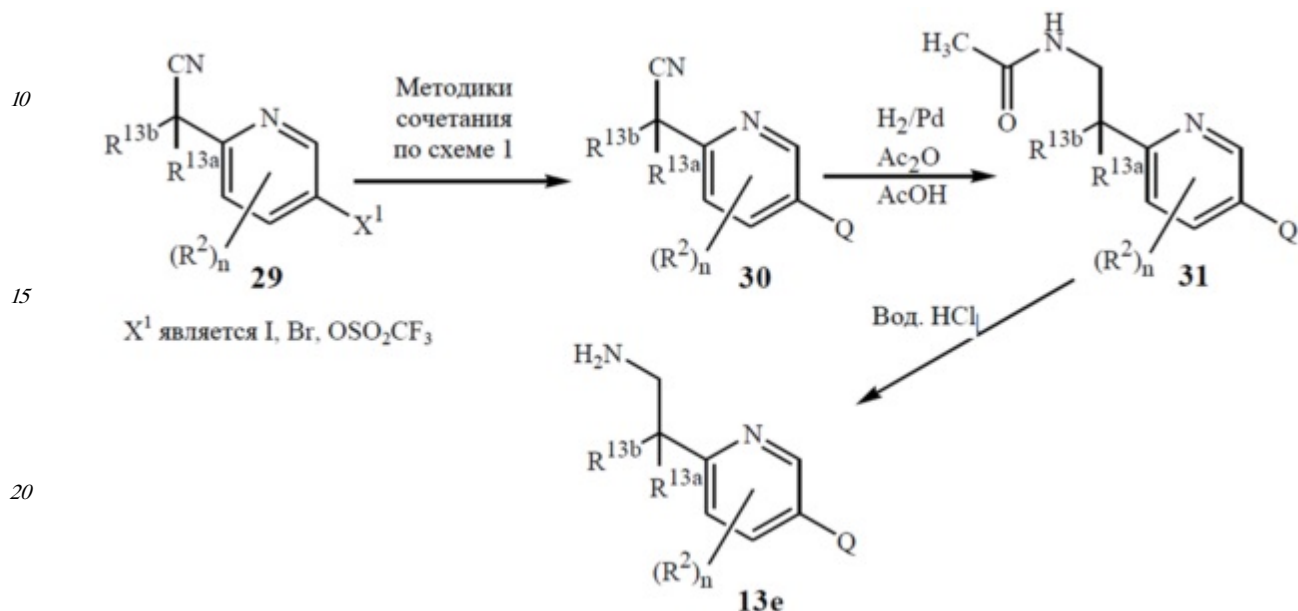
Схема 14



Соединения формулы 13е (т.е. формулы 13, где L представляет собой $-CH_2-C(R^{13a})(R^{13b})-$, а G представляет собой N) могут быть получены, как показано на схеме 15. Подвергая соединения формулы 29 воздействию условий сочетания, описанных

на схеме 1, получают нитрилы формулы 30. Путем каталитической гидрогенизации нитрилов формулы 30 в присутствии ангидрида уксусной кислоты/уксусной кислоты получают производные ацетамида формулы 31, из которых при кислотном гидролизе получают амины формулы 13е. Нитрилы формулы 29 могут быть получены с помощью

Схема 15



Как показано на схеме 16, соединения формулы 1d (т.е. формулы 1, где Z представляет собой O, а L представляет собой 1,2-фенилен, необязательно имеющий до 4 заместителей, независимо выбранных из галогена и C₁-C₂алкила) могут быть получены посредством

25

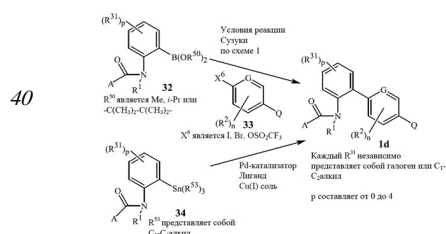
30

35

40

45

Схема 16



Промежуточные соединения формул 32 и 34 могут быть получены с применением коммерчески доступных исходных веществ и способов, изложенных на схемах 3, 4 и 6.

Промежуточные соединения формулы 33 либо коммерчески доступны, либо могут быть получены, как показано на схеме 17, из промежуточных соединений формулы 35 с помощью ряда способов, известных специалисту в данной области техники. Например,

если Q в соединениях формулы 33 представляет собой связанный посредством азота гетероцикл, обозначенный Q^N , а J в соединениях формулы 35 представляет собой бром, хлор или трифторметансульфонат, соединения формулы 33 могут быть получены с применением условий сочетания Бухвальда-Хартвига, описанных для схемы 1.

Альтернативно, промежуточные соединения формулы 35, если в них J представляет собой бороновую кислоту или сложный эфир бороновой кислоты, могут быть подвергнуты реакции сочетания с гетероциклами формулы 3 (Q^N -H) с применением условий сочетания Чана-Лама, описанных для схемы 2, с получением соединений

формулы 33, где Q представляет собой Q^N . Соединения формулы 33, где Q представляет собой связанный посредством углерода гетероцикл, обозначенный Q^C , можно получить посредством сочетания предшественников формулы 35, где J представляет собой Br, Cl, I или трифторметансульфонат, с замещенными боронатом гетероциклами Q^C -B

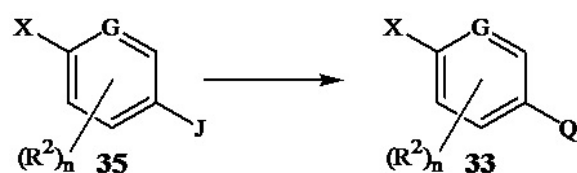
(OR⁵⁰)₂ (4) с применением условий сочетания Сузуки схемы 1 или с замещенными

триалкилоловом гетероциклами Q^C -Sn(R⁵³)₃ с применением условий сочетания Стилле схемы 16. Альтернативно, соединения формулы 35, где J представляет собой боронатную группу или группу триалкилолова, также могут быть подвергнуты реакции сочетания

с замещенными галогеном гетероциклами Q^C -X с помощью способов, показанных на схемах 1 или 16, с получением соединений формулы 33, где Q представляет собой Q^C . Специалисту-химику будет понятно, что в реакциях с участием соединений формулы 35 необходим взвешенный выбор групп X и J, и что изомерные продукты могут быть получены в случаях, если группы X и J характеризуются одинаковой реакционной способностью. В случаях, когда получают смеси региоизомеров, желаемый продукт может быть выделен с помощью традиционных техник разделения, известных в уровне техники.

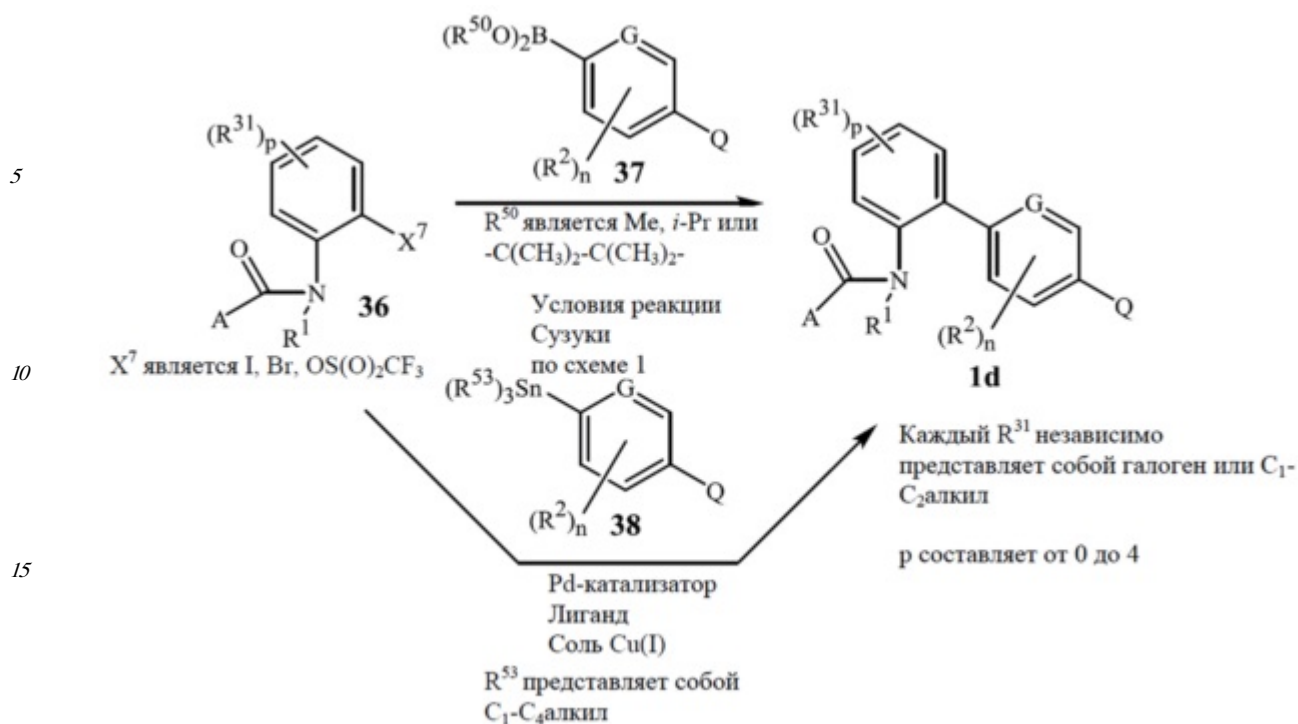
Если J в формуле 35 представляет собой функциональную группу, такую как алкен, алкин, оксим, нитрил или кетон, то функциональная группа может быть превращена в различные гетероциклы с помощью способов, описанных в Katritsky, *Advances in Heterocyclic Chemistry*, Elsevier, Vol. 1-104.

Схема 17



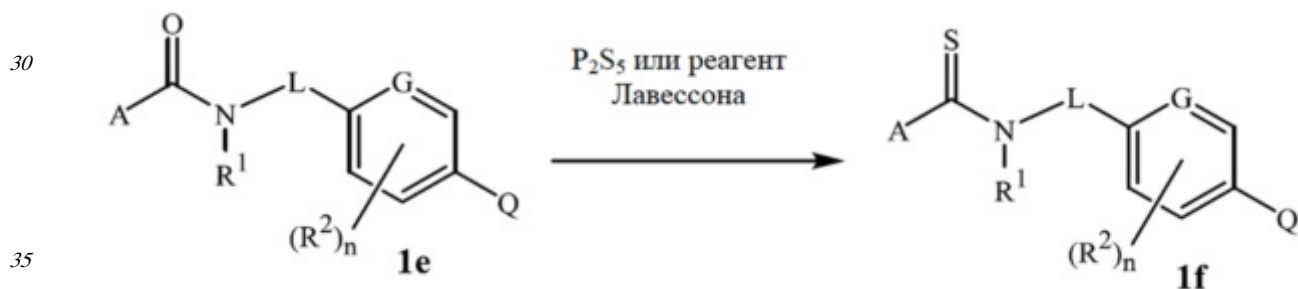
Как показано на схеме 18, соединения формулы 1d также могут быть получены посредством сочетания промежуточных соединений, аналогичных соединениям, изображенным на схеме 16, где функциональные группы в исходных реагентах меняли местами. Таким образом, посредством сочетания промежуточных соединений формулы 36 с боронатами формулы 37 и содержащими триалкилолово промежуточными соединениями формулы 38 с помощью способов, описанных на схеме 16, получают соединения формулы 1d.

Схема 18



Соединения формулы 1f (т.е. формулы 1, где Z представляет собой S) могут быть получены, как показано на схеме 19. Путем обработки соединения формулы 1e (т.е. формулы 1, где Z представляет собой O) пентасульфидом фосфора или реагентом Лавессона (2,4-бис(4-метоксифенил)-1,3-дитиа-2,4-дифосфетан-2,4-дисульфидом) в инертном растворителе, таком как диоксан или толуол, при температурах растворителя в диапазоне от 0°C до температуры флегмы в течение 0,1-72 часов получают соответствующее тионовое соединение формулы 1f. Данные общие преобразования хорошо известны в литературе; см., например, патент США 3755582.

Схема 19



Общепризнанно, что некоторые реагенты и условия реакции, описанные выше для получения соединений формулы 1, могут быть не совместимы с определенными функциональными группами, присутствующими у промежуточных соединений. В данных случаях включение в синтез последовательностей для защиты/снятия защиты или взаимопревращений функциональных групп поможет в получении необходимых продуктов. Применение и выбор защитных групп будут очевидны для специалиста в области химического синтеза (см., например, Greene, T.W.; Wuts, P.G.M. Protective Groups in Organic Synthesis, 2nd ed.; Wiley: New York, 1991). Специалисту в данной области будет понятно, что в некоторых случаях после введения данного реагента, как изображено на любой отдельной схеме, может быть необходимо осуществление дополнительных традиционных стадий синтеза, не описанных подробно, для выполнения синтеза соединений формулы 1. Также будет понятно, что может быть необходимым выполнение комбинации этапов, проиллюстрированных в вышеуказанных схемах, в порядке ином,

нежели предполагаемый конкретной представленной последовательностью для получения соединений формулы 1. Специалисту в данной области также будет понятно, что соединения формулы 1 и промежуточные соединения, описанные в данном документе, могут быть подвергнуты различным электрофильным, нуклеофильным, радикальным, металлоорганическим реакциям, реакциям окисления и восстановления для добавления заместителей или модификации существующих заместителей.

Специалисту в данной области также будет понятно, что соединения формулы 1 и промежуточные соединения, описанные в данном документе, могут быть подвергнуты различным электрофильным, нуклеофильным, радикальным, металлоорганическим реакциям, реакциям окисления и восстановления для добавления заместителей или модификации существующих заместителей.

Без дополнительного уточнения предполагается, что специалист в данной области, применяя предшествующее описание, может использовать настоящее изобретение в полном его объеме. Следующие примеры синтеза, следовательно, должны быть истолкованы лишь как иллюстративные, а не ограничивающие раскрытие каким-либо образом. Этапы в следующих примерах синтеза иллюстрируют процедуру для каждого этапа в общем синтетическом преобразовании, и исходный материал для каждого этапа не обязательно должен быть получен посредством конкретного подготовительного действия, процедура которого описывается в других стадиях. Процентные соотношения являются весовыми, за исключением смесей хроматографических растворителей, или если указывается иное. Части и процентные соотношения для смесей хроматографических растворителей являются объемными, если не указано иное.

Спектры ^1H ЯМР представлены в м.д. в сторону слабого поля от тетраметилсилана в CDCl_3 , если не указано иное; “s” означает синглет, “d” означает дублет, “t” означает триплет, “q” означает квартет, “m” означает мультиплет, “br s” означает широкий синглет, “br m” означает широкий мультиплет. Массовые спектры представлены в виде молекулярного веса исходного иона с самым высоким относительным содержанием изотопа (M+1), образованного при добавлении H^+ (молекулярный вес 1) к молекуле, или (M-1), образованного при потере H^+ (молекулярный вес 1) молекулой, наблюдаемого при применении жидкостной хроматографии совместно с масс-спектрометром (MS) с применением либо химической ионизации при атмосферном давлении (AP^+), либо электрораспылительной ионизации (ESI^+), где “amu” означает атомные единицы массы.

ПРИМЕР СИНТЕЗА 1

Получение 2-хлор-N-[3',5'-дифтор-4'-[3-(трифторметил)-1H-пиразол-1-ил][1,1'-бифенил]-2-ил]-3-пиридинкарбоксамида (соединения 170)

Стадия А: получение 1-(2,6-дифтор-4-нитрофенил)-3-трифторметил-1H-пиразола

Смесь 1,2,3-трифтор-5-нитробензола (2,00 г, 11,3 ммоль), 3-(трифторметил)-1H-пиразола (1,61 г, 11,9 ммоль) и карбоната калия (3,90 г, 28,2 ммоль) в ацетонитриле (30 мл) нагревали с обратным холодильником в течение 16 часов. Реакционную смесь концентрировали при пониженном давлении и очищали с помощью жидкостной хроматографии среднего давления на силикагеле с элюированием 0-40% этилацетата в гексанах с получением титульного соединения (2,39 г).

^1H ЯМР δ 8,04 (m, 2H), 7,82 (s, 1H), 6,84 (s, 1H).

Стадия В: получение 3,5-дифтор-4-[3-(трифторметил)-1H-пиразол-1-ил]бензоламина

Смесь 1-(2,6-дифтор-4-нитрофенил)-3-трифторметил-1H-пиразола (т.е. продукта стадии А; 2,39 г, 8,15 ммоль) и дигидрата хлорида олова(II) (9,33 г, 41,3 ммоль) в этаноле

(173 мл) нагревали с обратным холодильником в течение 2 часов. Реакционную смесь концентрировали при пониженном давлении, и остаток растворяли в этилацетате и после этого промывали 1 н водным гидроксидом натрия, а затем водой. Органический слой сушили (MgSO_4), фильтровали и концентрировали при пониженном давлении.

Остаток очищали с помощью жидкостной хроматографии среднего давления на силикагеле с элюированием 0-100% этилацетата в гексанах с получением титульного соединения (2,00 г).

^1H ЯМР δ 7,59 (s, 1H), 6,69 (d, 1H), 6,29 (m, 2H), 4,12 (br s, 2H).

Стадия С: получение 1-(4-бром-2,6-дифторфенил)-3-(трифторметил)-1H-пиразола
К раствору бромида меди(II) (1,87 г, 8,36 ммоль) в ацетонитриле (20 мл) при 5°C добавляли 3,5-дифтор-4-[3-(трифторметил)-1H-пиразол-1-ил]бензоламин (т.е. продукт стадии В; 2,00 г, 8,00 ммоль), а затем трет-бутил нитрит (1,37 г, 14,0 ммоль) по каплям в течение нескольких минут. Обеспечивали возможность медленного нагревания реакционной смеси до комнатной температуры в течение ночи. Добавляли избыток 1 н HCl и смесь затем фильтровали через подушку из диатомитового вспомогательного фильтрующего материала Celite®. Фильтрат экстрагировали этилацетатом, сушили (MgSO_4) и концентрировали при пониженном давлении. Остаток очищали с помощью жидкостной хроматографии среднего давления на силикагеле с элюированием 0-40% этилацетата в гексанах. Полученное в результате твердое вещество затем растирали с 1-хлорбутаном, а потом сушили на воздухе с получением титульного соединения (0,98 г).

^1H ЯМР δ 7,69 (s, 1H), 7,31 (m, 2H), 6,76 (d, 1H).

Стадия D: получение 3',5'-дифтор-4'-[3-(трифторметил)-1H-пиразол-1-ил][1,1'-бифенил]-2-амина

Смесь 1-(4-бром-2,6-дифторфенил)-3-(трифторметил)-1H-пиразола (т.е. продукта стадии С; 1,83 г, 5,6 ммоль), В-(2-аминофенил)бороновой кислоты (0,90 г, 6,58 ммоль), карбоната натрия (2,07 г, 19,5 ммоль) и дихлорбис(трифенилфосфин)палладия(II) (0,33 г, 0,76 ммоль) в 1,2-диметоксиэтаноле (46 мл) и воде (11 мл) нагревали при 85°C в течение 16 часов. Реакционную смесь затем концентрировали при пониженном давлении, и остаток очищали с помощью жидкостной хроматографии среднего давления на силикагеле с элюированием 0-100% этилацетата в гексанах с получением титульного соединения (1,02 г).

^1H ЯМР δ 7,75 (s, 1H), 7,22 (m, 3H), 7,12 (m, 1H), 6,86 (m, 1H), 6,78 (m, 2H), 3,78 (br s, 2H).

Стадия E: получение 2-хлор-N-[3',5'-дифтор-4'-[3-(трифторметил)-1H-пиразол-1-ил][1,1'-бифенил]-2-ил]-3-пиридинкарбоксамида

Смесь 3',5'-дифтор-4'-[3-(трифторметил)-1H-пиразол-1-ил][1,1'-бифенил]-2-амина (т.е. продукта стадии D; 0,17 г, 0,52 ммоль), 2-хлор-3-пиридинкарбонил хлорида (0,092 г, 0,52 ммоль) и триэтиламина (0,050 г, 0,52 ммоль) в дихлорметане (5 мл) перемешивали в течение 16 часов при комнатной температуре. Реакционную смесь затем концентрировали при пониженном давлении и остаток очищали с помощью жидкостной хроматографии среднего давления на силикагеле с элюированием 0-100% этилацетата в гексанах. Полученное в результате твердое вещество растирали с 1-хлорбутаном и гексанами с получением титульного соединения (0,090 г), соединения по настоящему изобретению.

^1H ЯМР δ 8,49 (br s, 1H), 8,26 (d, 1H), 8,15 (d, 1H), 8,03 (br s, 1H), 7,75 (br s, 1H), 7,53 (t,

1H), 7,36 (m, 3H), 7,20 (d, 2H), 6,78 (s, 1H).

ПРИМЕР СИНТЕЗА 2

Получение (3-дифторметил)-N-[3',5'-дифтор-4'-(1-метил-1H-пиразол-3-ил)][1,1'-бифенил]-2-ил]-1-метил-1H-пиразола (соединения 232)

- Стадия А: получение 1-(4-бром-2,6-дифторфенил)-3-(диметиламино)-2-пропен-1-она
 Смесь 1-(4-бром-2,6-дифторфенил)этанона (полученного в соответствии со способом, описанным в патентной публикации по РСТ WO 2004/72070; 4,56 г, 19,4 ммоль) и N,N-диметилацетамида диметилацетата (6,94 г, 58,2 ммоль) в толуоле (45 мл) нагревали с обратным холодильником в течение 16 часов. Реакционную смесь затем
 концентрировали при пониженном давлении, и остаток очищали с помощью жидкостной хроматографии среднего давления на силикагеле с элюированием 0-100% этилацетата в гексанах с получением титульного соединения (4,78 г).

¹H ЯМР δ 7,79 (br s, 1H), 7,11 (m, 2H), 5,31 (br s, 1H), 3,12 (br s, 3H), 2,89 (s, 3H).

Стадия В: получение 3-(4-бром-2,6-дифторфенил)-1-метил-1H-пиразола

- Смесь 1-(4-бром-2,6-дифторфенил)-3-(диметиламино)-2-пропен-1-она (т.е. продукта стадии А, 2,39 г, 8,24 ммоль) и метилгидразина (0,42 г, 9,05 ммоль) в метаноле (50 мл) перемешивали при комнатной температуре в течение ночи. Реакционную смесь затем концентрировали при пониженном давлении, и остаток очищали с помощью жидкостной хроматографии среднего давления на силикагеле с элюированием 0-100% этилацетата в гексанах с получением титульного соединения (0,86 г).

¹H ЯМР δ 7,59 (d, 1H), 7,23 (m, 2H), 6,38 (d, 1H), 3,78 (s, 3H).

Стадия С: получение (3-дифторметил)-N-[3',5'-дифтор-4'-(1-метил-1H-пиразол-3-ил)][1,1'-бифенил]-2-ил]-1-метил-1H-пиразола

- Смесь 3-(дифторметил)-1-метил-1H-пиразол-4-карбонила хлорида (полученного из коммерчески доступной 3-(дифторметил)-1-метил-1H-пиразол-4-карбоновой кислоты в соответствии с методикой, описанной в патентной заявке по РСТ WO 2008/053043; 0,16 г, 0,91 ммоль), 2-(4,4,5,5-тетраметил-1,3,2-диоксаборолан-2-ил)бензоламина (0,18 г, 0,83 ммоль) и карбоната цезия (0,54 г, 1,65 ммоль) в 1,2-диметоксиэтаноле (2,5 мл) перемешивали при комнатной температуре в течение ночи. К данной неочищенной реакционной смеси добавляли 3-(4-бром-2,6-дифторфенил)-1-метил-1H-пиразол (т.е. продукт стадии В; 0,25 г, 0,91 ммоль), дихлорбис(трифенилфосфин)палладий(II) (0,03 г, 0,04 ммоль), насыщенный водный карбонат натрия (0,6 мл) и дополнительный 1,2-диметоксиэтан (2,5 мл). Смесь затем нагревали до 85°C в течение 4 часов, охлаждали до комнатной температуры, разбавляли насыщенным соевым раствором и экстрагировали этилацетатом. Объединенные органические экстракты сушили (MgSO₄), концентрировали при пониженном давлении и очищали с помощью жидкостной хроматографии среднего давления на силикагеле с элюированием 0-100% этилацетата в гексанах с получением титульного соединения (0,26 г), соединения по настоящему изобретению.

¹H ЯМР δ 8,25 (d, 1H), 7,88 (br s, 1H), 7,61 (s, 1H), 7,47 (m, 1H), 7,28 (m, 3H), 7,06 (m, 2H), 6,62 (m, 1H), 6,43 (d, 1H), 3,95 (s, 3H), 3,82 (s, 3H).

ПРИМЕР СИНТЕЗА 3

- Получение 2-(трифторметил)-N-[2-[4-[3-(трифторметил)-1H-пиразол-1-ил]фенил]этил]бензамида (соединения 5)

Стадия А: получение N-[2-(4-бромфенил)этил]-2-(трифторметил)бензамида

К смеси 2-(трифторметил)бензоила хлорида (1,0 г, 5,3 ммоль) в дихлорметане (5 мл) добавляли по каплям раствор триэтиламина (0,41 г, 4,0 ммоль) и 4-бромфенэтиламина

(0,80 г, 4,0 ммоль) в дихлорметане (5 мл). Полученную в результате смесь перемешивали при комнатной температуре в течение ночи. Реакционную смесь затем разбавляли дихлорметаном и экстрагировали 1 н водной соляной кислотой. Водную фазу разделяли и экстрагировали с помощью дополнительного дихлорметана. Органические экстракты
 5 затем объединяли, сушили (MgSO_4), фильтровали и концентрировали при пониженном давлении. Неочищенный остаток очищали с помощью хроматографии на колонке с силикагелем с элюированием 0-100% этилацетата:гексана с получением титульного соединения (1,10 г) в виде белого твердого вещества.

^1H ЯМР δ 7,68 (d, 1H), 7,55 (m, 2H), 7,45 (m, 3H), 7,15 (m, 2H), 5,78 (br m, 1H), 3,70 (m, 2H), 2,90 (m, 2H).

Стадия В: получение 2-(трифторметил)-N-[2-[4-[3-(трифторметил)-1H-пиразол-1-ил]фенил]этил]бензамида

К смеси 3-(трифторметил)пиразола (0,12 г, 0,89 ммоль), N,N'-диметилциклогексан-1,2-диамина (0,05 г, 0,36 ммоль), йодида меди(I) (0,03 г, 0,18 ммоль) и карбоната калия
 15 (0,41 г, 3,0 ммоль) в диоксане (5 мл) добавляли N-[2-(4-бромфенил)этил]-2-(трифторметил)бензамид (т.е. продукт стадии А; 0,50 г, 1,3 ммоль). Полученную в результате смесь затем нагревали с обратным холодильником в течение ночи, охлаждали до комнатной температуры и распределяли между водой и этилацетатом. Слои
 20 разделяли, и водную фазу экстрагировали при помощи второй части этилацетата. Объединенные органические экстракты затем сушили (MgSO_4), фильтровали и концентрировали при пониженном давлении. Остаток очищали с помощью колоночной хроматографии на силикагеле с элюированием 0-20% этилацетата:гексана с получением титульного соединения (0,19 г), соединения по настоящему изобретению, в виде
 25 рыжевато-коричневого твердого вещества.

^1H ЯМР δ 7,96 (d, 1H), 7,67 (m, 3H), 7,53 (m, 2H), 7,44 (m, 1H), 7,35 (m, 2H), 6,71 (m, 1H), 5,85 (br m, 1H), 3,73 (m, 2H), 2,98 (m, 2H). MS 428 amu (AP^+).

ПРИМЕР СИНТЕЗА 4

Получение N-[2-[3-хлор-5-[(3-трифторметил)-1H-пиразол-1-ил]-2-пиридинил]этил]-
 30 2-(трифторметил)бензамида (соединения 85)

Стадия А: получение 5-бром-3-хлор-2-пиридинацетонитрила

К раствору 5-бром-2,3-дихлорпиридина (10,0 г, 0,044 моль) в N-метил-2-пирролидоне (70 мл) при 0°C добавляли гидроксид калия (5,4 г, 0,097 моль) и полученную в результате
 35 смесь нагревали до 70°C. С помощью шприца добавляли этилцианоацетат (5,65 мл, 0,53 моль) в течение 15 мин, и затем нагревание при 70°C продолжали в течение еще 3 часов. Доводили pH реакционной смеси до 2 путем осторожного добавления концентрированной водной соляной кислоты, и полученную в результате смесь
 40 нагревали при 130°C в течение 2 часов. Реакционную смесь охлаждали до 20°C, обрабатывали 1 н водным гидроксидом натрия (15-16 мл) и экстрагировали при помощи трех частей метил-трет-бутилового эфира (3×100 мл). Объединенные органические экстракты промывали водой, сушили (Na_2SO_4) и концентрировали при пониженном давлении с получением титульного соединения (6,0 г) в виде твердого вещества
 коричневого цвета, которое использовали без дополнительной очистки.

^1H ЯМР δ 8,60 (s, 1H), 7,79 (s, 1H), 4,01 (s, 2H).

Стадия В: получение 3-хлор-5-[3-(трифторметил)-1H-пиразол-1-ил]-2-пиридинацетонитрила

К раствору 5-бром-3-хлор-2-пиридинацетонитрила (т.е. продукта стадии А; 6,0 г,

0,025 моль) в 1,4-диоксане (50 мл) добавляли 3-(трифторметил)-1Н-пиразол (3,74 г, 0,027 моль), йодид меди(I) (0,49 г, 0,0025 моль), карбонат калия (13,8 г, 0,1 моль) и транс-N,N'-диметил-1,2-циклогександиамин (1,42 г, 0,01 моль) в атмосфере аргона при комнатной температуре и полученную в результате смесь нагревали при 100°C в течение 16 часов.

Охлажденную реакционную смесь разбавляли ледяной водой и экстрагировали дихлорметаном (2×50 мл). Объединенные органические экстракты сушили (Na₂SO₄) и концентрировали при пониженном давлении. Остаток очищали с помощью хроматографии на силикагеле с элюированием этилацетатом-гексаном (4:6) с получением титульного соединения (5,0 г) в виде светло-желтого твердого вещества.

¹H ЯМР δ 8,60 (s, 1H), 8,25 (d, 1H), 7,79 (s, 1H), 7,44 (m, 1H), 6,80 (d, 1H), 4,10 (s, 2H).

Стадия С: получение 3-хлор-5-[3-(трифторметил)-1Н-пиразол-1-ил]-2-пиридинэтанамин

Раствор 3-хлор-5-[3-(трифторметил)-1Н-пиразол-1-ил]-2-пиридинацетонитрила (т.е. продукта стадии В; 5,0 г, 0,017 моль) в метаноле (50 мл) встряхивали в аппарате для гидрогенизации Парра в присутствии никеля Ренея (5,0 г) и при давлении водорода 50 фунтов/кв. дюйм (345 кПа) при комнатной температуре в течение 2 часов. Смесь фильтровали через подушку из диатомитового вспомогательного фильтрующего материала Celite®, и фильтровальную подушку промывали дихлорметаном. Фильтрат концентрировали при пониженном давлении с получением титульного соединения (2,0 г), которое использовали без дополнительной очистки.

Стадия D: получение N-[2-[3-хлор-5-[(3-трифторметил)-1Н-пиразол-1-ил]-2-пиридинил]этил]-2-(трифторметил)бензамида

К раствору 3-хлор-5-[3-(трифторметил)-1Н-пиразол-1-ил]-2-пиридинэтанамин (т.е. продукта стадии С; 200 мг, 0,68 ммоль) в дихлорметане (5 мл) при 0°C добавляли триэтиламин (0,14 мл, 1,02 ммоль). Полученную в результате смесь перемешивали в течение 10 мин, затем при 0°C медленно добавляли 2-(трифторметил)бензоила хлорид (156 мг, 0,74 ммоль), и смесь перемешивали при комнатной температуре в течение 16 часов. Ледяную воду добавляли к смеси, слои разделяли, и водный слой экстрагировали дихлорметаном (2×). Объединенные органические слои сушили (Na₂SO₄) и концентрировали при пониженном давлении. Остаток очищали с помощью хроматографии на силикагеле с элюированием этилацетатом-гексаном (8:2) с получением титульного соединения (130 мг, 41%), соединения по настоящему изобретению, в виде белого твердого вещества, mp 118-120°C.

¹H ЯМР δ 8,76 (d, 1H), 8,13 (d, 1H), 7,96 (s, 1H), 7,66 (d, 2H), 7,57 (t, 2H), 6,77 (s, 1H), 6,66 (br s, 1H), 4,01 (q, 2H), 3,27 (t, 2H). MS (AP⁺) 463 amu.

ПРИМЕР СИНТЕЗА 5

Получение N-[2-[2-хлор-4-[3-(трифторметил)-1Н-пиразол-1-ил]фенил]этил]-3-(трифторметил)-2-пиридинкарбоксамида (соединения 40)

Стадия А: получение 2-хлор-4-[3-(трифторметил)-1Н-пиразол-1-ил]бензальдегида

Смесь 2-хлор-4-фторбензальдегида (5,0 г, 31,5 ммоль), 3-(трифторметил)пиразола (4,28 г, 31,5 ммоль) и карбоната калия (6,53 г, 47,3 ммоль) в безводном N,N'-диметилформамиде (40 мл) перемешивали в течение 2 часов при 110°C. Реакционную смесь охлаждали до 0°C, выливали в ледяную воду (500 мл) и перемешивали в течение 15 мин. Образовавшийся осадок фильтровали и сушили при пониженном давлении с получением титульного соединения (8,1 г), которое использовали без дополнительной очистки.

^1H ЯМР δ 10,4 (s, 1H), 8,00 (m, 2H), 7,85 (d, 1H), 7,77 (m, 1H), 6,70 (d, 1H). MS (AP^+) 275 amu.

Стадия В: получение 1-[3-хлор-4-(2-нитроэтил)фенил]-3-(трифторметил)-1H-пиразола

К раствору 2-хлор-4-[3-(трифторметил)-1H-пиразол-1-ил]бензальдегида (т.е. продукта стадии А; 6,0 г, 0,025 моль) в уксусной кислоте (24 мл) добавляли ацетат аммония (5,6 г, 73 ммоль) и полученную в результате смесь перемешивали в течение 15 мин при 0°C. Затем добавляли нитрометан (12,5 г, 204 ммоль) и смесь перемешивали при 80°C в течение 2 часов. Реакционную смесь выливали в ледяную воду и экстрагировали этилацетатом (100 мл). Водный слой экстрагировали этилацетатом (2×250 мл), и объединенные органические слои промывали насыщенным соевым раствором (200 мл), сушили (Na_2SO_4) и концентрировали при пониженном давлении. Остаток очищали с помощью колоночной флэш-хроматографии на силикагеле с элюированием 30% этилацетата в гексанах с получением титульного соединения (7,1 г).

^1H ЯМР δ 8,30 (d, 1H), 7,90 (d, 1H), 7,80 (d, 1H), 7,60 (m, 2H), 7,55 (d, 1H), 6,70 (d, 1H).

Стадия С: получение 2-хлор-4-[3-(трифторметил)-1H-пиразол-1-ил]бензолэтанамин гидрохлорида (1:1)

К охлажденному (0°C) раствору борогидрида натрия (238,6 мг, 6,28 ммоль) в безводном тетрагидрофуране (8 мл) при 0°C добавляли по каплям диэтилэфират трифторида бора (1,13 г, 7,93 ммоль). Полученный в результате раствор затем перемешивали в течение 10 мин при 0°C и в течение 15 мин при комнатной температуре. Раствор 1-[3-хлор-4-(2-нитроэтил)фенил]-3-(трифторметил)-1H-пиразола (т.е. продукта стадии В; 420 мг, 1,32 ммоль) в безводном тетрагидрофуране (5,2 мл) добавляли по каплям посредством канюли и полученную в результате смесь нагревали с обратным холодильником в течение 7,5 ч, а затем обеспечивали возможность ее охлаждения до комнатной температуры. Добавляли по каплям воду (17 мл), а затем 1 н соляную кислоту (17 мл). Реакционную смесь концентрировали при пониженном давлении, и остаток растирали с петролевым эфиром с получением титульного соединения (320 мг).

^1H ЯМР δ 8,80 (d, 1H), 8,15 (br s, 2H), 1H), 8,00 (s, 1H), 7,80 (d, 1H), 7,60 (d, 1H), 7,00 (d, 1H), 3,40-3,60 (m, 4H). MS (AP^+) 291 amu.

Стадия D: получение N-[2-[2-хлор-4-[3-(трифторметил)-1H-пиразол-1-ил]фенил]этил]-3-(трифторметил)-2-пиридинкарбоксамида

К раствору 2-хлор-4-[3-(трифторметил)-1H-пиразол-1-ил]бензолэтанамин гидрохлорида (1:1) (т.е. продукта стадии С; 300 мг, 1,11 ммоль), N-(3-диметиламинопропил)-N'-этилкарбодиимида (297 мг, 1,66 ммоль), 1-гидроксibenзотриазола (212 мг, 1,66 ммоль) и N,N-диизопропилэтиламина (0,9 мл, 5,55 ммоль) в дихлорметане (15 мл) добавляли 3-(трифторметил)пиридин-2-карбоновую кислоту (198 мг, 1,21 ммоль) и полученную в результате смесь перемешивали в течение 12 часов. Реакционную смесь промывали водой и насыщенным соевым раствором, сушили (Na_2SO_4) и концентрировали при пониженном давлении. Остаток очищали с помощью колоночной флэш-хроматографии на силикагеле с элюированием 50% этилацетата в гексанах с получением титульного соединения (210 мг) в виде коричневого твердого вещества.

^1H ЯМР δ 8,60 (d, 1H), 8,10 (s, 1H), 7,80 (s, 1H), 7,70 (m, 2H), 7,40 (m, 2H), 7,30 (d, 1H), 6,80 (d, 1H), 3,70 (m, 2H), 3,10 (t, 2H). MS (AP^+) 464 amu.

ПРИМЕР СИНТЕЗА 6

Получение N-[2-[2-хлор-4-[3-(трифторметил)-1H-пиразол-1-ил]фенил]-2,2-дифторэтил]-3-(трифторметил)-2-пиридинкарбоксамида (соединения 150)

Стадия А: получение 1-(3-хлор-4-йодфенил)-3-(трифторметил)-1H-пиразола

5 К раствору 2-хлор-4-фтор-1-йод-бензола (3,6 г, 14,3 ммоль) и 3-трифторметил-1H-пиразола (1,9 г, 14,4 ммоль) в N,N-диметилформамиде (40 мл) добавляли карбонат калия (2,4 г, 17,2 ммоль) и полученную в результате смесь нагревали при 135°C в течение 12 часов. Реакционную смесь охлаждали до комнатной температуры, выливали в холодную воду (80 мл) и экстрагировали дихлорметаном (2×40 мл). Объединенные органические экстракты сушили (Na₂SO₄) и концентрировали при пониженном давлении. Остаток очищали с помощью колоночной флэш-хроматографии на силикагеле с элюированием 10% этилацетата в гексанах с получением титульного соединения (4,2 г) в виде белого твердого вещества.

15 ¹H ЯМР δ 10,4 (s, 1H), 7,88 (m, 2H), 7,80 (d, 1H), 7,27 (m, 1H), 6,68 (d, 1H). MS (AP⁺) 373 amu.

Стадия В: получение 2-хлор-α,α-дифтор-4-[3-трифторметил)-1H-пиразол-1-ил] этилбензоацетата

Смесь этилбромдифторацетата (4 г, 20,1 ммоль) и медного порошка (2,5 г, 40,3 ммоль) в диметилсульфоксиде (10 мл) перемешивали при комнатной температуре в течение 1 часов. Добавляли 1-(3-хлор-4-йодфенил)-3-(трифторметил)-1H-пиразол (т.е. продукт стадии А; 3,75 г, 10 ммоль) и перемешивание при комнатной температуре продолжали в течение 12 часов. Добавляли насыщенный водный хлорид аммония (25 мл) и полученный в результате раствор экстрагировали дихлорметаном (2×25 мл). Объединенные органические экстракты промывали водой и насыщенным соевым раствором, сушили (MgSO₄) и концентрировали при пониженном давлении. Полученный в результате неочищенный продукт очищали с помощью колоночной флэш-хроматографии на силикагеле с элюированием 15% этилацетата в гексанах с получением титульного соединения (2,2 г) в виде бесцветного масла.

30 ¹H ЯМР δ 7,94 (d, 1H), 7,83 (s, 1H), 7,78 (d, 1H), 7,65 (d, 1H), 6,70 (d, 1H), 4,30 (q, 2H), 1,25 (t, 3H). MS (AP⁺) 370 amu.

Стадия С: получение 2-хлор-β,β-дифтор-4-[3-трифторметил)-1H-пиразол-1-ил] бензолэтанамин гидрохлорида (1:1)

35 К раствору этил-2-хлор-α,α-дифтор-4-[3-трифторметил)-1H-пиразол-1-ил] бензоацетата (т.е. продукта стадии В; 500 мг, 1,35 ммоль) в метаноле добавляли по каплям аммиак в метаноле (2 М, 3,37 мл, 6,75 ммоль) и полученную в результате смесь перемешивали в течение 24 часов при комнатной температуре. Растворитель удаляли при пониженном давлении с получением неочищенного 2-хлор-α,α-дифтор-4-[3-трифторметил)-1H-пиразол-1-ил]бензоацетамида, который использовали без дополнительной очистки.

40 ¹H ЯМР δ 7,92 (d, 1H), 7,83 (s, 1H), 7,80 (d, 1H), 7,65 (d, 1H), 6,70 (d, 1H), 6,49 (br s, 1H), 5,91 (br s, 1H). MS (AP⁺) 341 amu.

Неочищенный 2-хлор-α,α-дифтор-4-[3-трифторметил)-1H-пиразол-1-ил] бензоацетамид растворяли в тетрагидрофуране и к полученному в результате раствору добавляли медленно боран в тетрагидрофуране (1 М, 3,4 мл, 3,34 ммоль). Реакционную смесь нагревали при 70°C в течение 12 часов. Реакционную смесь охлаждали до комнатной температуры, гасили водой (10 мл) и экстрагировали дихлорметаном (2×10

мл). Объединенные органические экстракты промывали насыщенным соевым раствором (15 мл), сушили (MgSO_4) и концентрировали при пониженном давлении. К остатку добавляли 4 М соляную кислоту в диоксане (1 мл). Остаточное твердое вещество растирали с гексанами, фильтровали и сушили при пониженном давлении с получением титульного соединения (340 мг) в виде твердого вещества.

^1H ЯМР δ 8,92 (d, 1H), 7,83 (s, 1H), 8,77 (br s, 2H), 8,22 (s, 1H), 8,07 (d, 1H), 7,85 (d, 1H), 7,13 (d, 1H), 3,83 (t, 2H). MS (AP^+) 327 amu.

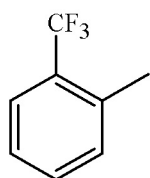
Стадия D: получение N-[2-[2-хлор-4-[(3-трифторметил)-1H-пиразол-1-ил]фенил]-2,2-дифторэтил]-3-(трифторметил)-2-пиридинкарбоксамид

К раствору 2-хлор- β,β -дифтор-4-[3-трифторметил]-1H-пиразол-1-ил]бензолэтанамин гидрохлорида (1:1) (т.е. продукта стадии C; 150 мг, 0,46 ммоль), N-(3-диметиламинопропил)-N'-этилкарбодиимида (132 мг, 1,66 ммоль), 1-гидроксibenзотриазола (93 мг, 1,55 ммоль) и N,N-диизопропилэтиламина (0,23 мл, 5,55 ммоль) в дихлорметане добавляли 3-(трифторметил)пиридин-2-карбоновую кислоту (105 мг, 0,6 ммоль) и полученную в результате смесь перемешивали в течение 12 часов. Реакционную смесь промывали водой и насыщенным соевым раствором, сушили (Na_2SO_4) и концентрировали при пониженном давлении. Остаток очищали с помощью колоночной флэш-хроматографии на силикагеле с элюированием 15% этилацетата в гексанах с получением титульного соединения (160 мг), соединения по настоящему изобретению, в виде белого твердого вещества.

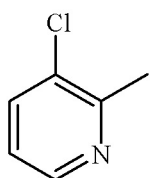
^1H ЯМР 8,67 (d, 1H), 8,09 (d, 1H), 8,00 (t, 1H), 7,91 (d, 1H), 7,82 (d, 1H), 7,68 (d, 1H), 7,60 (dd, 1H), 7,52 (dd, 1H), 4,29 (td, 2H). MS (AP^+) 500 amu.

С помощью методик, описанных в данном документе, вместе со способами, известными из уровня техники, можно получать соединения, раскрытые в следующих таблицах. Далее приведены сокращения, применяемые в таблицах. Me означает метил, Et означает этил, Ph означает фенил, MeO или OMe означает метокси, EtO означает этокси, и CN означает циано. " $(\text{R}^2)_n$ " представляет собой H" означает, что n равняется 0, а кольцо, содержащее G, не замещено R^2 . Структуры отдельных заместителей "A" в таблицах изображены в приложении 4.

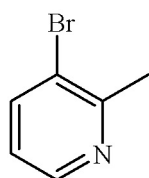
Приложение 4



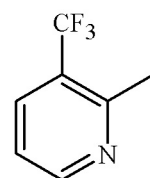
A-1a



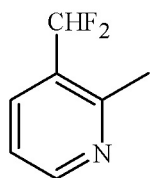
A-1b



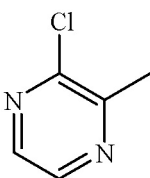
A-1c



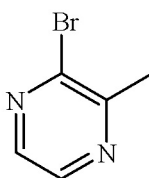
A-1d



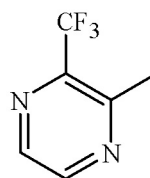
A-1e



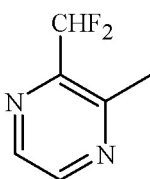
A-1f



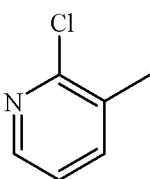
A-1g



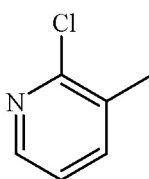
A-1h



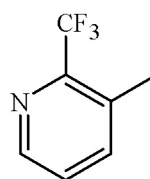
A-1i



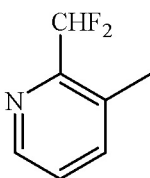
A-1j



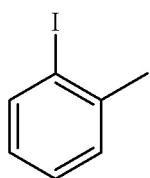
A-1k



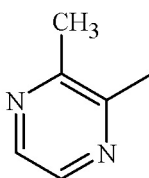
A-1l



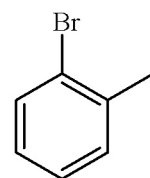
A-1m



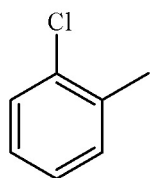
A-1n



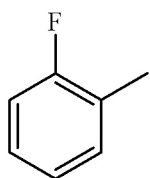
A-1o



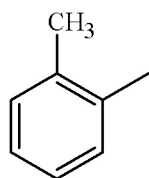
A-1p



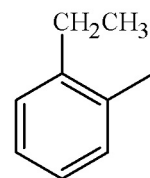
A-1q



A-1r



A-1s



A-1t

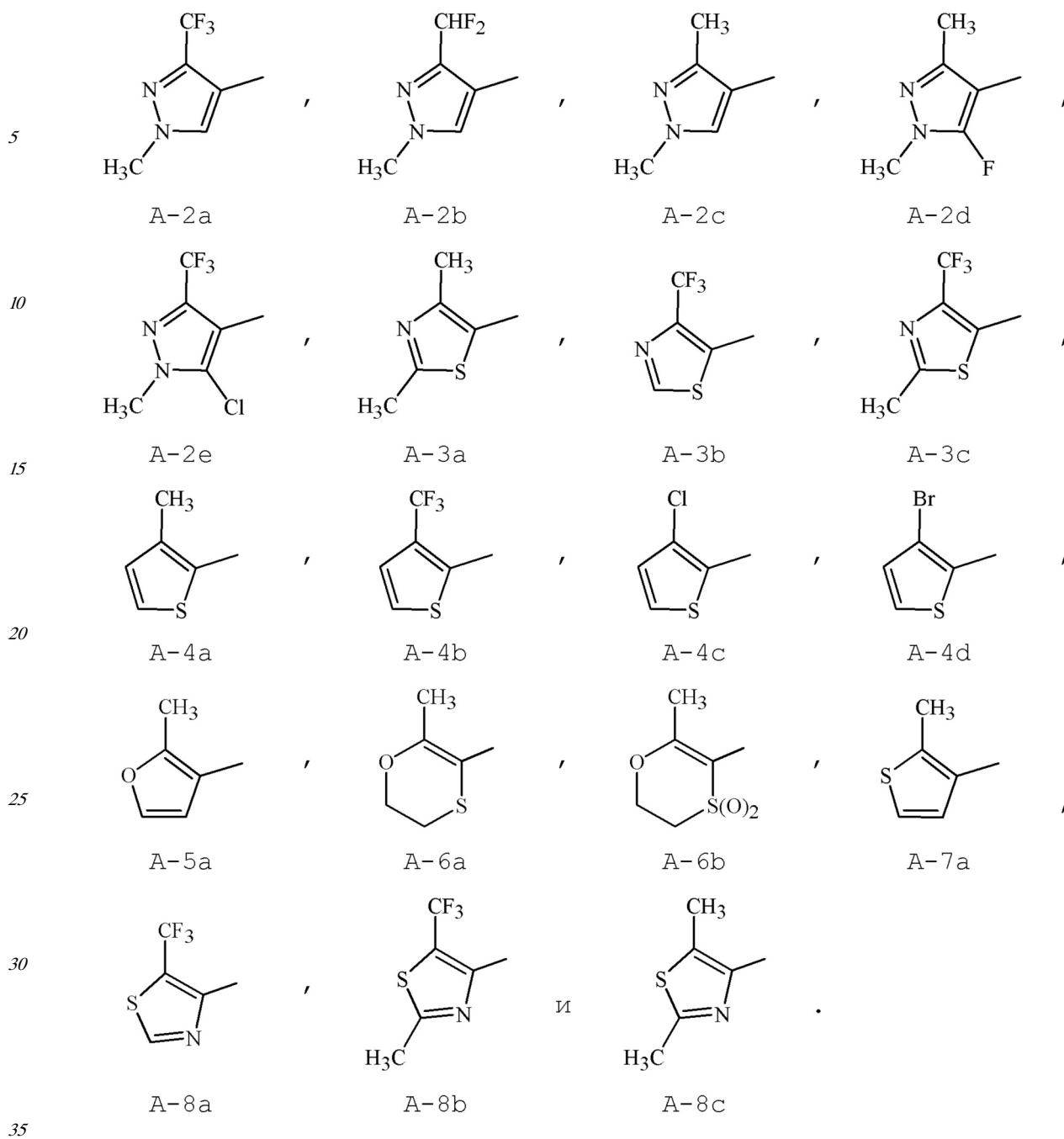
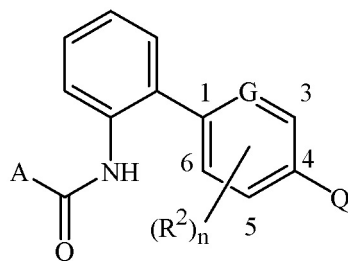


Таблица 1

40



45

A представляет собой A-1a, $(R^2)_n$ представляет собой H, и G представляет собой CH.

Q	Q	Q
3-CF ₃ -1H-пиразол-1-ил	3-Ме-1H-пиразол-1-ил	3-F-1H-пиразол-1-ил
3-Br-1H-пиразол-1-ил	4-CF ₃ -1H-пиразол-1-ил	4-Ме-1H-пиразол-1-ил

5	4-F-1H-пиразол-1-ил	4-Br-1H-пиразол-1-ил	5-CF ₃ -1H-пиразол-1-ил
	5-Me-1H-пиразол-1-ил	5-F-1H-пиразол-1-ил	5-Br-1H-пиразол-1-ил
	3-CHF ₂ -1H-пиразол-1-ил	3-Et-1H-пиразол-1-ил	3-Cl-1H-пиразол-1-ил
	3-I-1H-пиразол-1-ил	4-CHF ₂ -1H-пиразол-1-ил	4-Et-1H-пиразол-1-ил
	4-Cl-1H-пиразол-1-ил	4-I-1H-пиразол-1-ил	5-CHF ₂ -1H-пиразол-1-ил
10	5-Et-1H-пиразол-1-ил	5-Cl-1H-пиразол-1-ил	3-I-1H-пиразол-1-ил
	3-MeO-1H-пиразол-1-ил	3-CN-1H-пиразол-1-ил	3-CF ₃ O-1H-пиразол-1-ил
	3-CHF ₂ O-1H-пиразол-1-ил	4-MeO-1H-пиразол-1-ил	4-CN-1H-пиразол-1-ил
	4-CF ₃ O-1H-пиразол-1-ил	4-CHF ₂ O-1H-пиразол-1-ил	5-CF ₃ O-1H-пиразол-1-ил
	5-CN-1H-пиразол-1-ил	5-CF ₃ O-1H-пиразол-1-ил	5-CHF ₂ O-1H-пиразол-1-ил
15	3-MeO(O=C)-1H-пиразол-1-ил	3-Ph-1H-пиразол-1-ил	3,5-ди-Me-1H-пиразол-1-ил
	3,5-ди-F-1H-пиразол-1-ил	4-MeO(O=C)-1H-пиразол-1-ил	4-Ph-1H-пиразол-1-ил
	3,5-ди-CF ₃ -1H-пиразол-1-ил	3,5-ди-Cl-1H-пиразол-1-ил	5-MeO(O=C)-1H-пиразол-1-ил
	5-Ph-1H-пиразол-1-ил	3,5-ди-CHF ₂ -1H-пиразол-1-ил	3,5-ди-Br-1H-пиразол-1-ил
	3-CF ₃ -5-Me-1H-пиразол-1-ил	3,4-ди-Me-1H-пиразол-1-ил	3,4-ди-CF ₃ -1H-пиразол-1-ил
20	3,4-ди-Br-1H-пиразол-1-ил	3,4-ди-Cl-1H-пиразол-1-ил	1H-пиразол-1-ил
	3-Me-1H-[1,2,4]триазол-1-ил	3-CF ₃ -1H-[1,2,4]триазол-1-ил	3-CHF ₂ -1H-[1,2,4]триазол-1-ил
	3-F-1H-[1,2,4]триазол-1-ил	3-Cl-1H-[1,2,4]триазол-1-ил	3-Br-1H-[1,2,4]триазол-1-ил
	3,5-ди-Me-1H-[1,2,4]триазол-1-ил	3,5-ди-CF ₃ -1H-[1,2,4]триазол-1-ил	3,5-ди-CHF ₂ -1H-[1,2,4]триазол-1-ил
	3,5-ди-Cl-1H-[1,2,4]триазол-1-ил	3,5-ди-Br-1H-[1,2,4]триазол-1-ил	3-Ph-1H-[1,2,4]триазол-1-ил
25	1H-[1,2,4]триазол-1-ил	4-Me-2H-[1,2,3]триазол-2-ил	4-CF ₃ -2H-[1,2,3]триазол-2-ил
	4-CHF ₂ -2H-[1,2,3]триазол-2-ил	4-F-2H-[1,2,3]триазол-2-ил	4-Cl-2H-[1,2,3]триазол-2-ил
	4-Br-2H-[1,2,3]триазол-2-ил	4-Ph-2H-[1,2,3]триазол-2-ил	4,5-ди-Me-2H-[1,2,3]триазол-2-ил
	4,5-ди-CF ₃ -2H-[1,2,3]триазол-2-ил	4,5-ди-Cl-2H-[1,2,3]триазол-2-ил	4,5-ди-Br-2H-[1,2,3]триазол-2-ил
	2H-[1,2,3]триазол-2-ил	4-Me-1H-[1,2,3]триазол-1-ил	4-CF ₃ -1H-[1,2,3]триазол-1-ил
30	4-CHF ₂ -1H-[1,2,3]триазол-1-ил	4-F-1H-[1,2,3]триазол-1-ил	4-Cl-1H-[1,2,3]триазол-1-ил
	4-Br-1H-[1,2,3]триазол-1-ил	4-Ph-1H-[1,2,3]триазол-1-ил	1H-[1,2,3]триазол-1-ил
	3-Me-1H-пиррол-1-ил	3-CF ₃ -1H-пиррол-1-ил	3-CHF ₂ -1H-пиррол-1-ил
	3,4-ди-Me-1H-пиррол-1-ил	2,4-ди-Me-1H-пиррол-1-ил	3,4-ди-CF ₃ -1H-пиррол-1-ил
	2,4-ди-CF ₃ -1H-пиррол-1-ил	3,4-ди-Br-1H-пиррол-1-ил	3,4-ди-Cl-1H-пиррол-1-ил
35	1H-пиррол-1-ил	1-Me-1H-пиразол-3-ил	1-CF ₃ -1H-пиразол-3-ил
	1-Et-1H-пиразол-3-ил	1-i-Pr-1H-пиразол-3-ил	1-(F ₃ CCH ₂)-1H-пиразол-3-ил
	1-Ph-1H-пиразол-3-ил	1,4-ди-Me-1H-пиразол-3-ил	1-Me-4-CF ₃ -1H-пиразол-3-ил
	1-Me-1H-пиразол-4-ил	1-CF ₃ -1H-пиразол-4-ил	1-Et-1H-пиразол-4-ил
	1-i-Pr-1H-пиразол-4-ил	1-(F ₃ CCH ₂)-1H-пиразол-4-ил	1-Ph-1H-пиразол-4-ил
40	1,3-ди-Me-1H-пиразол-4-ил	1-Me-3-CF ₃ -1H-пиразол-4-ил	3-Me-1-CF ₃ -1H-пиразол-4-ил
	1-Me-1H-[1,2,4]триазол-3-ил	1-CF ₃ -1H-[1,2,4]триазол-3-ил	1-Et-1H-[1,2,4]триазол-3-ил
	1-i-Pr-1H-[1,2,4]триазол-3-ил	1-Ph-1H-[1,2,4]триазол-3-ил	5-Ph-4,5-дигидро-изоксазол-3-ил
	5-CF ₃ -2,4-дигидро-3-оксопиразол-1-ил	5-Me-2,4-дигидро-3-оксопиразол-1-ил	

Настоящее раскрытие также включает таблицы 2-1728, каждая из которых построена так же, как таблица 1 выше, за исключением того, что строка заголовка в таблице 1 (т.е. “А представляет собой А-1а, (R²)_n представляет собой Н, и G представляет собой СН”) заменена соответствующей строкой заголовка, показанной ниже. Например, в таблице 2 строкой заголовка является “А представляет собой А-1а, (R²)_n представляет собой 3-F, и G представляет собой СН”, а Q определен в таблице 1 выше. Таким образом, в первой записи в таблице 2, в частности, раскрывается N-[3'-фтор-4'-[3-(трифторметил)-1H-пиразол-1-ил][1,1'-бифенил]-2-ил]-2-(трифторметил)бензамид. Таблицы 3-1728

построены подобным образом.

ТАБЛИЦЫ 2-1728			
Таблица	Заглавие строки	Таблица	Заглавие строки
5	2	866	A представляет собой A-1a, (R ²) _n представляет собой 3-F, и G представляет собой CH.
	3	867	A представляет собой A-1a, (R ²) _n представляет собой 3,5-di-F, и G представляет собой CH.
	4	868	A представляет собой A-1a, (R ²) _n представляет собой 3-Cl, и G представляет собой CH.
10	5	869	A представляет собой A-1a, (R ²) _n представляет собой 3,5-di-Cl, и G представляет собой CH.
	6	870	A представляет собой A-1a, (R ²) _n представляет собой 3-Br, и G представляет собой CH.
	7	871	A представляет собой A-1a, (R ²) _n представляет собой 3,5-di-Br, и G представляет собой CH.
15	8	872	A представляет собой A-1a, (R ²) _n представляет собой 3-Me, и G представляет собой CH.
	9	873	A представляет собой A-1a, (R ²) _n представляет собой 3,5-di-Me, и G представляет собой CH.
	10	874	A представляет собой A-1a, (R ²) _n представляет собой 3-CF ₃ , и G представляет собой CH.
20	11	875	A представляет собой A-1a, (R ²) _n представляет собой 3,5-di-CF ₃ , и G представляет собой CH.
	12	876	A представляет собой A-1a, (R ²) _n представляет собой 3-MeO, и G представляет собой CH.
	13	877	A представляет собой A-1a, (R ²) _n представляет собой 3,5-di-MeO, и G представляет собой CH.
25	14	878	A представляет собой A-1a, (R ²) _n представляет собой 3-CN, и G представляет собой CH.
	15	879	A представляет собой A-1a, (R ²) _n представляет собой 3,5-di-CN, и G представляет собой CH.
	16	880	A представляет собой A-1a, (R ²) _n представляет собой 3,6-di-F, и G представляет собой CH.
30	17	881	A представляет собой A-1a, (R ²) _n представляет собой 3,6-di-Cl, и G представляет собой CH.
	18	882	A представляет собой A-1a, (R ²) _n представляет собой 3,6-di-Br, и G представляет собой CH.
	19	883	A представляет собой A-1a, (R ²) _n представляет собой 3,6-di-Me, и G представляет собой CH.
35	20	884	A представляет собой A-1a, (R ²) _n представляет собой 3,6-di-CF ₃ , и G представляет собой CH.
	21	885	A представляет собой A-1a, (R ²) _n представляет собой 3,6-di-MeO, и G представляет собой CH.
	22	886	A представляет собой A-1a, (R ²) _n представляет собой 3,6-di-CN, и G представляет собой CH.
40	23	887	A представляет собой A-1a, (R ²) _n представляет собой 6-F, и G представляет собой CH.
	24	888	A представляет собой A-1a, (R ²) _n представляет собой 6-Cl, и G представляет собой CH.
45			

[illegible]

[illegible]

[illegible]

[illegible]

[illegible]

[illegible]

[illegible]

[illegible]

[illegible]

[illegible]

[illegible]

[illegible]

[illegible]

[illegible]

[illegible]

[illegible]

[illegible]

[illegible]

[illegible]

[illegible]

[illegible]

[illegible]

[illegible]

[illegible]

[illegible]

[illegible]

[illegible]

[illegible]

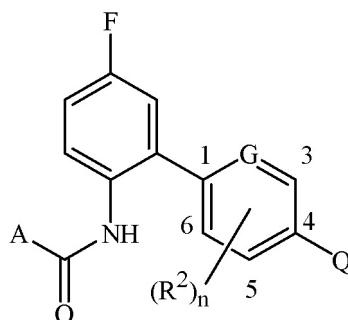
[illegible]

5	850	A представляет собой A-1n, (R ²) _n представляет собой 3,6-di-Br, и G представляет собой CH.	1714	A представляет собой A-4d, (R ²) _n представляет собой 3,5-di-CN, и G представляет собой N.
	851	A представляет собой A-1n, (R ²) _n представляет собой 3,6-di-Me, и G представляет собой CH.	1715	A представляет собой A-4d, (R ²) _n представляет собой 3,6-di-F, и G представляет собой N.
	852	A представляет собой A-1n, (R ²) _n представляет собой 3,6-di-CF ₃ , и G представляет собой CH.	1716	A представляет собой A-4d, (R ²) _n представляет собой 3,6-di-Cl, и G представляет собой N.
	853	A представляет собой A-1n, (R ²) _n представляет собой 3,6-di-MeO, и G представляет собой CH.	1717	A представляет собой A-4d, (R ²) _n представляет собой 3,6-di-Br, и G представляет собой N.
	854	A представляет собой A-1n, (R ²) _n представляет собой 3,6-di-CN, и G представляет собой CH.	1718	A представляет собой A-4d, (R ²) _n представляет собой 3,6-di-Me, и G представляет собой N.
10	855	A представляет собой A-1n, (R ²) _n представляет собой 6-F, и G представляет собой CH.	1719	A представляет собой A-4d, (R ²) _n представляет собой 3,6-di-CF ₃ , и G представляет собой N.
	856	A представляет собой A-1n, (R ²) _n представляет собой 6-Cl, и G представляет собой CH.	1720	A представляет собой A-4d, (R ²) _n представляет собой 3,6-di-MeO, и G представляет собой N.

15	857	A представляет собой A-1n, (R ²) _n представляет собой 6-Br, и G представляет собой CH.	1721	A представляет собой A-4d, (R ²) _n представляет собой 3,6-di-CN, и G представляет собой N.
	858	A представляет собой A-1n, (R ²) _n представляет собой 6-Me, и G представляет собой CH.	1722	A представляет собой A-4d, (R ²) _n представляет собой 6-F, и G представляет собой N.
	859	A представляет собой A-1n, (R ²) _n представляет собой 6-CF ₃ , и G представляет собой CH.	1723	A представляет собой A-4d, (R ²) _n представляет собой 6-Cl, и G представляет собой N.
20	860	A представляет собой A-1n, (R ²) _n представляет собой 6-MeO, и G представляет собой CH.	1724	A представляет собой A-4d, (R ²) _n представляет собой 6-Br, и G представляет собой N.
	861	A представляет собой A-1n, (R ²) _n представляет собой 6-CN, и G представляет собой CH.	1725	A представляет собой A-4d, (R ²) _n представляет собой 6-Me, и G представляет собой N.
	862	A представляет собой A-1n, (R ²) _n представляет собой 6-F, и G представляет собой C-F.	1726	A представляет собой A-4d, (R ²) _n представляет собой 6-CF ₃ , и G представляет собой N.
25	863	A представляет собой A-1n, (R ²) _n представляет собой 6-Cl, и G представляет собой C-Cl.	1727	A представляет собой A-4d, (R ²) _n представляет собой 6-MeO, и G представляет собой N.
	864	A представляет собой A-1n, (R ²) _n представляет собой 6-Br, и G представляет собой C-Br.	1728	A представляет собой A-4d, (R ²) _n представляет собой 6-CN, и G представляет собой N.

30	865	A представляет собой A-1n, (R ²) _n представляет собой 6-Me, и G представляет собой C-Me.		
----	-----	---	--	--

Таблица 1729

A представляет собой A-1a, (R²)_n представляет собой H, и G представляет собой CH.

Q	Q	Q
3-CF ₃ -1H-пиразол-1-ил	3-Me-1H-пиразол-1-ил	3-F-1H-пиразол-1-ил
3-Br-1H-пиразол-1-ил	4-CF ₃ -1H-пиразол-1-ил	4-Me-1H-пиразол-1-ил
4-F-1H-пиразол-1-ил	4-Br-1H-пиразол-1-ил	5-CF ₃ -1H-пиразол-1-ил
5-Me-1H-пиразол-1-ил	5-F-1H-пиразол-1-ил	5-Br-1H-пиразол-1-ил
3-CHF ₂ -1H-пиразол-1-ил	3-Et-1H-пиразол-1-ил	3-Cl-1H-пиразол-1-ил

5	3-1Н-пиразол-1-ил	4-CHF ₂ -1Н-пиразол-1-ил	4-Et-1Н-пиразол-1-ил
	4-Cl-1Н-пиразол-1-ил	4-1-1Н-пиразол-1-ил	5-CHF ₂ -1Н-пиразол-1-ил
	5-Et-1Н-пиразол-1-ил	5-Cl-1Н-пиразол-1-ил	3-1-1Н-пиразол-1-ил
	3-MeO-1Н-пиразол-1-ил	3-CN-1Н-пиразол-1-ил	3-CF ₃ O-1Н-пиразол-1-ил
	3-CHF ₂ O-1Н-пиразол-1-ил	4-MeO-1Н-пиразол-1-ил	4-CN-1Н-пиразол-1-ил
10	4-CF ₃ O-1Н-пиразол-1-ил	4-CHF ₂ O-1Н-пиразол-1-ил	5-CF ₃ O-1Н-пиразол-1-ил
	5-CN-1Н-пиразол-1-ил	5-CF ₃ O-1Н-пиразол-1-ил	5-CHF ₂ O-1Н-пиразол-1-ил
	3-MeO(O=)C-1Н-пиразол-1-ил	3-Ph-1Н-пиразол-1-ил	3,5-ди-Ме-1Н-пиразол-1-ил
	3,5-ди-F-1Н-пиразол-1-ил	4-MeO(O=)C-1Н-пиразол-1-ил	4-Ph-1Н-пиразол-1-ил
	3,5-ди-CF ₃ -1Н-пиразол-1-ил	3,5-ди-Cl-1Н-пиразол-1-ил	5-MeO(O=)C-1Н-пиразол-1-ил
15	5-Ph-1Н-пиразол-1-ил	3,5-ди-CHF ₂ -1Н-пиразол-1-ил	3,5-ди-Br-1Н-пиразол-1-ил
	3-CF ₃ -5-Ме-1Н-пиразол-1-ил	3,4-ди-Ме-1Н-пиразол-1-ил	3,4-ди-CF ₃ -1Н-пиразол-1-ил
	3,4-ди-Br-1Н-пиразол-1-ил	3,4-ди-Cl-1Н-пиразол-1-ил	1Н-пиразол-1-ил
	3-Ме-1Н-[1,2,4]триазол-1-ил	3-CF ₃ -1Н-[1,2,4]триазол-1-ил	3-CHF ₂ -1Н-[1,2,4]триазол-1-ил
	3-F-1Н-[1,2,4]триазол-1-ил	3-Cl-1Н-[1,2,4]триазол-1-ил	3-Br-1Н-[1,2,4]триазол-1-ил
20	3,5-ди-Ме-1Н-[1,2,4]триазол-1-ил	3,5-ди-CF ₃ -1Н-[1,2,4]триазол-1-ил	3,5-ди-CHF ₂ -1Н-[1,2,4]триазол-1-ил
	3,5-ди-Cl-1Н-[1,2,4]триазол-1-ил	3,5-ди-Br-1Н-[1,2,4]триазол-1-ил	3-Ph-1Н-[1,2,4]триазол-1-ил
	1Н-[1,2,4]триазол-1-ил	4-Ме-2Н-[1,2,3]триазол-2-ил	4-CF ₃ -2Н-[1,2,3]триазол-2-ил
	4-CHF ₂ -2Н-[1,2,3]триазол-2-ил	4-F-2Н-[1,2,3]триазол-2-ил	4-Cl-2Н-[1,2,3]триазол-2-ил
	4-Br-2Н-[1,2,3]триазол-2-ил	4-Ph-2Н-[1,2,3]триазол-2-ил	4,5-ди-Ме-2Н-[1,2,3]триазол-2-ил
25	4,5-ди-CF ₃ -2Н-[1,2,3]триазол-2-ил	4,5-ди-Cl-2Н-[1,2,3]триазол-2-ил	4,5-ди-Br-2Н-[1,2,3]триазол-2-ил
	2Н-[1,2,3]триазол-2-ил	4-Ме-1Н-[1,2,3]триазол-1-ил	4-CF ₃ -1Н-[1,2,3]триазол-1-ил
	4-CHF ₂ -1Н-[1,2,3]триазол-1-ил	4-F-1Н-[1,2,3]триазол-1-ил	4-Cl-1Н-[1,2,3]триазол-1-ил
	4-Br-1Н-[1,2,3]триазол-1-ил	4-Ph-1Н-[1,2,3]триазол-1-ил	1Н-[1,2,3]триазол-1-ил
	3-Ме-1Н-пиррол-1-ил	3-CF ₃ -1Н-пиррол-1-ил	3-CHF ₂ -1Н-пиррол-1-ил
30	3,4-ди-Ме-1Н-пиррол-1-ил	2,4-ди-Ме-1Н-пиррол-1-ил	3,4-ди-CF ₃ -1Н-пиррол-1-ил
	2,4-ди-CF ₃ -1Н-пиррол-1-ил	3,4-ди-Br-1Н-пиррол-1-ил	3,4-ди-Cl-1Н-пиррол-1-ил
	1Н-пиррол-1-ил	1-Ме-1Н-пиразол-3-ил	1-CF ₃ -1Н-пиразол-3-ил
	1-Et-1Н-пиразол-3-ил	1-і-Pr-1Н-пиразол-3-ил	1-(F ₃ CCH ₂)-1Н-пиразол-3-ил
	1-Ph-1Н-пиразол-3-ил	1,4-ди-Ме-1Н-пиразол-3-ил	1-Ме-4-CF ₃ -1Н-пиразол-3-ил
35	1-Ме-1Н-пиразол-4-ил	1-CF ₃ -1Н-пиразол-4-ил	1-Et-1Н-пиразол-4-ил
	1-і-Pr-1Н-пиразол-4-ил	1-(F ₃ CCH ₂)-1Н-пиразол-4-ил	1-Ph-1Н-пиразол-4-ил
	1,3-ди-Ме-1Н-пиразол-4-ил	1-Ме-3-CF ₃ -1Н-пиразол-4-ил	3-Ме-1-CF ₃ -1Н-пиразол-4-ил
	1-Ме-1Н-[1,2,4]триазол-3-ил	1-CF ₃ -1Н-[1,2,4]триазол-3-ил	1-Et-1Н-[1,2,4]триазол-3-ил
	1-і-Pr-1Н-[1,2,4]триазол-3-ил	1-Ph-1Н-[1,2,4]триазол-3-ил	5-Ph-4,5-дигидро-изоксазол-3-ил
	5-CF ₃ -2,4-дигидро-3-оксопиразол-1-ил	5-Ме-2,4-дигидро-3-оксопиразол-1-ил	

Настоящее раскрытие также включает таблицы 1730-2304, каждая из которых построена так же, как таблица 1729 выше, за исключением того, что строка заголовка в таблице 1729 (т.е. “А представляет собой А-1а, (R²)_n представляет собой Н, и G представляет собой СН”) заменена соответствующей строкой заголовка, показанной ниже. Например, в таблице 1730 строкой заголовка является “А представляет собой А-1а, (R²)_n представляет собой 3-F, и G представляет собой СН”, а Q определен в таблице 1 выше. Таким образом, в первой записи в таблице 1730, в частности, раскрывается N-[3',6-дифтор-4'-[3-(трифторметил)-1Н-пиразол-1-ил][1,1'-бифенил]-2-ил]-2-(трифторметил)бензамид. Таблицы 1731-2304 построены подобным образом.

ТАБЛИЦЫ 1730-2304

[illegible]

[illegible]

[illegible]

[illegible]

[illegible]

[illegible]

[illegible]

[illegible]

[illegible]

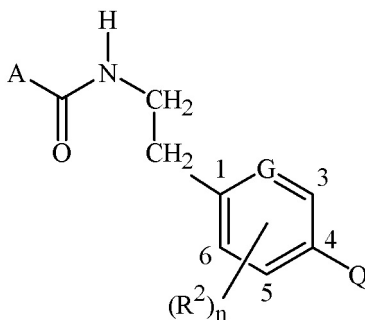
[illegible]

2003	A представляет собой A-1e, $(R^2)_n$ представляет собой 3,6-di-Me, и G представляет собой CH.	2291	A представляет собой A-2c, $(R^2)_n$ представляет собой 3,6-di-F, и G представляет собой N.
------	---	------	---

5	2004	A представляет собой A-1e, $(R^2)_n$ представляет собой 3,6-di- CF_3 , и G представляет собой CH.	2292	A представляет собой A-2c, $(R^2)_n$ представляет собой 3,6-di-Cl, и G представляет собой N.
	2005	A представляет собой A-1e, $(R^2)_n$ представляет собой 3,6-di-MeO, и G представляет собой CH.	2293	A представляет собой A-2c, $(R^2)_n$ представляет собой 3,6-di-Br, и G представляет собой N.
	2006	A представляет собой A-1e, $(R^2)_n$ представляет собой 3,6-di-CN, и G представляет собой CH.	2294	A представляет собой A-2c, $(R^2)_n$ представляет собой 3,6-di-Me, и G представляет собой N.
	2007	A представляет собой A-1e, $(R^2)_n$ представляет собой 6-F, и G представляет собой CH.	2295	A представляет собой A-2c, $(R^2)_n$ представляет собой 3,6-di- CF_3 , и G представляет собой N.
10	2008	A представляет собой A-1e, $(R^2)_n$ представляет собой 6-Cl, и G представляет собой CH.	2296	A представляет собой A-2c, $(R^2)_n$ представляет собой 3,6-di-MeO, и G представляет собой N.
	2009	A представляет собой A-1e, $(R^2)_n$ представляет собой 6-Br, и G представляет собой CH.	2297	A представляет собой A-2c, $(R^2)_n$ представляет собой 3,6-di-CN, и G представляет собой N.
	2010	A представляет собой A-1e, $(R^2)_n$ представляет собой 6-Me, и G представляет собой CH.	2298	A представляет собой A-2c, $(R^2)_n$ представляет собой 6-F, и G представляет собой N.

15	2011	A представляет собой A-1e, $(R^2)_n$ представляет собой 6- CF_3 , и G представляет собой CH.	2299	A представляет собой A-2c, $(R^2)_n$ представляет собой 6-Cl, и G представляет собой N.
	2012	A представляет собой A-1e, $(R^2)_n$ представляет собой 6-MeO, и G представляет собой CH.	2300	A представляет собой A-2c, $(R^2)_n$ представляет собой 6-Br, и G представляет собой N.
	2013	A представляет собой A-1e, $(R^2)_n$ представляет собой 6-CN, и G представляет собой CH.	2301	A представляет собой A-2c, $(R^2)_n$ представляет собой 6-Me, и G представляет собой N.
20	2014	A представляет собой A-1e, $(R^2)_n$ представляет собой 6-F, и G представляет собой C-F.	2302	A представляет собой A-2c, $(R^2)_n$ представляет собой 6- CF_3 , и G представляет собой N.
	2015	A представляет собой A-1e, $(R^2)_n$ представляет собой 6-Cl, и G представляет собой C-Cl.	2303	A представляет собой A-2c, $(R^2)_n$ представляет собой 6-MeO, и G представляет собой N.
25	2016	A представляет собой A-1e, $(R^2)_n$ представляет собой 6-Br, и G представляет собой C-Br.	2304	A представляет собой A-2c, $(R^2)_n$ представляет собой 6-CN, и G представляет собой N.
	2017	A представляет собой A-1e, $(R^2)_n$ представляет собой 6-Me, и G представляет собой C-Me.		

Таблица 2305

A представляет собой A-1a, $(R^2)_n$ представляет собой H, и G представляет собой CH.

40	Q	Q	Q
	Q	Q	Q
40	3- CF_3 -1H-пиразол-1-ил	3-Me-1H-пиразол-1-ил	3-F-1H-пиразол-1-ил
	3-Br-1H-пиразол-1-ил	4- CF_3 -1H-пиразол-1-ил	4-Me-1H-пиразол-1-ил
	4-F-1H-пиразол-1-ил	4-Br-1H-пиразол-1-ил	5- CF_3 -1H-пиразол-1-ил
	5-Me-1H-пиразол-1-ил	5-F-1H-пиразол-1-ил	5-Br-1H-пиразол-1-ил
45	3- CHF_2 -1H-пиразол-1-ил	3-Et-1H-пиразол-1-ил	3-Cl-1H-пиразол-1-ил
	3-I-1H-пиразол-1-ил	4- CHF_2 -1H-пиразол-1-ил	4-Et-1H-пиразол-1-ил
	4-Cl-1H-пиразол-1-ил	4-I-1H-пиразол-1-ил	5- CHF_2 -1H-пиразол-1-ил
	5-Et-1H-пиразол-1-ил	5-Cl-1H-пиразол-1-ил	3-I-1H-пиразол-1-ил
	3-MeO-1H-пиразол-1-ил	3-CN-1H-пиразол-1-ил	3- CF_3 O-1H-пиразол-1-ил
	3- CHF_2 O-1H-пиразол-1-ил	4-MeO-1H-пиразол-1-ил	4-CN-1H-пиразол-1-ил

	4-CF ₃ O-1H-пиразол-1-ил	4-CHF ₂ O-1H-пиразол-1-ил	5-CF ₃ O-1H-пиразол-1-ил
	5-CN-1H-пиразол-1-ил	5-CF ₃ O-1H-пиразол-1-ил	5-CHF ₂ O-1H-пиразол-1-ил
5	3-MeO(O=)C-1H-пиразол-1-ил	3-Ph-1H-пиразол-1-ил	3,5-ди-Me-1H-пиразол-1-ил
	3,5-ди-F-1H-пиразол-1-ил	4-MeO(O=)C-1H-пиразол-1-ил	4-Ph-1H-пиразол-1-ил
	3,5-ди-CF ₃ -1H-пиразол-1-ил	3,5-ди-Cl-1H-пиразол-1-ил	5-MeO(O=)C-1H-пиразол-1-ил
	5-Ph-1H-пиразол-1-ил	3,5-ди-CHF ₂ -1H-пиразол-1-ил	3,5-ди-Br-1H-пиразол-1-ил
	3-CF ₃ -5-Me-1H-пиразол-1-ил	3,4-ди-Me-1H-пиразол-1-ил	3,4-ди-CF ₃ -1H-пиразол-1-ил
10	3,4-ди-Br-1H-пиразол-1-ил	3,4-ди-Cl-1H-пиразол-1-ил	1H-пиразол-1-ил
	3-Me-1H-[1,2,4]триазол-1-ил	3-CF ₃ -1H-[1,2,4]триазол-1-ил	3-CHF ₂ -1H-[1,2,4]триазол-1-ил
	3-F-1H-[1,2,4]триазол-1-ил	3-Cl-1H-[1,2,4]триазол-1-ил	3-Br-1H-[1,2,4]триазол-1-ил
	3,5-ди-Me-1H-[1,2,4]триазол-1-ил	3,5-ди-CF ₃ -1H-[1,2,4]триазол-1-ил	3,5-ди-CHF ₂ -1H-[1,2,4]триазол-1-ил
	3,5-ди-Cl-1H-[1,2,4]триазол-1-ил	3,5-ди-Br-1H-[1,2,4]триазол-1-ил	3-Ph-1H-[1,2,4]триазол-1-ил
15	1H-[1,2,4]триазол-1-ил	4-Me-2H-[1,2,3]триазол-2-ил	4-CF ₃ -2H-[1,2,3]триазол-2-ил
	4-CHF ₂ -2H-[1,2,3]триазол-2-ил	4-F-2H-[1,2,3]триазол-2-ил	4-Cl-2H-[1,2,3]триазол-2-ил
	4-Br-2H-[1,2,3]триазол-2-ил	4-Ph-2H-[1,2,3]триазол-2-ил	4,5-ди-Me-2H-[1,2,3]триазол-2-ил
	4,5-ди-CF ₃ -2H-[1,2,3]триазол-2-ил	4,5-ди-Cl-2H-[1,2,3]триазол-2-ил	4,5-ди-Br-2H-[1,2,3]триазол-2-ил
	2H-[1,2,3]триазол-2-ил	4-Me-1H-[1,2,3]триазол-1-ил	4-CF ₃ -1H-[1,2,3]триазол-1-ил
20	4-CHF ₂ -1H-[1,2,3]триазол-1-ил	4-F-1H-[1,2,3]триазол-1-ил	4-Cl-1H-[1,2,3]триазол-1-ил
	4-Br-1H-[1,2,3]триазол-1-ил	4-Ph-1H-[1,2,3]триазол-1-ил	1H-[1,2,3]триазол-1-ил
	3-Me-1H-пиррол-1-ил	3-CF ₃ -1H-пиррол-1-ил	3-CHF ₂ -1H-пиррол-1-ил
	3,4-ди-Me-1H-пиррол-1-ил	2,4-ди-Me-1H-пиррол-1-ил	3,4-ди-CF ₃ -1H-пиррол-1-ил
	2,4-ди-CF ₃ -1H-пиррол-1-ил	3,4-ди-Br-1H-пиррол-1-ил	3,4-ди-Cl-1H-пиррол-1-ил
25	1H-пиррол-1-ил	1-Me-1H-пиразол-3-ил	1-CF ₃ -1H-пиразол-3-ил
	1-Et-1H-пиразол-3-ил	1-i-Pr-1H-пиразол-3-ил	1-(F ₃ CCH ₂)-1H-пиразол-3-ил
	1-Ph-1H-пиразол-3-ил	1,4-ди-Me-1H-пиразол-3-ил	1-Me-4-CF ₃ -1H-пиразол-3-ил
	1-Me-1H-пиразол-4-ил	1-CF ₃ -1H-пиразол-4-ил	1-Et-1H-пиразол-4-ил
	1-i-Pr-1H-пиразол-4-ил	1-(F ₃ CCH ₂)-1H-пиразол-4-ил	1-Ph-1H-пиразол-4-ил
30	1,3-ди-Me-1H-пиразол-4-ил	1-Me-3-CF ₃ -1H-пиразол-4-ил	3-Me-1-CF ₃ -1H-пиразол-4-ил
	1-Me-1H-[1,2,4]триазол-3-ил	1-CF ₃ -1H-[1,2,4]триазол-3-ил	1-Et-1H-[1,2,4]триазол-3-ил
	1-i-Pr-1H-[1,2,4]триазол-3-ил	1-Ph-1H-[1,2,4]триазол-3-ил	5-Ph-4,5-дигидро-изоксазол-3-ил
	5-CF ₃ -2,4-дигидро-3-оксопиразол-1-ил	5-Me-2,4-дигидро-3-оксопиразол-1-ил	

Настоящее раскрытие также включает таблицы 2306-4032, каждая из которых построена так же, как таблица 2305 выше, за исключением того, что строка заголовка в таблице 2305 (т.е. “А представляет собой А-1а, (R²)_n представляет собой Н, и G представляет собой СН”) заменена соответствующей строкой заголовка, показанной ниже. Например, в таблице 2306 строкой заголовка является “А представляет собой А-1а, (R²)_n представляет собой 3-F, и G представляет собой СН”, а Q определен в таблице 1 выше. Таким образом, в первой записи в таблице 2306, в частности, раскрывается N-[2-[3-фтор-4-[3-(трифторметил)-1H-пиразол-1-ил]фенил]этил]-2-(трифторметил)бензамид. Таблицы 2307-4032 построены подобным образом.

ТАБЛИЦЫ 2306-4032			
Таблица	Заглавие строки	Таблица	Заглавие строки
2306	А представляет собой А-1а, (R ²) _n представляет собой 3-F, и G представляет собой СН.	3170	А представляет собой А-1n, (R ²) _n представляет собой 6-CF ₃ , и G представляет собой C-CF ₃ .
2307	А представляет собой А-1а, (R ²) _n представляет собой 3,5-ди-F, и G представляет собой СН.	3171	А представляет собой А-1n, (R ²) _n представляет собой 6-MeO, и G представляет собой C-OMe.

[illegible]

[illegible]

[illegible]

[illegible]

[illegible]

[illegible]

[illegible]

[illegible]

[illegible]

[illegible]

[illegible]

[illegible]

[illegible]

[illegible]

[illegible]

[illegible]

[illegible]

[illegible]

[illegible]

[illegible]

[illegible]

[illegible]

[illegible]

[illegible]

[illegible]

[illegible]

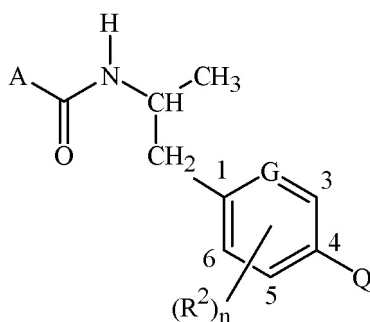
[illegible]

[illegible]

[illegible]

[illegible]

ТАБЛИЦА 4033



А представляет собой А-1а, $(R^2)_n$ представляет собой Н, и G представляет собой СН.

Q	Q	Q
3- CF_3 -1Н-пиразол-1-ил	3-Ме-1Н-пиразол-1-ил	3- F -1Н-пиразол-1-ил
3-Br-1Н-пиразол-1-ил	4- CF_3 -1Н-пиразол-1-ил	4-Ме-1Н-пиразол-1-ил
4- F -1Н-пиразол-1-ил	4-Br-1Н-пиразол-1-ил	5- CF_3 -1Н-пиразол-1-ил
5-Ме-1Н-пиразол-1-ил	5- F -1Н-пиразол-1-ил	5-Br-1Н-пиразол-1-ил
3- CHF_2 -1Н-пиразол-1-ил	3- Et -1Н-пиразол-1-ил	3- Cl -1Н-пиразол-1-ил
3- I -1Н-пиразол-1-ил	4- CHF_2 -1Н-пиразол-1-ил	4- Et -1Н-пиразол-1-ил
4- Cl -1Н-пиразол-1-ил	4- I -1Н-пиразол-1-ил	5- CHF_2 -1Н-пиразол-1-ил
5- Et -1Н-пиразол-1-ил	5- Cl -1Н-пиразол-1-ил	3- I -1Н-пиразол-1-ил
3- MeO -1Н-пиразол-1-ил	3- CN -1Н-пиразол-1-ил	3- CF_3O -1Н-пиразол-1-ил

3- CHF_2O -1Н-пиразол-1-ил	4- MeO -1Н-пиразол-1-ил	4- CN -1Н-пиразол-1-ил
4- CF_3O -1Н-пиразол-1-ил	4- CHF_2O -1Н-пиразол-1-ил	5- CF_3O -1Н-пиразол-1-ил
5- CN -1Н-пиразол-1-ил	5- CF_3O -1Н-пиразол-1-ил	5- CHF_2O -1Н-пиразол-1-ил
3- $MeO(O=C)$ -1Н-пиразол-1-ил	3-Ph-1Н-пиразол-1-ил	3,5-ди-Ме-1Н-пиразол-1-ил
3,5-ди- F -1Н-пиразол-1-ил	4- $MeO(O=C)$ -1Н-пиразол-1-ил	4-Ph-1Н-пиразол-1-ил
3,5-ди- CF_3 -1Н-пиразол-1-ил	3,5-ди- Cl -1Н-пиразол-1-ил	5- $MeO(O=C)$ -1Н-пиразол-1-ил
5-Ph-1Н-пиразол-1-ил	3,5-ди- CHF_2 -1Н-пиразол-1-ил	3,5-ди-Br-1Н-пиразол-1-ил
3- CF_3 -5-Ме-1Н-пиразол-1-ил	3,4-ди-Ме-1Н-пиразол-1-ил	3,4-ди- CF_3 -1Н-пиразол-1-ил
3,4-ди-Br-1Н-пиразол-1-ил	3,4-ди- Cl -1Н-пиразол-1-ил	1Н-пиразол-1-ил
3-Ме-1Н-[1,2,4]триазол-1-ил	3- CF_3 -1Н-[1,2,4]триазол-1-ил	3- CHF_2 -1Н-[1,2,4]триазол-1-ил
3- F -1Н-[1,2,4]триазол-1-ил	3- Cl -1Н-[1,2,4]триазол-1-ил	3-Br-1Н-[1,2,4]триазол-1-ил
3,5-ди-Ме-1Н-[1,2,4]триазол-1-ил	3,5-ди- CF_3 -1Н-[1,2,4]триазол-1-ил	3,5-ди- CHF_2 -1Н-[1,2,4]триазол-1-ил
3,5-ди- Cl -1Н-[1,2,4]триазол-1-ил	3,5-ди-Br-1Н-[1,2,4]триазол-1-ил	3-Ph-1Н-[1,2,4]триазол-1-ил
1Н-[1,2,4]триазол-1-ил	4-Ме-2Н-[1,2,3]триазол-2-ил	4- CF_3 -2Н-[1,2,3]триазол-2-ил
4- CHF_2 -2Н-[1,2,3]триазол-2-ил	4- F -2Н-[1,2,3]триазол-2-ил	4- Cl -2Н-[1,2,3]триазол-2-ил
4-Br-2Н-[1,2,3]триазол-2-ил	4-Ph-2Н-[1,2,3]триазол-2-ил	4,5-ди-Ме-2Н-[1,2,3]триазол-2-ил
4,5-ди- CF_3 -2Н-[1,2,3]триазол-2-ил	4,5-ди- Cl -2Н-[1,2,3]триазол-2-ил	4,5-ди-Br-2Н-[1,2,3]триазол-2-ил

2Н-[1,2,3]триазол-2-ил	4-Ме-1Н-[1,2,3]триазол-1-ил	4- CF_3 -1Н-[1,2,3]триазол-1-ил
4- CHF_2 -1Н-[1,2,3]триазол-1-ил	4- F -1Н-[1,2,3]триазол-1-ил	4- Cl -1Н-[1,2,3]триазол-1-ил
4-Br-1Н-[1,2,3]триазол-1-ил	4-Ph-1Н-[1,2,3]триазол-1-ил	1Н-[1,2,3]триазол-1-ил
3-Ме-1Н-пиррол-1-ил	3- CF_3 -1Н-пиррол-1-ил	3- CHF_2 -1Н-пиррол-1-ил
3,4-ди-Ме-1Н-пиррол-1-ил	2,4-ди-Ме-1Н-пиррол-1-ил	3,4-ди- CF_3 -1Н-пиррол-1-ил
2,4-ди- CF_3 -1Н-пиррол-1-ил	3,4-ди-Br-1Н-пиррол-1-ил	3,4-ди- Cl -1Н-пиррол-1-ил
1Н-пиррол-1-ил	1-Ме-1Н-пиразол-3-ил	1- CF_3 -1Н-пиразол-3-ил
1- Et -1Н-пиразол-3-ил	1- $i-Pr$ -1Н-пиразол-3-ил	1-(F_3CCH_2)-1Н-пиразол-3-ил
1-Ph-1Н-пиразол-3-ил	1,4-ди-Ме-1Н-пиразол-3-ил	1-Ме-4- CF_3 -1Н-пиразол-3-ил
1-Ме-1Н-пиразол-4-ил	1- CF_3 -1Н-пиразол-4-ил	1- Et -1Н-пиразол-4-ил
1- $i-Pr$ -1Н-пиразол-4-ил	1-(F_3CCH_2)-1Н-пиразол-4-ил	1-Ph-1Н-пиразол-4-ил

1,3-ди-Ме-1Н-пиразол-4-ил	1-Ме-3-СF ₃ -1Н-пиразол-4-ил	3-Ме-1-СF ₃ -1Н-пиразол-4-ил
1-Ме-1Н-[1,2,4]триазол-3-ил	1-СF ₃ -1Н-[1,2,4]триазол-3-ил	1-Еt-1Н-[1,2,4]триазол-3-ил
1-і-Pr-1Н-[1,2,4]триазол-3-ил	1-Ph-1Н-[1,2,4]триазол-3-ил	5-Ph-4,5-дигидро-изоксазол-3-ил
5-СF ₃ -2,4-дигидро-3-оксопиразол-1-ил	5-Ме-2,4-дигидро-3-оксопиразол-1-ил	

Настоящее раскрытие также включает таблицы 4034-5760, каждая из которых построена так же, как таблица 4033 выше, за исключением того, что строка заголовка в таблице 4033 (т.е. “А представляет собой А-1а, (R²)_n представляет собой Н, и G представляет собой СН”) заменена соответствующей строкой заголовка, показанной ниже. Например, в таблице 4034 строкой заголовка является “А представляет собой А-1а, (R²)_n представляет собой 3-Ф, и G представляет собой СН”, а Q определен в таблице 1 выше. Таким образом, в первой записи в таблице 4034, в частности, раскрывается N-[2-[3-фтор-4-[3-(трифторметил)-1Н-пиразол-1-ил]фенил]-1-метилэтил]-2-(трифторметил)бензамид. Таблицы 4035-5760 построены подобным образом.

ТАБЛИЦЫ 4034-5760			
Таблица	Заглавие строки	Таблица	Заглавие строки
4034	А представляет собой А-1а, (R ²) _n представляет собой 3-Ф, и G представляет собой СН.	4898	А представляет собой А-1n, (R ²) _n представляет собой 6-СF ₃ , и G представляет собой С-СF ₃ .
4035	А представляет собой А-1а, (R ²) _n представляет собой 3,5-ди-Ф, и G представляет собой СН.	4899	А представляет собой А-1n, (R ²) _n представляет собой 6-МеО, и G представляет собой С-ОМе.
4036	А представляет собой А-1а, (R ²) _n представляет собой 3-Сl, и G представляет собой СН.	4900	А представляет собой А-1n, (R ²) _n представляет собой Н, и G представляет собой N.
4037	А представляет собой А-1а, (R ²) _n представляет собой 3,5-ди-Сl, и G представляет собой СН.	4901	А представляет собой А-1n, (R ²) _n представляет собой 3-Ф, и G представляет собой N.
4038	А представляет собой А-1а, (R ²) _n представляет собой 3-Br, и G представляет собой СН.	4902	А представляет собой А-1n, (R ²) _n представляет собой 3,5-ди-Ф, и G представляет собой N.
4039	А представляет собой А-1а, (R ²) _n представляет собой 3,5-ди-Br, и G представляет собой СН.	4903	А представляет собой А-1n, (R ²) _n представляет собой 3-Сl, и G представляет собой N.
4040	А представляет собой А-1а, (R ²) _n представляет собой 3-Ме, и G представляет собой СН.	4904	А представляет собой А-1n, (R ²) _n представляет собой 3,5-ди-Сl, и G представляет собой N.
4041	А представляет собой А-1а, (R ²) _n представляет собой 3,5-ди-Ме, и G представляет собой СН.	4905	А представляет собой А-1n, (R ²) _n представляет собой 3-Br, и G представляет собой N.
4042	А представляет собой А-1а, (R ²) _n представляет собой 3-СF ₃ , и G представляет собой СН.	4906	А представляет собой А-1n, (R ²) _n представляет собой 3,5-ди-Br, и G представляет собой N.
4043	А представляет собой А-1а, (R ²) _n представляет собой 3,5-ди-СF ₃ , и G представляет собой СН.	4907	А представляет собой А-1n, (R ²) _n представляет собой 3-Ме, и G представляет собой N.
4044	А представляет собой А-1а, (R ²) _n представляет собой 3-МеО, и G представляет собой СН.	4908	А представляет собой А-1n, (R ²) _n представляет собой 3,5-ди-Ме, и G представляет собой N.
4045	А представляет собой А-1а, (R ²) _n представляет собой 3,5-ди-МеО, и G представляет собой СН.	4909	А представляет собой А-1n, (R ²) _n представляет собой 3-СF ₃ , и G представляет собой N.
4046	А представляет собой А-1а, (R ²) _n представляет собой 3-СN, и G представляет собой СН.	4910	А представляет собой А-1n, (R ²) _n представляет собой 3,5-ди-СF ₃ , и G представляет собой N.
4047	А представляет собой А-1а, (R ²) _n представляет собой 3,5-ди-СN, и G представляет собой СН.	4911	А представляет собой А-1n, (R ²) _n представляет собой 3-МеО, и G представляет собой N.
4048	А представляет собой А-1а, (R ²) _n представляет собой 3,6-ди-Ф, и G представляет собой СН.	4912	А представляет собой А-1n, (R ²) _n представляет собой 3,5-ди-МеО, и G представляет собой N.
4049	А представляет собой А-1а, (R ²) _n представляет собой 3,6-ди-Сl, и G представляет собой СН.	4913	А представляет собой А-1n, (R ²) _n представляет собой 3-СN, и G представляет собой N.

[illegible]

[illegible]

[illegible]

[illegible]

[illegible]

[illegible]

[illegible]

[illegible]

[illegible]

[illegible]

[illegible]

[illegible]

[illegible]

[illegible]

[illegible]

[illegible]

[illegible]

[illegible]

[illegible]

[illegible]

[illegible]

[illegible]

[illegible]

[illegible]

[illegible]

[illegible]

[illegible]

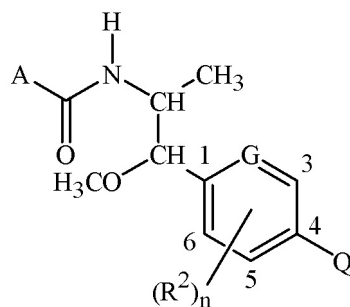
[illegible]

[illegible]

[illegible]

ТАБЛИЦА 5761

5



10

А представляет собой А-1а, $(R^2)_n$ представляет собой Н, и G представляет собой СН.

15

Q	Q	Q
3- CF_3 -1Н-пиразол-1-ил	3-Ме-1Н-пиразол-1-ил	3- F -1Н-пиразол-1-ил
3- Br -1Н-пиразол-1-ил	4- CF_3 -1Н-пиразол-1-ил	4-Ме-1Н-пиразол-1-ил
4- F -1Н-пиразол-1-ил	4- Br -1Н-пиразол-1-ил	5- CF_3 -1Н-пиразол-1-ил
5-Ме-1Н-пиразол-1-ил	5- F -1Н-пиразол-1-ил	5- Br -1Н-пиразол-1-ил
3- CHF_2 -1Н-пиразол-1-ил	3- Et -1Н-пиразол-1-ил	3- Cl -1Н-пиразол-1-ил
3- I -1Н-пиразол-1-ил	4- CHF_2 -1Н-пиразол-1-ил	4- Et -1Н-пиразол-1-ил
4- Cl -1Н-пиразол-1-ил	4- I -1Н-пиразол-1-ил	5- CHF_2 -1Н-пиразол-1-ил

20

5- Et -1Н-пиразол-1-ил	5- Cl -1Н-пиразол-1-ил	3- I -1Н-пиразол-1-ил
3- MeO -1Н-пиразол-1-ил	3- CN -1Н-пиразол-1-ил	3- CF_3O -1Н-пиразол-1-ил
3- CHF_2O -1Н-пиразол-1-ил	4- MeO -1Н-пиразол-1-ил	4- CN -1Н-пиразол-1-ил
4- CF_3O -1Н-пиразол-1-ил	4- CHF_2O -1Н-пиразол-1-ил	5- CF_3O -1Н-пиразол-1-ил
5- CN -1Н-пиразол-1-ил	5- CF_3O -1Н-пиразол-1-ил	5- CHF_2O -1Н-пиразол-1-ил
3- $MeO(O=C)$ -1Н-пиразол-1-ил	3- Ph -1Н-пиразол-1-ил	3,5-ди-Ме-1Н-пиразол-1-ил
3,5-ди- F -1Н-пиразол-1-ил	4- $MeO(O=C)$ -1Н-пиразол-1-ил	4- Ph -1Н-пиразол-1-ил
3,5-ди- CF_3 -1Н-пиразол-1-ил	3,5-ди- Cl -1Н-пиразол-1-ил	5- $MeO(O=C)$ -1Н-пиразол-1-ил
5- Ph -1Н-пиразол-1-ил	3,5-ди- CHF_2 -1Н-пиразол-1-ил	3,5-ди- Br -1Н-пиразол-1-ил
3- CF_3 -5-Ме-1Н-пиразол-1-ил	3,4-ди-Ме-1Н-пиразол-1-ил	3,4-ди- CF_3 -1Н-пиразол-1-ил
3,4-ди- Br -1Н-пиразол-1-ил	3,4-ди- Cl -1Н-пиразол-1-ил	1Н-пиразол-1-ил
3-Ме-1Н-[1,2,4]триазол-1-ил	3- CF_3 -1Н-[1,2,4]триазол-1-ил	3- CHF_2 -1Н-[1,2,4]триазол-1-ил
3- F -1Н-[1,2,4]триазол-1-ил	3- Cl -1Н-[1,2,4]триазол-1-ил	3- Br -1Н-[1,2,4]триазол-1-ил
3,5-ди-Ме-1Н-[1,2,4]триазол-1-ил	3,5-ди- CF_3 -1Н-[1,2,4]триазол-1-ил	3,5-ди- CHF_2 -1Н-[1,2,4]триазол-1-ил
3,5-ди- Cl -1Н-[1,2,4]триазол-1-ил	3,5-ди- Br -1Н-[1,2,4]триазол-1-ил	3- Ph -1Н-[1,2,4]триазол-1-ил
1Н-[1,2,4]триазол-1-ил	4-Ме-2Н-[1,2,3]триазол-2-ил	4- CF_3 -2Н-[1,2,3]триазол-2-ил
4- CHF_2 -2Н-[1,2,3]триазол-2-ил	4- F -2Н-[1,2,3]триазол-2-ил	4- Cl -2Н-[1,2,3]триазол-2-ил

35

4- Br -2Н-[1,2,3]триазол-2-ил	4- Ph -2Н-[1,2,3]триазол-2-ил	4,5-ди-Ме-2Н-[1,2,3]триазол-2-ил
4,5-ди- CF_3 -2Н-[1,2,3]триазол-2-ил	4,5-ди- Cl -2Н-[1,2,3]триазол-2-ил	4,5-ди- Br -2Н-[1,2,3]триазол-2-ил
2Н-[1,2,3]триазол-2-ил	4-Ме-1Н-[1,2,3]триазол-1-ил	4- CF_3 -1Н-[1,2,3]триазол-1-ил
4- CHF_2 -1Н-[1,2,3]триазол-1-ил	4- F -1Н-[1,2,3]триазол-1-ил	4- Cl -1Н-[1,2,3]триазол-1-ил
4- Br -1Н-[1,2,3]триазол-1-ил	4- Ph -1Н-[1,2,3]триазол-1-ил	1Н-[1,2,3]триазол-1-ил
3-Ме-1Н-пиррол-1-ил	3- CF_3 -1Н-пиррол-1-ил	3- CHF_2 -1Н-пиррол-1-ил
3,4-ди-Ме-1Н-пиррол-1-ил	2,4-ди-Ме-1Н-пиррол-1-ил	3,4-ди- CF_3 -1Н-пиррол-1-ил
2,4-ди- CF_3 -1Н-пиррол-1-ил	3,4-ди- Br -1Н-пиррол-1-ил	3,4-ди- Cl -1Н-пиррол-1-ил
1Н-пиррол-1-ил	1-Ме-1Н-пиразол-3-ил	1- CF_3 -1Н-пиразол-3-ил
1- Et -1Н-пиразол-3-ил	1- $i-Pr$ -1Н-пиразол-3-ил	1-(F_3CCH_2)-1Н-пиразол-3-ил
1- Ph -1Н-пиразол-3-ил	1,4-ди-Ме-1Н-пиразол-3-ил	1-Ме-4- CF_3 -1Н-пиразол-3-ил
1-Ме-1Н-пиразол-4-ил	1- CF_3 -1Н-пиразол-4-ил	1- Et -1Н-пиразол-4-ил
1- $i-Pr$ -1Н-пиразол-4-ил	1-(F_3CCH_2)-1Н-пиразол-4-ил	1- Ph -1Н-пиразол-4-ил
1,3-ди-Ме-1Н-пиразол-4-ил	1-Ме-3- CF_3 -1Н-пиразол-4-ил	3-Ме-1- CF_3 -1Н-пиразол-4-ил

45

1-Ме-1Н-[1,2,4]триазол-3-ил	1-CF ₃ -1Н-[1,2,4]триазол-3-ил	1-Ет-1Н-[1,2,4]триазол-3-ил
1-і-Рг-1Н-[1,2,4]триазол-3-ил	1-Ph-1Н-[1,2,4]триазол-3-ил	5-Ph-4,5-дигидро-изоксазол-3-ил
5-CF ₃ -2,4-дигидро-3-оксопирозол-1-ил	5-Ме-2,4-дигидро-3-оксопирозол-1-ил	

Настоящее раскрытие также включает таблицы 5762-6336, каждая из которых построена так же, как таблица 5761 выше, за исключением того, что строка заголовка в таблице 5761 (т.е. “А представляет собой А-1а, (R²)_n представляет собой Н, и G представляет собой СН”) заменена соответствующей строкой заголовка, показанной ниже. Например, в таблице 5762 строкой заголовка является “А представляет собой А-1а, (R²)_n представляет собой 3-F, и G представляет собой СН”, а Q определен в таблице 5761 выше. Таким образом, в первой записи в таблице 5762, в частности, раскрывается N-[2-[3-фтор-4-[3-(трифторметил)-1Н-пиразол-1-ил]фенил]-2-метокси-1-метилэтил]-2-(трифторметил)бензамид. Таблицы 5763-6336 построены подобным образом.

ТАБЛИЦЫ 5762-6336			
Таблица	Заглавие строки	Таблица	Заглавие строки
5762	А представляет собой А-1а, (R ²) _n представляет собой 3-F, и G представляет собой СН.	6050	А представляет собой А-1е, (R ²) _n представляет собой 6-CF ₃ , и G представляет собой С-CF ₃ .
5763	А представляет собой А-1а, (R ²) _n представляет собой 3,5-di-F, и G представляет собой СН.	6051	А представляет собой А-1е, (R ²) _n представляет собой 6-MeO, и G представляет собой С-ОМе.
5764	А представляет собой А-1а, (R ²) _n представляет собой 3-Cl, и G представляет собой СН.	6052	А представляет собой А-1е, (R ²) _n представляет собой Н, и G представляет собой N.

5765	А представляет собой А-1а, (R ²) _n представляет собой 3,5-di-Cl, и G представляет собой СН.	6053	А представляет собой А-1е, (R ²) _n представляет собой 3-F, и G представляет собой N.
5766	А представляет собой А-1а, (R ²) _n представляет собой 3-Br, и G представляет собой СН.	6054	А представляет собой А-1е, (R ²) _n представляет собой 3,5-di-F, и G представляет собой N.
5767	А представляет собой А-1а, (R ²) _n представляет собой 3,5-di-Br, и G представляет собой СН.	6055	А представляет собой А-1е, (R ²) _n представляет собой 3-Cl, и G представляет собой N.
5768	А представляет собой А-1а, (R ²) _n представляет собой 3-Me, и G представляет собой СН.	6056	А представляет собой А-1е, (R ²) _n представляет собой 3,5-di-Cl, и G представляет собой N.
5769	А представляет собой А-1а, (R ²) _n представляет собой 3,5-di-Me, и G представляет собой СН.	6057	А представляет собой А-1е, (R ²) _n представляет собой 3-Br, и G представляет собой N.
5770	А представляет собой А-1а, (R ²) _n представляет собой 3-CF ₃ , и G представляет собой СН.	6058	А представляет собой А-1е, (R ²) _n представляет собой 3,5-di-Br, и G представляет собой N.
5771	А представляет собой А-1а, (R ²) _n представляет собой 3,5-di-CF ₃ , и G представляет собой СН.	6059	А представляет собой А-1е, (R ²) _n представляет собой 3-Me, и G представляет собой N.
5772	А представляет собой А-1а, (R ²) _n представляет собой 3-MeO, и G представляет собой СН.	6060	А представляет собой А-1е, (R ²) _n представляет собой 3,5-di-Me, и G представляет собой N.

5773	А представляет собой А-1а, (R ²) _n представляет собой 3,5-di-MeO, и G представляет собой СН.	6061	А представляет собой А-1е, (R ²) _n представляет собой 3-CF ₃ , и G представляет собой N.
5774	А представляет собой А-1а, (R ²) _n представляет собой 3-CN, и G представляет собой СН.	6062	А представляет собой А-1е, (R ²) _n представляет собой 3,5-di-CF ₃ , и G представляет собой N.
5775	А представляет собой А-1а, (R ²) _n представляет собой 3,5-di-CN, и G представляет собой СН.	6063	А представляет собой А-1е, (R ²) _n представляет собой 3-MeO, и G представляет собой N.
5776	А представляет собой А-1а, (R ²) _n представляет собой 3,6-di-F, и G представляет собой СН.	6064	А представляет собой А-1е, (R ²) _n представляет собой 3,5-di-MeO, и G представляет собой N.
5777	А представляет собой А-1а, (R ²) _n представляет собой 3,6-di-Cl, и G представляет собой СН.	6065	А представляет собой А-1е, (R ²) _n представляет собой 3-CN, и G представляет собой N.
5778	А представляет собой А-1а, (R ²) _n представляет собой 3,6-di-Br, и G представляет собой СН.	6066	А представляет собой А-1е, (R ²) _n представляет собой 3,5-di-CN, и G представляет собой N.

[illegible]

[illegible]

[illegible]

[illegible]

[illegible]

ТАБЛИЦА 6337

5

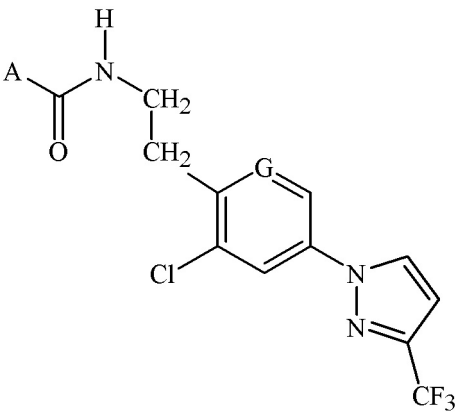
10

15

20

25

30

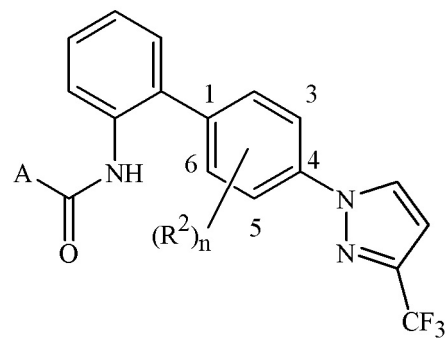


A	G		A	G		A	G		A	G
A-1a	CH		A-2a	CH		A-1a	N		A-2a	N
A-1b	CH		A-2b	CH		A-1b	N		A-2b	N
A-1c	CH		A-2c	CH		A-1c	N		A-2c	N
A-1d	CH		A-2d	CH		A-1d	N		A-2d	N

A-1e	CH		A-2e	CH		A-1e	N		A-2e	N
A-1f	CH		A-3a	CH		A-1f	N		A-3a	N
A-1g	CH		A-3b	CH		A-1g	N		A-3b	N
A-1h	CH		A-3c	CH		A-1h	N		A-3c	N
A-1i	CH		A-4a	CH		A-1i	N		A-4a	N
A-1j	CH		A-4b	CH		A-1j	N		A-4b	N
A-1k	CH		A-4c	CH		A-1k	N		A-4c	N
A-1l	CH		A-4d	CH		A-1l	N		A-4d	N
A-1m	CH		A-5a	CH		A-1m	N		A-5a	N
A-1n	CH		A-6a	CH		A-1n	N		A-6a	N
A-1o	CH		A-6b	CH		A-1o	N		A-6b	N
A-1p	CH		A-7a	CH		A-1p	N		A-7a	N
A-1q	CH		A-7b	CH		A-1q	N		A-7b	N
A-1r	CH		A-8a	CH		A-1r	N		A-8a	N
A-1s	CH		A-8b	CH		A-1s	N		A-8b	N
A-1t	CH		A-8c	CH		A-1t	N		A-8c	N

35

40



45

A	(R ²) _n		A	(R ²) _n		A	(R ²) _n		A	(R ²) _n
A-1a	3-F		A-2a	3-F		A-1a	3,5-di-F		A-2a	3,5-di-F
A-1b	3-F		A-2b	3-F		A-1b	3,5-di-F		A-2b	3,5-di-F
A-1c	3-F		A-2c	3-F		A-1c	3,5-di-F		A-2c	3,5-di-F
A-1d	3-F		A-2d	3-F		A-1d	3,5-di-F		A-2d	3,5-di-F
A-1e	3-F		A-2e	3-F		A-1e	3,5-di-F		A-2e	3,5-di-F
A-1f	3-F		A-3a	3-F		A-1f	3,5-di-F		A-3a	3,5-di-F
A-1g	3-F		A-3b	3-F		A-1g	3,5-di-F		A-3b	3,5-di-F
A-1h	3-F		A-3c	3-F		A-1h	3,5-di-F		A-3c	3,5-di-F

ТАБЛИЦА 6338

5

10

A-1i	3-F	A-4a	3-F	A-1i	3,5-di-F	A-4a	3,5-di-F
A-1j	3-F	A-4b	3-F	A-1j	3,5-di-F	A-4b	3,5-di-F
A-1k	3-F	A-4c	3-F	A-1k	3,5-di-F	A-4c	3,5-di-F
A-1l	3-F	A-4d	3-F	A-1l	3,5-di-F	A-4d	3,5-di-F
A-1m	3-F	A-5a	3-F	A-1m	3,5-di-F	A-5a	3,5-di-F
A-1n	3-F	A-6a	3-F	A-1n	3,5-di-F	A-6a	3,5-di-F
A-1o	3-F	A-6b	3-F	A-1o	3,5-di-F	A-6b	3,5-di-F
A-1p	3-F	A-7a	3-F	A-1p	3,5-di-F	A-7a	3,5-di-F
A-1q	3-F	A-7b	3-F	A-1q	3,5-di-F	A-7b	3,5-di-F
A-1r	3-F	A-8a	3-F	A-1r	3,5-di-F	A-8a	3,5-di-F
A-1s	3-F	A-8b	3-F	A-1s	3,5-di-F	A-8b	3,5-di-F
A-1t	3-F	A-8c	3-F	A-1t	3,5-di-F	A-8c	3,5-di-F

Состав/применимость

15

20

Соединение формулы 1 по настоящему изобретению (включая его N-оксиды и соли) в целом будет применяться в качестве фунгицидно активного ингредиента в композиции, т.е. в составе, по меньшей мере с одним дополнительным компонентом, выбранным из группы, состоящей из поверхностно-активных веществ, твердых разбавителей и жидких разбавителей, которые служат в качестве носителя. Ингредиенты состава или композиции выбирают так, чтобы они соответствовали физическим свойствам активного ингредиента, способу применения и факторам среды обитания, таким как тип почвы, влажность и температура.

25

Применимые составы включают как жидкие, так и твердые композиции. Жидкие композиции включают растворы (в том числе эмульгируемые концентраты), суспензии, эмульсии (в том числе микроэмульсии и/или суспензии) и т.п., которые необязательно можно загущать в гели. Общими типами водных жидких композиций являются растворимый концентрат, суспензионный концентрат, капсульная суспензия, концентрированная эмульсия, микроэмульсия и суспензия. Общими типами неводных жидких композиций являются эмульгируемый концентрат, микроэмульгируемый концентрат, диспергируемый концентрат и масляная дисперсия.

30

35

Основными типами твердых композиций являются пылевидные препараты, порошки, гранулы, пеллеты, дробинки, пастилки, таблетки, наполненные пленки (включая покрытия для семян) и т.п., которые могут быть вододиспергируемыми (“смачиваемыми”) или водорастворимыми. Пленки и покрытия, образованные из пленкообразующих растворов или текучих суспензий, особенно применимы для обработки семян. Активный ингредиент может быть (микро)инкапсулирован и дальше превращен в суспензию или твердый состав; в качестве альтернативы, весь состав активного ингредиента может быть инкапсулирован (или “помещен под защитное покрытие”). Инкапсулирование может регулировать или задерживать высвобождение активного ингредиента. Эмульгируемая гранула сочетает преимущества как состава эмульгируемого концентрата, так и сухого гранулированного состава.

40

Концентрированные композиции в основном применяются в качестве промежуточных соединений для дальнейшего составления.

45

Распыляемые составы обычно разбавляют в подходящей среде перед опрыскиванием. Такие жидкие и твердые составы составляют легко разбавляемыми в среде раствора для опрыскивания, как правило, в воде. Объемы раствора для опрыскивания могут варьировать от приблизительно одного до нескольких тысяч литров на гектар, но чаще находятся в диапазоне от приблизительно десяти до нескольких сотен литров на гектар. Из распыляемых составов может быть приготовлена баковая смесь с водой или другой подходящей средой для обработки листьев посредством нанесения воздушным путем, или внесения в почву, или внесения в среду выращивания растения. Жидкие и сухие

составы можно дозировать непосредственно в системы капельного орошения или отмерять в борозду во время посадки. Жидкие и твердые составы можно наносить на семена сельскохозяйственных культур и другую подходящую растительность в качестве обработки семян перед посадкой для защиты растущих корней и других подземных частей растения и/или листвы путем систематического поглощения.

Составы, как правило, будут содержать эффективные количества активного ингредиента, разбавителя и поверхностно-активного вещества в следующих приблизительных диапазонах, которые составляют в сумме 100 процентов по весу.

	Весовой процент		
	Активный Ингредиент	Разбавитель	Поверхностно-активное вещество
Диспергируемые в воде и водорастворимые гранулы, таблетки и порошки	0,001-90	0-99,999	0-15
Масляные дисперсии, суспензии, эмульсии, растворы (в том числе эмульгируемые концентраты)	1-50	40-99	0-50
Пылевидные препараты	1-25	70-99	0-5
Гранулы и пеллеты	0,001-95	5-99,999	0-15
Высококонцентрированные композиции	90-99	0-10	0-2

Твердые разбавители включают, например, глины, такие как бентонит, монтмориллонит, аттапульгит и каолин, гипс, целлюлозу, диоксид титана, оксид цинка, крахмал, декстрин, сахара (например, лактоза, сахароза), кремнезем, тальк, слюду, диатомит, мочевины, карбонат кальция, карбонат и бикарбонат натрия, и сульфат натрия. Типичные твердые разбавители описываются в Watkins et al., Handbook of Insecticide Dust Diluents and Carriers, 2nd Ed., Dorland Books, Caldwell, New Jersey.

Жидкие разбавители включают, например, воду, N,N-диметилалканамиды (например, N,N-диметилформамид), лимонен, диметилсульфоксид, N-алкилпирролидоны (например, N-метилпирролидинон), этиленгликоль, триэтиленгликоль, пропиленгликоль, дипропиленгликоль, полипропиленгликоль, пропиленкарбонат, бутиленкарбонат, парафины (например, светлые минеральные масла, нормальные парафины, изопарафины), алкилбензолы, алкилнафталины, глицерин, глицерол триацетат, сорбит, ароматические углеводороды, деароматизированные алифатические углеводороды, алкилбензолы, алкилнафталины, кетоны, такие как циклогексанон, 2-гептанон, изофорон и 4-гидрокси-4-метил-2-пентанон, ацетаты, такие как изоамилацетат, гексилацетат, гептилацетат, октилацетат, нонилацетат, тридецилацетат и изоборнилацетат, другие сложные эфиры, такие как алкилированные сложные эфиры лактата, сложные эфиры двухосновных кислот и γ -бутиролактон, и спирты, которые могут быть линейными, разветвленными, насыщенными или ненасыщенными, такими как метанол, этанол, н-пропанол, изопропиловый спирт, н-бутанол, изобутиловый спирт, н-гексанол, 2-этилгексанол, н-октанол, деканол, изодециловый спирт, изооктадеканол, цетиловый спирт, лауриловый спирт, тридециловый спирт, олеиловый спирт, циклогексанол, тетрагидрофурфуриловый спирт, диацетоновый спирт и бензиловый спирт. Жидкие разбавители также включают глицериновых сложные эфиры насыщенных и ненасыщенных жирных кислот (обычно C₆-C₂₂), такие как масла семян растений и плодов (например, масла маслины, клещевины, семян льна, кунжута, кукурузы (маиса), арахиса, подсолнечника, виноградных косточек, сафлоры, семян хлопчатника, сои, семян рапса, кокосового ореха и ядер кокосового ореха), жиры животного происхождения (например, говяжье сало, свиное сало, топленое свиное сало, жир печени трески, рыбий жир) и их смеси. Жидкие разбавители также включают алкилированные жирные кислоты (например, метилированные, этилированные, бутилированные), где

жирные кислоты можно получать гидролизом сложных эфиров глицерина из растительных и животных источников и можно очищать перегонкой. Типичные жидкие разбавители описываются в Marsden, Solvents Guide, 2nd Ed., Interscience, New York, 1950.

5 Твердые и жидкие композиции по настоящему изобретению часто включают одно или несколько поверхностно-активных веществ. При добавлении к жидкости
поверхностно-активные вещества (также известные как “поверхностно-активные
средства”) в основном модифицируют, чаще всего уменьшают, поверхностное натяжение
жидкости. В зависимости от природы гидрофильной и липофильной групп в молекуле
10 поверхностно-активного вещества, поверхностно-активные вещества могут быть пригодными в качестве смачивающих средств, диспергирующих средств, эмульгаторов
или пеногасителей.

Поверхностно-активные вещества могут быть классифицированы как неионные, анионные или катионные. Неионные поверхностно-активные вещества, применимые для композиций по настоящему изобретению, включают без ограничения алкоксилаты
15 спиртов, такие как алкоксилаты спиртов на основе природных и синтетических спиртов (которые могут быть разветвленными или линейными) и полученные из спиртов и этиленоксида, пропиленоксида, бутиленоксида или их смесей; этоксилаты аминов, алканоламида и этоксилированные алканоламида; алкоксилированные триглицериды, такие как этоксилированные соевое, касторовое и рапсовое масла;
20 алкилфенолалкоксилаты, такие как октилфенолэтоксилаты, нонилфенолэтоксилаты, динонилфенолэтоксилаты и додецилфенолэтоксилаты (полученные из фенолов и этиленоксида, пропиленоксида, бутиленоксида или их смесей); блок-сополимеры, полученные из этиленоксида или пропиленоксида, и обратные блок-сополимеры, в которых концевые блоки получены из пропиленоксида; этоксилированные жирные
25 кислоты; этоксилированные сложные эфиры жирных кислот и масел; этоксилированные метиловые сложные эфиры; этоксилированные тристирилфенолы (в том числе получаемые из этиленоксида, пропиленоксида, бутиленоксида или их смесей); сложные эфиры жирных кислот, сложные эфиры глицерина, производные на основе ланолина, полиэтоксилированные сложные эфиры, такие как полиэтоксилированные сложные
30 эфиры сорбитана и жирных кислот, полиэтоксилированные сложные эфиры сорбита и жирных кислот и полиэтоксилированные сложные эфиры глицерина и жирных кислот; иные производные сорбитана, такие как сложные эфиры сорбитана; полимерные поверхностно-активные вещества, такие как статистические сополимеры, блок-сополимеры, алкидные ПЭГ (полиэтиленгликоль) смолы, привитые или гребнеобразные
35 полимеры и звездообразные полимеры; полиэтиленгликоли (ПЭГ); сложные эфиры полиэтиленгликоля и жирных кислот; поверхностно-активные вещества на основе силикона и производные сахаров, такие как сложные эфиры сахарозы, алкилполиглицозиды и алкилполисахариды.

Применимые анионные поверхностно-активные вещества включают без ограничений
40 алкиларилсульфоновые кислоты и их соли; карбоксилированные этоксилаты спиртов или алкилфенолов; дифенилсульфонатные производные; лигнин и производные лигнина, такие как лигносульфонаты; малеиновая или янтарная кислоты или их ангидриды; олефинсульфонаты; сложные эфиры фосфорной кислоты, такие как сложные эфиры фосфорной кислоты и алкоксилатов спирта, сложные эфиры фосфорной кислоты и
45 алкоксилатов алкилфенола и сложные эфиры фосфорной кислоты и этоксилатов стирилфенола; поверхностно-активные вещества на основе белка; производные саркозина; сульфат эфира стирилфенола; сульфаты и сульфонаты масел и жирных кислот; сульфаты и сульфонаты этоксилированных алкилфенолов; сульфаты спиртов;

сульфаты этоксилированных спиртов; сульфонаты аминов и амиды, такие как N,N-алкилтаураты; сульфонаты бензола, кумола, толуола, ксилола и додецил- и тридецилбензолов; сульфонаты конденсированных нафталинов; сульфонаты нафталина и алкилнафталина; сульфонаты разделенной на фракции нефти; сульфосукцинаматы и сульфосукцинаты и их производные, такие как диалкилсульфосукцинатные соли.

Применимые катионные поверхностно-активные вещества включают без ограничений амиды и этоксилированные амиды; амины, такие как N-алкилпропандиамины, трипропилен триамины и дипропилен тетраамины, и этоксилированные амины, этоксилированные диамины и пропоксилированные амины (полученные из аминов и этиленоксида, пропиленоксида, бутиленоксида или их смесей); аминные соли, такие как аминоксиды и диаминные соли; четвертичные аммониевые соли, такие как четвертичные соли, этоксилированные четвертичные соли и дичетвертичные соли; и аминоксиды, такие как алкилдиметиламинооксиды и бис-(2-гидроксиэтил) алкиламинооксиды.

Также применимы для композиций по настоящему изобретению смеси неионных и анионных поверхностно-активных веществ или смеси неионных и катионных поверхностно-активных веществ. Неионные, анионные и катионные поверхностно-активные вещества и их рекомендуемые применения раскрываются во множестве опубликованных источников, в том числе McCutcheon's Emulsifiers and Detergents, ежегодных американских и международных изданиях, опубликованных McCutcheon's Division, The Manufacturing Confectioner Publishing Co.; Sisely and Wood, Encyclopedia of Surface Active Agents, Chemical Publ. Co., Inc., New York, 1964; и A.S. Davidson and B. Milwidsky, Synthetic Detergents, Seventh Edition, John Wiley and Sons, New York, 1987.

Композиции по настоящему изобретению могут также содержать вспомогательные вещества и добавки состава, известные специалистам в данной области в качестве вспомогательных средств состава (некоторые из которых могут рассматриваться как выполняющие также функцию твердых разбавителей, жидких разбавителей или поверхностно-активных веществ). Такие вспомогательные вещества и добавки состава могут контролировать pH (буферы), пенообразование во время изготовления (противовспениватели, подобные полиорганосилоксанам), осаждение активных ингредиентов (суспендирующие средства), вязкость (тиксотропные загустители), развитие микроорганизмов в таре (противомикробные средства), замораживание продуктов (антифризы), цвет (дисперсии красителей/пигментов), смывание (пленкообразователи или клейкие вещества), испарение (замедлители испарения) и другие свойства состава.

Пленкообразователи включают, например, поливинилацетаты, сополимеры поливинилацетата, сополимер поливинилпирролидона и винилацетата, поливиниловые спирты, сополимеры поливинилового спирта и восков. Примеры вспомогательных веществ и добавок состава включают перечисленные в McCutcheon's Volume 2: Functional Materials, annual International and North American editions, опубликованном McCutcheon's Division, The Manufacturing Confectioner Publishing Co.; и в публикации по PCT WO 03/024222.

Соединение формулы 1 и любые другие активные ингредиенты, как правило, включают в настоящие композиции посредством растворения активного ингредиента в растворителе или посредством измельчения в жидком или сухом разбавителе. Растворы, в том числе эмульгируемые концентраты, можно получать посредством простого смешивания ингредиентов. Если растворитель жидкой композиции, предназначенной для применения в качестве эмульгируемого концентрата, не способен смешиваться с водой, обычно добавляют эмульгатор для эмульгирования растворителя, содержащего

активное вещество, при разбавлении водой. Мокрый помол взвесей активного ингредиента с диаметрами частиц до 2000 мкм можно проводить с применением мельниц для размолла в среде с получением частиц со средними диаметрами менее 3 мкм. Водные взвеси можно превращать в готовые суспензионные концентраты (см., например, патент США №3060084) или дополнительно обрабатывать посредством сушки распылением для образования диспергируемых в воде гранул. Сухие составы, как правило, подразумевают способы сухого помола, при которых получают частицы со средними диаметрами в диапазоне от 2 до 10 мкм. Пылевидные препараты и порошки могут быть получены путем смешивания и, как правило, измельчения (например, молотковой мельницей или струйной мельницей). Гранулы и пеллеты могут быть получены нанесением путем распыления активного материала на предварительно составленные гранулированные носители или с помощью способов агломерации. См. Browning, "Agglomeration", Chemical Engineering, December 4, 1967, pages 147-48; Perry's Chemical Engineer's Handbook, 4th Ed., McGraw-Hill, New York, 1963, pages 8-57 и далее, и WO 91/13546. Пеллеты можно получать, как описано в патенте США №4172714.

Диспергируемые в воде и водорастворимые гранулы можно получать, как указано в патентах США №№4144050, 3920442 и в патенте Германии №3246493. Таблетки можно получать, как указано в патентах США №№5180587, 5232701 и 5208030. Пленки можно получать, как указано в патенте Великобритании №2095558 и в патенте США №3299566.

Один способ обработки семени осуществляют опрыскиванием или опудриванием семени соединением по настоящему изобретению (т.е. в виде составленной композиции) перед посевом семян. Композиции, составленные для обработки семени, в основном содержат пленкообразователь или адгезионное средство. Следовательно, обычно композиция по настоящему изобретению для нанесения покрытия на семена содержит биологически эффективное количество соединения формулы 1 и пленкообразователь или адгезионное средство. Семя может быть покрыто посредством опрыскивания текучим суспензионным концентратом непосредственно в галтовочном барабане для семян и последующей сушки семян. Альтернативно, другие типы составов, такие как смачиваемые порошки, растворы, суспензии, эмульгируемые концентраты и эмульсии в воде, можно наносить на семя опрыскиванием. Данный способ, в частности, пригоден для нанесения пленочных покрытий на семена. Различные машины для нанесения покрытий и способы доступны для специалиста в данной области. Приемлемые способы включают приведенные в P. Kusters et al., Seed Treatment: Progress and Prospects, 1994 BCPC Monograph No. 57, и упомянутые там ссылки.

Чтобы получить дополнительную информацию относительно области составления, см. T.S. Woods, "The Formulator's Toolbox - Product Forms for Modern Agriculture" in Pesticide Chemistry and Bioscience, The Food-Environment Challenge, T. Brooks and T.R. Roberts, Eds., Proceedings of the 9th International Congress on Pesticide Chemistry, The Royal Society of Chemistry, Cambridge, 1999, pp. 120-133. Также см. патент США №3235361, от строки 16 абзаца 6 до строки 19 абзаца 7 и примеры 10-41; патент США №3309192, от строки 43 абзаца 5 до строки 62 абзаца 7 и примеры 8, 12, 15, 39, 41, 52, 53, 58, 132, 138-140, 162-164, 166, 167 и 169-182; патент США №2891855, от строки 66 абзаца 3 до строки 17 абзаца 5 и примеры 1-4; Klingman, Weed Control as a Science, John Wiley and Sons, Inc., New York, 1961, pages 81-96; Hance et al., Weed Control Handbook, 8th Ed., Blackwell Scientific Publications, Oxford, 1989; и Developments in formulation technology, PJB Publications, Richmond, UK, 2000.

В следующих примерах все процентные соотношения приводятся по весу, и все составы получают традиционными способами. Номера соединений относятся к

соединениям в таблицах индексов 1-6. Без дополнительного уточнения предполагается, что специалист в данной области, применяя предшествующее описание, может использовать настоящее изобретение в полном его объеме. Следующие примеры, следовательно, расцениваются всего лишь как иллюстративные, а не ограничивающие раскрытие каким-либо образом. Процентные соотношения приводятся по весу, за исключением случаев, где указывается иное.

Пример А

Концентрат с высокой степенью концентрирования	
Соединение 1	98,5%
кремнеземный аэрогель	0,5%
синтетический аморфный тонкодисперсный кремнезем	1,0%

Пример В

Смачиваемый порошок	
Соединение 40	65,0%
эфир додецилфенолполиэтиленгликоля	2,0%
лигнинсульфонат натрия	4,0%
алюмосиликат натрия	6,0%
монтмориллонит (кальцинированный)	23,0%

Пример С

Гранула	
Соединение 172	10,0%
аттапульгитные гранулы (слабелетучее вещество, 0,71/0,30 мм; сита № 25-50 по стандарту США)	90,0%

Пример D

Экструдированная пеллета	
Соединение 173	25,0%
безводный сульфат натрия	10,0%
неочищенный кальция лигнинсульфонат	5,0%
алкилнафталинсульфонат натрия	1,0%
бентонит кальция/магния	59,0%

Пример Е

Эмульгируемый концентрат	
Соединение 85	10,0%
полиоксиэтилен сорбит гексаолеат	20,0%
метиловый сложный эфир C ₆ -C ₁₀ жирной кислоты	70,0%

Пример F

Микроэмульсия	
Соединение 1	5,0%
сополимер поливинилпирролидона и винилацетата	30,0%
алкилполиглицерид	30,0%
глицерилмоноолеат	15,0%
вода	20,0%

Пример G

Средство для обработки семян	
Соединение 85	20,00%

	сополимер поливинилпирролидона и винилацетата	5,00%
	кислый монтанвоск	5,00%
	кальция лигнинсульфонат	1,00%
	блоксополимеры полиоксиэтилена и полиоксипропилена	1,00%
5	стеариловый спирт (ПОЕ 20)	2,00%
	полиоргансилан	0,20%
	окрашивающий красный краситель	0,05%
	вода	65,75%

Водорастворимые и диспергируемые в воде составы, как правило, разбавляют водой с образованием водных композиций перед применением. Водные композиции для непосредственного нанесения на растение или его часть (например, композиции в резервуаре распылителя), как правило, содержат по меньшей мере приблизительно 1 ч/млн или более (например, от 1 ч/млн до 100 ч/млн) соединения(й) по настоящему изобретению.

Семя обычно обрабатывают при норме от приблизительно 0,001 г (чаще приблизительно 0,1 г) до приблизительно 10 г на килограмм семян (т.е. от приблизительно 0,0001 до 1% по весу семян перед обработкой). Текучая суспензия, составленная для обработки семени, обычно содержит от приблизительно 0,5% до приблизительно 70% активного ингредиента, от приблизительно 0,5% до приблизительно 30% пленкообразующего адгезионного вещества, от приблизительно 0,5% до приблизительно 20% диспергирующего средства, от 0% до приблизительно 5% загустителя, от 0% до приблизительно 5% пигмента и/или красителя, от 0% до приблизительно 2% противовспенивающего средства, от 0% до приблизительно 1% консервирующего средства и от 0% до приблизительно 75% летучего жидкого разбавителя.

Соединения по настоящему изобретению применимы в качестве средств для контроля болезней растений. Настоящее изобретение, таким образом, дополнительно включает способ контроля болезней растений, вызванных патогенными для растений грибами, включающий применение по отношению к растению или его части, подлежащих защите, или к семени растения, подлежащему защите, эффективного количества соединения по настоящему изобретению или фунгицидной композиции, содержащей указанное соединение. Соединения и/или композиции по настоящему изобретению обеспечивают контроль болезней, вызванных широким спектром патогенных для растений грибов из классов базидомицетов, аскомицетов, оомицетов и дейтеромицетов. Они эффективны при контроле широкого спектра болезней растений, в частности, патогенов листьев декоративных, дернообразующих, овощных, полевых, зерновых и плодовых сельскохозяйственных культур. Эти патогены включают оомицеты, в том числе патогены из рода *Phytophthora*, такие как *Phytophthora infestans*, *Phytophthora megasperma*, *Phytophthora parasitica*, *Phytophthora cinnamomi* и *Phytophthora capsici*, патогены из рода *Pythium*, такие как *Pythium aphanidermatum*, и патогены из семейства *Peronosporaceae*, такие как *Plasmopara viticola*, *Peronospora* spp. (включая *Peronospora tabacina* и *Peronospora parasitica*), *Pseudoperonospora* spp. (включая *Pseudoperonospora cubensis*) и *Bremia lactucae*; аскомицеты, в том числе патогены из рода *Alternaria*, такие как *Alternaria solani* и *Alternaria brassicae*, патогены из рода *Guignardia*, такие как *Guignardia bidwell*, патогены из рода *Venturia*, такие как *Venturia inaequalis*, патогены из рода *Septoria*, такие как *Septoria nodorum* и *Septoria tritici*, патогены, вызывающие настоящую мучнистую росу, такие как *Blumeria* spp. (включая *Blumeria graminis*) и *Erysiphe* spp. (включая *Erysiphe polygoni*), *Uncinula necator*, *Sphaerotheca fuliginea*, *Podosphaera leucotricha* и *Pseudocercospora herpotrichoides*, патогены из рода *Botrytis*, такие как *Botrytis cinerea*, *Monilinia fructicola*, патогены из рода

Sclerotinia, такие как *Sclerotinia sclerotiorum*, *Sclerotinia minor*, *Magnaporthe grisea* и *Phomopsis viticola*, патогены из рода *Helminthosporium*, такие как *Helminthosporium tritici repentis* и *Pyrenophora teres*, патогены, вызывающие антракноз, такие как *Glomerella* или *Colletotrichum* spp. (такие как *Colletotrichum graminicola* и *Colletotrichum orbiculare*), и

5 *Gaeumannomyces graminis*; базидиомицеты, в том числе вызывающие ржавчину *Puccinia* spp. (такие как *Puccinia recondita*, *Puccinia striiformis*, *Puccinia hordei*, *Puccinia graminis* и *Puccinia arachidis*), *Hemileia vastatrix* и *Phakopsora pachyrhizi*; другие патогены, в том числе *Rutstroemia floccosum* (также известные как *Sclerotinia homoeocarpa*); *Rhizoctonia* spp. (такие как *Rhizoctonia solani* и *Rhizoctonia oryzae*); патогены из рода *Fusarium*, такие как

10 *Fusarium roseum*, *Fusarium graminearum* и *Fusarium oxysporum*; *Verticillium dahliae*; *Sclerotium rolfsii*; *Rhynchosporium secalis*; *Cercosporidium personatum*, *Cercospora arachidicola* и *Cercospora beticola*; *Rhizopus* spp. (такие как *Rhizopus stolonifer*); *Aspergillus* spp. (такие как *Aspergillus flavus* и *Aspergillus parasiticus*) и другие роды и виды, близкородственные этим патогенам. В дополнение к своей фунгицидной активности, композиции или комбинации также

15 обладают активностью против бактерий, таких как *Erwinia amylovora*, *Xanthomonas campestris*, *Pseudomonas syringae* и другие родственные виды. В связи с контролем вредоносных микроорганизмов соединения по настоящему изобретению применимы для улучшения (т.е. увеличения) отношения полезных микроорганизмов к вредоносным микроорганизмам, контактирующим с культурными растениями или их частями для

20 размножения (например, семенами, клубнелуковицами, луковицами, клубнями, черенками) или с агрономической окружающей средой культурных растений или их частей для размножения.

Соединения по настоящему изобретению применимы при обработке семян для защиты семян от болезней растений. В контексте настоящего описания и формулы

25 изобретения обработка семени означает обеспечение контакта семени с биологически эффективным количеством соединения по настоящему изобретению, которое обычно составляют в виде композиции по настоящему изобретению. Обработка семени защищает семя от почвенных вредителей и, как правило, также может защищать корни и другие части растения, контактирующие с почвой вокруг проростка, развивающегося

30 из прорастающего семени. Обработка семени может также обеспечивать защиту листы посредством перенесения соединения по настоящему изобретению или второго активного ингредиента на развивающееся растение. Обработки семени можно применять ко всем типам семян, включая те, из которых прорастают растения, генетически трансформированные для экспрессии специализированных признаков. Характерные

35 примеры включают таковые, экспрессирующие белки, токсичные для беспозвоночных вредителей, такие как токсин *Bacillus thuringiensis*, или таковые, экспрессирующие факторы устойчивости к гербицидам, такие как глифосатацетилтрансфераза, которая обеспечивает устойчивость к глифосату. Обработка семени соединениями по настоящему изобретению может также повысить силу роста растений, вырастающих из семени.

40 Соединения по настоящему изобретению и их композиции, как по-отдельности, так и в комбинации с другими фунгицидами, нематоцидами и инсектицидами, особенно применимы при обработке семян сельскохозяйственных культур, включая без ограничений маис или кукурузу, сою, хлопчатник, зерновые культуры (например, пшеницу, овес, ячмень, рожь и рис), виды картофеля, овощи и масличный рапс.

45 Кроме того, соединения по настоящему изобретению применимы при обработке от вызванных грибами и бактериями болезней, проявляющихся после сбора урожая на фруктах и овощах. Эти инфекции могут возникать до, во время и после сбора урожая. Например, инфекции могут возникать до сбора урожая, а затем остаются неактивными

до некоторого момента времени в ходе созревания (например, у хозяина начинаются такие изменения в тканях, что инфекция может развиваться); инфекции также могут возникать в результате ранений на поверхности, образуемых механическим повреждением или повреждением от насекомого. В этом отношении соединения по настоящему изобретению могут сократить потери (т.е. потери в количестве и качестве) вследствие болезней, проявляющихся после сбора урожая, которые могут возникать в любой момент времени от сбора урожая до потребления. Обработка от болезней, проявляющихся после сбора урожая, соединениями по настоящему изобретению может увеличивать период времени, в течение которого скоропортящиеся съедобные части растений (например, плоды, семена, листва, стебли, луковицы, клубни) можно хранить замороженными или незамороженными после сбора урожая, и они при этом остаются съедобными и не имеют заметного или вредного разрушения или загрязнения грибами или другими микроорганизмами. Обработка съедобных частей растений до или после сбора урожая соединениями по настоящему изобретению может также уменьшить образование токсичных метаболитов грибов или микроорганизмов, например, микотоксинов, таких как афлатоксины.

Соединения по настоящему изобретению, как полагают, обеспечивают защиту от патогенных для растений грибов посредством ингибирования комплекса II (сукцинатдегидрогеназного) дыхательной цепи грибов путем разрушения ключевого фермента в цикле Кребса (цикле ТСА) под названием сукцинатдегидрогеназа (SDH). SDH состоит из четырех кодируемых в ядре полипептидов, идентифицированных как SDHA, SDHB, SDHC и SDHD. Ингибирование дыхания блокирует образование в грибе АТФ и таким образом ингибирует рост и размножение. На молекулярном уровне карбоксамиды ингибируют восстановление убихинона, связываясь участком связывания убихинона (участок Qp), образованным субъединицами SDHB, SDHC и SDHD в ферменте SDH. Международный комитет по устойчивости к фунгицидам (FRAC) определил химические соединения, характеризующиеся таким фунгицидным механизмом действия, как “SDHI”, как сокращение от ингибиторов сукцинатдегидрогеназы, и отнес их к категории FRAC Code 7.

В настоящее время известен ряд мутаций в субъединицах SDHB, SDHC и SDHD, образующих участок связывания убихинона, вызывающих устойчивость к SDHI. FRAC на своем веб-сайте опубликовал “Список видов грибов со свидетельствами их устойчивости в отношении SDHI-фунгицидов и мутаций в гене сукцинатдегидрогеназы (обновленный в марте 2012 года)” (<http://frac.info/frac/work/List%20of%20SDHI%20resistant%20species.pdf>, доступный с 28 июня 2012 года), который включает как мутантов, полученных в лаборатории с помощью искусственного мутагенеза, так и встречающихся в природе мутантов, обнаруженных в поле, проявляющих устойчивость к SDHI. В Scalliet et al., “Mutagenesis and Functional Studies with Succinate Dehydrogenase Inhibitors in the Wheat Pathogen *Mycosphaerella graminicola*”, PLoS ONE, 2012, 7(4), 1-20 (опубликованном в формате Adobe Acrobat file как [journal.pone.0035429.pdf](http://www.plosone.org/article/info%3Adoi%2F10.1371%2Fjournal.pone.0035429) и доступном по ссылке <http://www.plosone.org/article/info%3Adoi%2F10.1371%2Fjournal.pone.0035429> за 28 июня 2012 года) описываются дополнительные мутантные *Mycosphaerella graminicola*. В данных публикациях раскрываются патогенные грибы, включающие известные устойчивые мутанты, они включают *Alternaria alternata* (SDHB: H277Y, H277R; SDHC: H134R; SDHD: D123E, H133R), *Aspergillus oryzae* (SDHB: H249Y, H249L, H249N; SDHC: T90I; SDHD: D124E), *Botrytis cinerea* (SDHB: P225L, P225T, P225F, H272Y, H272R, H272L, N230I; SDHD: H132R), *Botrytis elliptica* (SDHB: H272Y, H272R), *Corynespora cassiicola* (SDHB: H287Y, H287R; SDHC: S73P,

SDHD: S89P), *Didymella bryoniae* (SDHB: H277R, H277Y), *Mycosphaerella graminicola* (SDHB: S218F, P220T, P220L, S221P, N225H, N225I, R265P, H267L, H267N, H267R, H267Q, H267Y, I269V, N271K; SDHC: T79I, S83G, A84V, A84I, L85P, N86K, R87C, V88D, H145R, H152R; SDHD: D129E, D129G, D129S, D129T, H139E), *Podosphaera xanthii* (SDHB: H[???]Y),
 5 *Sclerotinia sclerotiorum* (SDHD: H132R), *Ustilago maydis* (SDHB: H257L), *Stemphylium botryose* (SDHB: P225L, H272Y, H272R) и *Ustilago maydis* (SDHB: H257L), где буква слева обозначает аминокислоту в субъединице распространенного фермента дикого типа, число обозначает положение аминокислоты в субъединице, а буква справа обозначает аминокислоту в мутантной субъединице (аминокислоты указаны посредством
 10 стандартных однобуквенных кодов; см., например, <http://www.bio.davidson.edu/Biology/aatable.html>, доступный с 28 июня 2012 года). Поскольку в обмене веществ других патогенных грибов, таких как *Septoria tritici*, также участвует сукцинатдегидрогеназа, существование устойчивых к SDHI мутантов для них также возможно.

Примечательно, что соединения по настоящему изобретению, в частности, когда G
 15 представляет собой N или R^{2a} представляет собой H, кольцо, содержащее G, замещено по меньшей мере одним из вариантов R², сохраняют достаточную активность против мутантных патогенных грибов, высокоустойчивых к другим SDHI, таким образом, что соединения по настоящему изобретению остаются агрономически применимыми для
 20 защиты растений против мутантных патогенов, а также патогенов дикого типа. Улучшенную эффективность соединений по настоящему изобретению по сравнению с другими SDHI-фунгицидами для контроля болезни растения, вызванной устойчивыми к SDHI патогенными грибами, может быть определена с помощью простого тестирования контроля болезни растения, например, с помощью тестов, аналогичных
 25 тестам A-H, раскрытым в данном документе, но с использованием устойчивых к SDHI патогенных грибов, вместо патогенных грибов дикого типа.

Соединения формулы 1, в частности, где L представляет собой
 $-C(R^{12a})R^{12b}-C(R^{13a})R^{13b}-$, не только обладают активностью против организмов, т.е. патогенов, вызывающих грибковые болезни, но также активностью против нематод,
 30 питающихся растениями (т.е. растительноядных нематод). Среди таких соединений для контроля растительноядных нематод следует особо отметить соединения, где A представляет собой A-1. Растительноядные нематоды живут и питаются на поверхности (т.е. эктопаразитарные) или внутри (т.е. эндопаразитические) частей растения (например, листья, плоды, стеблей, корней или семян) и тем самым повреждают растущие и
 35 хранящиеся агрономические сельскохозяйственные культуры, лесохозяйственные, тепличные сельскохозяйственные культуры, декоративные растения и сельскохозяйственные культуры, служащие защитой. Примеры растительноядных нематод включают оба класса, *Adenophorea* и *Secernentea*, из типа нематод, включая экономически важных представителей отрядов *Enoplida*, *Dorylaimida*, *Rhabditida*,
 40 *Strongylida*, *Ascarida*, *Oxyurida*, *Spirurida*, *Tylenchida* и *Aphelenchida*, таких как, без ограничений, экономически важные вредители сельскохозяйственных культур, такие как галловые нематоды из рода *Meloidogyne*, цистообразующие нематоды из рода *Heterodera* и *Globodera*, ранящие нематоды из рода *Pratylenchus*, почковидные нематоды из рода *Rotylenchulus*, сверлящие нематоды из рода *Radopholus*, жалящие нематоды из
 45 рода *Belonolaimus*, спиральные нематоды из рода *Helicotylenchus* и *Scutellonema*, цитрусовые нематоды из рода *Tylenchulus*, вызывающие тупоконечность корней нематоды из рода *Trichodorus* и *Paratrichodorus*, игольчатые нематоды из рода *Longidorus*, ланцетовидные нематоды из рода *Hoplolaimus* и стеблевые нематоды из рода *Ditylenchus*.

Следует отметить применение соединений по настоящему изобретению для контроля южной галловой нематоды (*Meloidogyne incognita*). Специалистам в данной области техники будет понятно, что не все соединения одинаково эффективны против всех нематод на всех стадиях роста.

5 Более того, применение соединений формулы 1 может дополнительно улучшить контроль растительноядных нематод у растений, обладающих обусловленной наследственными факторами устойчивостью к нематодам. Следует отметить применение биологически эффективного количества соединения формулы 1 по отношению к
10 растению (например, сельскохозяйственной культуре), содержащему один или несколько генов устойчивости к нематодам, таких как те, которые раскрыты в публикациях заявок на патент США US 2004/0197916 A1, US 2005/0049410 A1, US 2006/0102610 A1, US 2006/0212965 A1, US 2006/0242732 A1, US 2007/0044178 A1, US 2007/0294787 A1, US 2008/0070829 A1, US 2009/0099081 A1, US 2009/0126044 A1, US 2009/0144852 A1, US 2010/0004176 A1, US 2010/0005543 A1, US 2010/0166723 A1, US 2010/0197592 A1 и US 2011/0023184 A1 и патентных публикациях по PCT WO 2005/012340 A1, WO 2005/082932 A2, WO 2006/020821 A2, WO 2007/095469 A2, WO 2007/104570 A2, WO 2008/071726 A2, WO 2008/077892 A1, WO 2008/095886 A1, WO 2008/095889 A1, WO 2008/095910 A1, WO 2008/095911 A2, WO 2008/095916 A1, WO 2008/095919 A1, WO 2008/095969 A1, WO 2008/095970 A1, WO 2008/095972 A1, WO 2008/110522 A1, WO 2008/152008 A2, WO 2009/027313 A2,
15 WO 2009/027539 A2 и WO 2009/048847 A1. Следует особо отметить применение биологически эффективного количества соединения формулы 1 по отношению к растению, содержащему один или несколько из следующих генов: Hs1^{pro-1}, Mi-1, Mi-1.2, Hero A, Gpa2, Gro1-4, Rhg1, Rhg4, Mi-3, Mi-9, Cre1, Cre3, Ma, Hsa-1^{Og}, Me3, Rmc1, CLAVATA3-подобных пептидов (например, SYV46).
20

25 Посредством обработки соединениями формулы 1, в частности, где L представляет собой -C(R^{12a})R^{12b}-C(R^{13a})R^{13b}-, также можно предотвращать или лечить инфекции, вызванные паразитическими нематодами, у животных и людей (например, сосудистой или пищеварительной систем или других тканей). Примеры паразитических нематод, наносящих вред здоровью животных и людей, включают экономически важных круглых червей, таких как *Strongylus vulgaris* у лошадей, *Toxocara canis* у собак, *Haemonchus contortus* у овец, *Dirofilaria immitis* у собак и *Ascaris lumbricoides* у людей.
30

Контроль болезней растений обычно осуществляют путем применения эффективного количества соединения по настоящему изобретению либо до, либо после инфицирования по отношению к части растения, подлежащей защите, такой как корни, стебли, листва,
35 плод, семена, клубни или луковицы, или по отношению к среде (почве или песку), в которой растут растения, подлежащие защите. Соединения можно также применять по отношению к семенам для защиты семян и проростков, развивающихся из семян. Соединения можно также применять через поливную воду для обработки растений.

40 Соответственно, этот аспект настоящего изобретения можно также описать как способ защиты растения или семени растения от болезней, вызванных патогенными грибами, включающий применение фунгицидно эффективного количества соединения формулы 1, его N-оксида или соли по отношению к растению (или его части) или семени растения (непосредственно или через окружающую среду (например, среду для
45 выращивания) растения или семени растения).

Контроль патогенов, проявляющих активность после сбора урожая, которые инфицируют продукцию до сбора урожая, как правило, осуществляют путем применения соединения по настоящему изобретению в полевых условиях и в случаях, когда инфекция

возникает после сбора урожая, соединения можно применять по отношению к собранным культурным растениям в виде пропиток, распыляемых растворов, средств для окуливания, обработанных оберток и вкладышей в коробках.

Контроль растительоядных нематод с применением соединения по настоящему изобретению обычно осуществляют с помощью способов применения, аналогичных таковым, описанным для контроля болезней растений.

На нормы применения этих соединений (т.е. фунгицидно эффективное количество или нематоцидно эффективное количество) могут влиять такие факторы, как болезни растений или нематоды, подлежащие контролю, вид растения, подлежащего защите, влажность и температура окружающей среды, и их нужно определять в реальных условиях применения. Специалист в данной области техники может без труда определить посредством простого эксперимента фунгицидно эффективное количество, необходимое для желаемого уровня контроля болезней растений, или нематоцидно эффективное количество, необходимое для желаемого уровня контроля растительоядных нематод. Контроль болезней растений, вызванных патогенными грибами, может потребовать более высоких норм применения, если присутствует по меньшей мере одна мутация, вызывающая устойчивость к SDHI, но при этом нормы применения обычно остаются экономически приемлемыми для агрономического применения. Листья обычно могут быть защищены при обработке при норме от менее чем приблизительно 1 г/га до приблизительно 5000 г/га активного ингредиента. Семя и проростки обычно могут быть защищены при обработке семян при норме от приблизительно 0,001 г (чаще приблизительно 0,1 г) до приблизительно 10 г на килограмм семян.

Соединения по настоящему изобретению также можно смешивать с одним или несколькими другими биологически активными соединениями или средствами, включая фунгициды, инсектициды, нематоциды, бактерициды, акарициды, гербициды, антидоты гербицидов, регуляторы роста, такие как ингибиторы линьки насекомых и стимуляторы укоренения, хемотренизаторы, химические сигнальные вещества, репелленты, аттрактанты, феромоны, стимуляторы питания, питательные вещества растений, другие биологически активные соединения или энтомопатогенные бактерии, вирусы или грибы для образования многокомпонентного пестицида, что дает даже более широкий спектр сельскохозяйственной защиты. Таким образом, настоящее изобретение также относится к композиции, которая содержит соединение формулы 1 (в фунгицидно эффективном количестве) и по меньшей мере одно дополнительное биологически активное соединение или средство (в биологически эффективном количестве) и может дополнительно содержать по меньшей мере одно из поверхностно-активного вещества, твердого разбавителя или жидкого разбавителя. Другие биологически активные соединения или средства могут быть составлены в композиции, содержащие по меньшей мере одно из поверхностно-активного вещества, твердого вещества или жидкого разбавителя. Для смесей по настоящему изобретению одно или несколько других биологически активных соединений или средств можно составлять вместе с соединением формулы 1 с образованием премикса, или одно или несколько других биологически активных соединений или средств можно составлять по-отдельности с соединением формулы 1, и составы можно объединять вместе перед применением (например, в резервуаре распылителя) или, альтернативно, применять один за другим.

Как упоминалось в кратком описании настоящего изобретения, одним аспектом настоящего изобретения является фунгицидная композиция, содержащая (т.е. смесь или комбинация таковых) соединение формулы 1, его N-оксид или соль (т.е. компонент а) и по меньшей мере один другой фунгицид (т.е. компонент b). Следует отметить такую

комбинацию, в которой другой фунгицидный активный ингредиент имеет иное место приложения действия, чем соединение формулы 1. В определенных случаях комбинация, в которой по меньшей мере один другой фунгицидный активный ингредиент имеет сходный спектр контроля, но иное место приложения действия, будет особенно предпочтительной для преодоления устойчивости. Таким образом, композиция по настоящему изобретению может дополнительно содержать фунгицидно эффективное количество по меньшей мере одного дополнительного фунгицидного активного ингредиента, имеющего сходный спектр контроля, но иное место приложения действия.

Следует особо отметить композицию, которая помимо соединения формулы 1, компонента (a), включает в качестве компонента (b) по меньшей мере одно фунгицидное соединение, выбранное из группы, состоящей из классов (b1) фунгицидов на основе метилбензимидазолкарбамата (МВС); (b2) фунгицидов на основе дикарбоксимида; (b3) фунгицидов-ингибиторов деметилирования (DMI); (b4) фунгицидов на основе фениламида; (b5) фунгицидов на основе амина/морфолина; (b6) фунгицидов-ингибиторов биосинтеза фосфолипидов; (b7) фунгицидов на основе карбоксамида; (b8) фунгицидов на основе гидрокси(2-амино-)пиримидина; (b9) фунгицидов на основе анилинпиримидина; (b10) фунгицидов на основе N-фенилкарбамата; (b11) фунгицидов-ингибиторов внешнего хинон-связывающего участка (QoI); (b12) фунгицидов на основе фенилпиррола; (b13) фунгицидов на основе хинолина; (b14) фунгицидов-ингибиторов перекисного окисления липидов; (b15) фунгицидов-ингибиторов биосинтеза меланина, влияющих на редуктазу (MBI-R); (b16) фунгицидов-ингибиторов биосинтеза меланина, влияющих на дегидратазу (MBI-D); (b17) фунгицидов на основе гидроксианилида; (b18) фунгицидов-ингибиторов сквален-эпоксидазы; (b19) фунгицидов на основе полиоксина; (b20) фунгицидов на основе фенилмочевины; (b21) фунгицидов-ингибиторов внутреннего хинон-связывающего участка (QiI); (b22) фунгицидов на основе бензамида; (b23) фунгицидов-антибиотиков на основе енопиранурановой кислоты; (b24) фунгицидов-антибиотиков на основе гексопиранозила; (b25) фунгицидов-антибиотиков на основе глюкопиранозила, влияющих на синтез белка; (b26) фунгицидов-антибиотиков на основе глюкопиранозила, влияющих на трегалазу и биосинтез инозитола; (b27) фунгицидов на основе цианоацетамидоксима; (b28) фунгицидов на основе карбамата; (b29) фунгицидов, разобщающих окислительное фосфорилирование; (b30) фунгицидов на основе органических соединений олова; (b31) фунгицидов на основе карбоновой кислоты; (b32) гетероароматических фунгицидов; (b33) фунгицидов на основе фосфоната; (b34) фунгицидов на основе фталамовой кислоты; (b35) фунгицидов на основе бензотриазина; (b36) фунгицидов на основе бензол-сульфонамида; (b37) фунгицидов на основе пиридазинона; (b38) фунгицидов на основе тиофен-карбоксамида; (b39) фунгицидов на основе пиримидинамида; (b40) фунгицидов на основе амидов карбоновых кислот (САА); (b41) фунгицидов-антибиотиков на основе тетрациклина; (b42) фунгицидов на основе тиокарбамата; (b43) фунгицидов на основе бензамида; (b44) фунгицидов, индуцирующих защиту растения-хозяина; (b45) фунгицидов с контактной активностью, действующих на множество участков; (b46) иных фунгицидов, нежели фунгициды классов (b1)-(b45); и солей соединений классов (b1)-(b46).

Дополнительные описания этих классов фунгицидных соединений представлены ниже.

(b1) “Фунгициды на основе метилбензимидазолкарбамата (МВС)” (FRAC (Международный комитет по устойчивости к фунгицидам) код 1) ингибируют митоз посредством связывания с β -тубулином во время сборки микротрубочек. Ингибирование сборки микротрубочек может нарушать клеточное деление, транспорт внутри клетки

и структуру клетки. Метилбензимидазолкарбаматные фунгициды включают бензимидазольные и тиюфанатные фунгициды. Бензимидазолы включают беномил, карбендазим, фуберидазол и тиабендазол. Тиюфанаты включают тиюфанат и тиюфанат-метил.

5 (b2) “Фунгициды на основе дикарбоксимида” (FRAC код 2), как предполагают, ингибируют перекисное окисление липидов у грибов посредством воздействия на NADH цитохромом с редуктазой. Примеры включают хлзолинат, ипродион, процимидон и винклозолин.

(b3) “Фунгициды-ингибиторы деметилирования (DMI)” (FRAC код 3) ингибируют
10 C14-деметилазу, которая играет роль в образовании стеролов. Стероиды, такие как эргостерол, необходимы для структуры и функции мембраны, что делает их незаменимыми для развития функциональных клеточных стенок. Следовательно, воздействие этих фунгицидов приводит к ненормальному росту и в конечном счете к гибели чувствительных грибов. DMI-фунгициды разделены на несколько химических
15 классов: азолы (в том числе триазолы и имидазолы), пиримидины, пиперазины и пиридин. Триазолы включают азаконазол, битертанол, бромуконазол, ципроконазол, дифеноконазол, диниконазол (в том числе диниконазол-М), эпоксиконазол, этаконазол, фенбуконазол, флуквинконазол, флузилазол, флутриафол, гексаконазол, имибенконазол, ипконазол, метконазол, миклобутанил, пенконазол, пропиконазол, протиоконазол, квинконазол, симеконазол, тебуконазол, тетраконазол, триадимефон, триадименол,
20 тритиконазол, α -(1-хлорциклопропил)- α -[2-(2,2-дихлорциклопропил)этил]-1Н-1,2,4-триазол-1-этанол, rel-1-[(2R,3S)-3-(2-хлорфенил)-2-(2,4-дифторфенил)-2-оксиранил]метил]-1Н-1,2,4-триазол, rel-2-[(2R,3S)-3-(2-хлорфенил)-2-(2,4-дифторфенил)-2-оксиранил]метил]-1,2-дигидро-3Н-1,2,4-триазол-3-тион и rel-1-[(2R,3S)-3-(2-хлорфенил)
25 -2-(2,4-дифторфенил)-2-оксиранил]метил]-5-(2-пропен-1-илтио)-1Н-1,2,4-триазол. Имидазолы включают клотримазол, эконазол, имазалил, изоконазол, миконазол, окспокконазол, прохлораз, пефуразоат и трифлумизол. Пиримидины включают фенаримол, нуаримол и триаримол. Пиперазины включают трифорин. Пиридин
30 включают бутиобат, пирифенокс и (α S)-[3-(4-хлор-2-фторфенил)-5-(2,4-дифторфенил)-4-изоксазолил]-3-пиридинметанол. Биохимические исследования показали, что все из вышеупомянутых фунгицидов относятся к DMI-фунгицидам, как описано К. Н. Kuck et al. в Modern Selective Fungicides - Properties, Applications and Mechanisms of Action, Н. Lyr (Ed.), Gustav Fischer Verlag: New York, 1995, 205-258.

(b4) “Фунгициды на основе фениламида” (FRAC код 4) представляют собой
35 специфические ингибиторы РНК-полимеразы у грибов класса оомицетов. Чувствительные грибы, подвергнутые действию данных фунгицидов, проявляют пониженную способность включать уридин в рРНК. Рост и развитие чувствительных грибов предотвращают путем воздействия этого класса фунгицидов. Фениламидные фунгициды включают ацилаланиновые, оксазолидиноновые и бутиролактоновые
40 фунгициды. Ацилаланины включают беналаксил, беналаксил-М, фуралаксил, металаксил и металаксил-М (также известный как мефеноксам). Оксазолидиноны включают оксаксидил. Бутиролактоны включают офурас.

(b5) “Фунгициды на основе амина/морфолина” (FRAC код 5) ингибируют два целевых участка в биосинтетическом пути стеролов, $\Delta^8 \rightarrow \Delta^7$ изомеразу и Δ^{14} редуктазу. Стероиды,
45 такие как эргостерол, необходимы для структуры и функции мембраны, что делает их незаменимыми для развития функциональных клеточных стенок. Следовательно, воздействие этих фунгицидов приводит к ненормальному росту и в конечном счете к гибели чувствительных грибов. Амин/морфолиновые фунгициды (также известные как

не-DMI ингибиторы биосинтеза стерола) включают морфолиновые, пиперидиновые и спирокеталь-аминовые фунгициды. Морфолины включают альдиморф, додеморф, фенпропиморф, тридеморф и триморфамид. Пиперидины включают фенпропидин и пипералин. Спирокеталь-амины включают спироксамин.

5 (b6) “Фунгициды-ингибиторы биосинтеза фосфолипидов” (FRAC код 6) ингибируют рост грибов, воздействуя на биосинтез фосфолипидов. Фунгициды, действующие на биосинтез фосфолипидов, включают фунгициды на основе фосфоротиолата и дитиолана. Фосфоротиолаты включают эдифенфос, ипробенфос и пиразофос. Дитиоланы включают

10 (b7) “Фунгициды на основе карбоксамида” (FRAC код 7) ингибируют комплекс II (сукцинатдегидрогеназный) дыхательной цепи грибов путем разрушения ключевого фермента в цикле Кребса (ЦТК цикл), называемого сукцинатдегидрогеназа. Ингибирование дыхания блокирует образование в грибе АТФ и таким образом ингибирует рост и размножение. Фунгициды на основе карбоксамида включают

15 бензамид, фуранкарбоксамид, оксатиинкарбоксамид, тиазолкарбоксамид, пиразолкарбоксамид, пиридинкарбоксамид и тиофенкарбоксамид. Бензамиды включают беноданил, флутоланил и мепронил. Фуранкарбоксамины включают фенфурам. Оксатиинкарбоксамины включают карбоксин и оксикарбоксин. Тиазолкарбоксамины включают тифлузамид. Пиразолкарбоксамины включают бензовиндифлупир, биксафен,

20 фураметпир, изопиразам, флуксапироксад, пентиопирад, седаксан, N-[2-(1S,2R)-[1,1'-бициклопропил]-2-илфенил]-3-(дифторметил)-1-метил-1H-пиразол-4-карбоксамид, 3-(дифторметил)-N-(2,3-дигидро-1,1,3-триметил-1H-инден-4-ил)-1-метил-1H-пиразол-4-карбоксамид, пенфлуфен (N-[2-(1,3-диметилбутил)фенил]-5-фтор-1,3-диметил-1H-пиразол-4-карбоксамид), N-[2-(2,4-дихлорфенил)-2-метокси-1-метилэтил]-3-

25 (дифторметил)-1-метил-1H-пиразол-4-карбоксамид и N-циклопропил-3-(дифторметил)-5-фтор-1-метил-N-[[2-(1-метилэтил)фенил]метил]-1H-пиразол-4-карбоксамид. Пиридинкарбоксамины включают боскалид. Тиофенкарбоксамины включают изофетамид.

(b8) “Фунгициды на основе гидрокси(2-амино-)пиримидина” (FRAC код 8) ингибируют синтез нуклеиновых кислот посредством воздействия на аденозиндезаминазу. Примеры

30 включают бупиримат, диметиримол и этиримол.

(b9) “Фунгициды на основе анилинопиримидина” (FRAC код 9), как предполагают, ингибируют биосинтез аминокислоты метионина и нарушают секрецию гидролитических ферментов, которые лизируют клетки растения во время инфекции. Примеры включают

35 ципродинил, мепанипирим и пириметанил.

(b10) “Фунгициды на основе N-фенилкарбамата” (FRAC код 10) ингибируют митоз посредством связывания с β -тубулином и нарушения сборки микротрубочек. Ингибирование сборки микротрубочек может нарушать клеточное деление, транспорт

40 внутри клетки и структуру клетки. Примеры включают диэтофенкарб.

(b11) “Фунгициды-ингибиторы внешнего хинон-связывающего участка (QoI)” (FRAC code 11) ингибируют комплекс III митохондриальной дыхательной цепи у грибов, воздействуя на убихинолоксидазу. Окисление убихинола блокируется во “внешнем хинон-связывающем” (Qo) участке цитохром bc₁-комплекса, который расположен во

45 внутренней митохондриальной мембране грибов. Ингибирование митохондриальной дыхательной цепи препятствует нормальному росту и развитию грибов. Фунгициды-ингибиторы внешнего хинон-связывающего участка включают фунгициды на основе метоксиакрилата, метоксикарбамата, оксиминоацетата, оксиминоацетамида и дигидродиксазина (совместно также известные как фунгициды на основе стробилурина)

и оксазолидиндиона, имидазолинона и бензилкарбамата. Метоксиакрилаты включают азоксистробин, энестробури́н (SYP-Z071) и пикоксистробин. Метоксикарбаматы включают пиракlostробин и пираметостробин. Оксиминоацетаты включают крезоксиметил, пираоксистробин и трифлостробин. Оксиминоацетамиды включают димоксистробин, метоминостробин, ориастробин и α -[метоксиимино]-N-метил-2-[[[1-[3-(трифторметил)фенил]этокси]имино]метил]бензолацетамид. Дигидродиоксазины включают флуокастробин. Оксазолидиндионы включают фамоксадон. Имидазолиноны включают фенамидон. Бензилкарбаматы включают пирибенкарб. Класс (b11) также включает 2-[(2,5-диметилфенокси)метил]- α -метокси-N-бензолацетамид.

(b12) “Фунгициды на основе фенилпиррола” (FRAC код 12) ингибируют MAP-протеинкиназу, ассоциированную с осмотической сигнальной трансдукцией у грибов. Фенпиклонил и флудиоксонил являются примерами этого класса фунгицидов.

(b13) “Фунгициды на основе хинолина” (FRAC код 13), как предполагают, ингибируют сигнальную трансдукцию, воздействуя на G-белки в ранней передаче сигнала в клетке. Как было показано, они воздействуют на прорастание и/или образование аппрессория у грибов, что вызывает настоящую мучнистую росу. Квиноксифен является примером этого класса фунгицидов.

(b14) “Фунгициды-ингибиторы перекисного окисления липидов” (FRAC код 14), как предполагают, ингибируют перекисное окисление липидов, что нарушает синтез мембраны у грибов. Члены этого класса, такие как этридиязол, также могут нарушать другие биологические процессы, такие как дыхание и биосинтез меланина. Фунгициды, действующие на перекисное окисление липидов, включают фунгициды на основе ароматических углеводов и 1,2,4-тиадиазольные фунгициды. Фунгициды на основе ароматических углеводов включают бифенил, хлоронеб, диклоран, квинтозен, текназен и толклофос-метил. 1,2,4-Тиадиазолы включают этридиязол.

(b15) “Фунгициды-ингибиторы биосинтеза меланина, влияющие на редуктазу (MBI-R)” (FRAC код 16.1) ингибируют этап восстановления нафталена в биосинтезе меланина. Меланин требуется для инфицирования растения-хозяина некоторыми грибами. Фунгициды-ингибиторы биосинтеза меланина, влияющие на редуктазу, включают изобензофураноновые, пирролхинолиноновые и триазолобензотиазольные фунгициды. Изобензофураноны включают фталид. Пирролхинолиноны включают пироквилон. Триазолобензотиазолы включают трициклазол.

(b16) “Фунгициды-ингибиторы биосинтеза меланина, влияющие на дегидратазу (MBI-D)” (FRAC код 16.2) ингибируют сциталондегидратазу в биосинтезе меланина. Меланин требуется для инфицирования растения-хозяина некоторыми грибами. Фунгициды-ингибиторы биосинтеза меланина, влияющие на дегидратазу, включают циклопропанкарбоксамидные, карбоксамидные и пропионамидные фунгициды. Циклопропанкарбоксамиды включают карпропамид. Карбоксамиды включают диклоцимет. Пропионамиды включают феноксанил.

(b17) “Фунгициды на основе гидроксианилида (FRAC код 17) ингибируют C4-деметилазу, которая играет роль в образовании стеролов. Примеры включают фенгексамид.

(b18) “Фунгициды-ингибиторы сквален-эпоксидазы” (FRAC код 18) ингибируют сквален-эпоксидазу в пути биосинтеза эргостерола. Стеро́лы, такие как эргостерол, необходимы для структуры и функции мембраны, что делает их незаменимыми для развития функциональных клеточных стенок. Следовательно, воздействие этих фунгицидов приводит к ненормальному росту и в конечном счете к гибели чувствительных грибов. Фунгициды-ингибиторы сквален-эпоксидазы включают

тиокарбаматные и аллиламиновые фунгициды. Тиокарбаматы включают пирибутикарб. Аллиламины включают нафтинин и тербинафин.

(b19) “Фунгициды на основе полиоксина” (FRAC код 19) ингибируют хитинсинтазу. Примеры включают полиоксин.

5 (b20) “Фунгициды на основе фенилмочевины” (FRAC код 20), как предполагают, нарушают клеточное деление. Примеры включают пенцикурон.

(b21) “Фунгициды-ингибиторы внутреннего хинон-связывающего участка (QiI)” (FRAC код 21) ингибируют комплекс III митохондриальной дыхательной цепи у грибов, воздействуя на убихинолредуктазу. Восстановление убихинола блокируется во
10 “внутреннем хинон-связывающем” (Qi) участке цитохром bc₁-комплекса, который расположен во внутренней митохондриальной мембране грибов. Ингибирование митохондриальной дыхательной цепи препятствует нормальному росту и развитию грибов. Фунгициды-ингибиторы внутреннего хинон-связывающего участка включают цианоимидазоловые и сульфамойлтриазоловые фунгициды. Цианоимидазолы включают
15 циазофамид. Сульфамойлтриазолы включают амисулбром.

(b22) “Фунгициды на основе бензамида” (FRAC код 22) ингибируют митоз посредством связывания с β -тубулином и нарушения сборки микротрубочек. Ингибирование сборки микротрубочек может нарушать клеточное деление, транспорт
20 внутри клетки и структуру клетки. Примеры включают зоксамид.

(b23) “Фунгициды-антибиотики на основе енопиранурановой кислоты” (FRAC код 23) ингибируют рост грибов, воздействуя на биосинтез белка. Примеры включают бластицидин-S.

(b24) “Фунгициды-антибиотики на основе гексапиранозила” (FRAC код 24) ингибируют рост грибов, воздействуя на биосинтез белка. Примеры включают
25 касугамицин.

(b25) “Фунгициды-антибиотики на основе глюкопиранозила, влияющие на синтез белка” (FRAC код 25) ингибируют рост грибов, воздействуя на биосинтез белка. Примеры включают стрептомицин.

(b26) “Фунгициды-антибиотики на основе глюкопиранозила, влияющие на трегалазу
30 и биосинтез инозитола” (FRAC код 26) ингибируют трегалазу в пути биосинтеза инозитола. Примеры включают валидамицин.

(b27) “Фунгициды на основе цианоацетамидоксима (FRAC код 27) включают цимоксанил.

(b28) “Фунгициды на основе карбамата” (FRAC код 28) рассматривают как
35 ингибиторы роста грибов, действующие на множество участков. Они, как предполагают, воздействуют на синтез жирных кислот в клеточных мембранах, что затем нарушает проницаемость клеточной мембраны. Пропамакарб, йодокарб и протиокарб являются примерами этого класса фунгицидов.

(b29) “Фунгициды, разобщающие окислительное фосфорилирование” (FRAC код 29)
40 ингибируют дыхание грибов посредством разобщения окислительного фосфорилирования. Ингибирование дыхания препятствует нормальному росту и развитию грибов. Этот класс включает 2,6-динитроанилины, такие как флуазилам, пиримидонгидразоны, такие как феримзон, и динитрофенилкротонаты, такие как динокап, мептилдинокап и бинапакрил.

45 (b30) “Фунгициды на основе органических соединений олова” (FRAC код 30) ингибируют аденозинтрифосфат (АТФ) синтазу в пути окислительного фосфорилирования. Примеры включают фентинацетат, фентинхлорид и фентингидроксид.

(b31) “Фунгициды на основе карбоновых кислот” (FRAC код 31) ингибируют рост грибов, воздействуя на топоизомеразу дезоксирибонуклеиновой кислоты (ДНК) типа II (гиразу). Примеры включают оксолиновую кислоту.

(b32) “Гетероароматические фунгициды” (Международный комитет по устойчивости к фунгицидам (FRAC) код 32), как предполагают, нарушают синтез ДНК/рибонуклеиновой кислоты (РНК). Гетероароматические фунгициды включают изоксазолы и изотиазолы. Изоксазолы включают гимексазол, а изотиазолы включают октилинон.

(b33) “Фунгициды на основе фосфоната” (FRAC код 33) включают фосфористую кислоту и ее различные соли, в том числе фосетил-алюминий.

(b34) “Фунгициды на основе фталамовой кислоты” (FRAC код 34) включают теклофталам.

(b35) “Фунгициды на основе бензотриазина” (FRAC код 35) включают триазоксид.

(b36) “Фунгициды на основе бензол-сульфонамида” (FRAC код 36) включают флусульфамид.

(b37) “Фунгициды на основе пиридазинона” (FRAC код 37) включают дикломезин.

(b38) “Фунгициды на основе тиофен-карбоксамида” (FRAC код 38), как предполагают, нарушают образование АТФ. Примеры включают силтиофам.

(b39) “Фунгициды на основе пиримидинамида” (FRAC код 39) ингибируют рост грибов, воздействуя на биосинтез фосфолипидов, и включают дифлуметорим.

(b40) “Фунгициды на основе амидов карбоновых кислот (САА)” (FRAC код 40), как предполагают, ингибируют биосинтез фосфолипидов и образование клеточной стенки. Ингибирование этих процессов препятствует росту и приводит к гибели целевого гриба. Фунгициды на основе амидов карбоновых кислот включают фунгициды на основе амидов коричной кислоты, валинамида и других карбаматов и амидов миндальной кислоты. Амиды коричной кислоты включают диметоморф и флуморф. Валинамид и другие карбаматы включают бентиаваликарб, бентиаваликарб-изопропил, ипроваликарб, толпрокарб и валифеналат (валифенал). Амиды миндальной кислоты включают мандипропамид, N-[2-[4-[[3-(4-хлорфенил)-2-пропин-1-ил]окси]-3-метоксифенил]этил]-3-метил-2-[(метилсульфонил)амино]бутанамид и N-[2-[4-[[3-(4-хлорфенил)-2-пропин-1-ил]окси]-3-метоксифенил]этил]-3-метил-2-[(этилсульфонил)амино]бутанамид.

(b41) “Фунгициды-антибиотики на основе тетрациклина” (FRAC код 41) ингибируют рост грибов, воздействуя на комплекс 1 никотинамидадениндинуклеотид (NADH) оксидоредуктазы. Примеры включают окситетрациклин.

(b42) “Фунгициды на основе тиокарбамата” (FRAC код 42) включают метасульфокарб.

(b43) “Фунгициды на основе бензамида” (FRAC код 43) ингибируют рост грибов посредством делокализации спектрин-подобных белков. Примеры включают ацилпиколидные фунгициды, такие как флуопиколид и флуопирам.

(b44) “Фунгициды, индуцирующие защиту растения-хозяина” (FRAC код P) индуцируют защитные механизмы растения-хозяина. Фунгициды, индуцирующие защиту растения-хозяина, включают фунгициды на основе бензотиадиазолов, бензизотиазола и тиадиазол-карбоксамида. Бензотиадиазолы включают ацибензолар-S-метил. Бензизотиазолы включают пробеназол. Тиадиазол-карбоксамиды включают тиадинил и изотианил.

(b45) “Фунгициды с контактной активностью, действующие на множество участков” ингибируют рост грибов через множество участков приложения действия и обладают контактной/профилактической активностью. Этот класс фунгицидов включает: (b45.1)

“фунгициды на основе меди” (FRAC код M1)”, (b45.2) “фунгициды на основе серы” (FRAC код M2), (b45.3) “фунгициды на основе дитиокарбамата” (FRAC код M3), (b45.4) “фунгициды на основе фталимида” (FRAC код M4), (b45.5) “фунгициды на основе хлорнитрила” (FRAC код M5), (b45.6) “фунгициды на основе сульфида” (FRAC код M6), (b45.7) “фунгициды на основе гуанидина” (FRAC код M7), (b45.8) “фунгициды на основе триазиона” (FRAC код M8) и (b45.9) “фунгициды на основе хинона” (FRAC код M9). “Фунгициды на основе меди” представляют собой неорганические соединения, содержащие медь, как правило, в окисленном состоянии медь(II); примеры включают оксихлорид меди, сульфат меди и гидроксид меди, в том числе композиции, такие как бордоская смесь (трехосновный сульфат меди). “Фунгициды на основе серы” представляют собой неорганические химические вещества, содержащие кольца или цепи из атомов серы; примеры включают элементарную серу. “Дитиокарбаматные фунгициды” содержат фрагмент молекулы дитиокарбамата; примеры включают манкозеп, метирам, пропинеб, фербам, манеб, тирам, цинеб и цирам. “Фталимидные фунгициды” содержат фрагмент молекулы фталимида; примеры включают фолпет, каптан и каптафол. “Хлорнитрильные фунгициды” содержат замещенные хлором и циано ароматические кольца; примеры включают хлороталонил. “Фунгициды на основе сульфида” включают дихлофлуанид и толифлуанид. “Фунгициды на основе гуанидина” включают додин, гуазатин, иминоктадин албесилат и иминоктадин триацетат. “Триазиновые фунгициды” включают анилазин. “Хиноновые фунгициды” включают дитианон.

(b46) “Иные фунгициды, нежели фунгициды классов (b1)-(b45)” включают определенные фунгициды, механизм действия которых может быть неизвестен. Они включают: (b46.1) “фунгициды на основе тиазолкарбоксамидов” (FRAC код U5), (b46.2) “фунгициды на основе фенил-ацетамида” (FRAC код U6), (b46.3) “фунгициды на основе хиназолинона” (FRAC код U7), (b46.4) “фунгициды на основе бензофенона” (FRAC код U8), (b46.5) “фунгициды на основе триазолопиримидина” и (b46.6) соединения, которые связываются с оксистерол-связывающимся белком, как описано в патентной публикации по РСТ WO 2013/009971. Тиазолкарбоксамиды включают этабоксам. Фенил-ацетамиды включают цифлуфенамид и N-[[[циклопропилметокси]амино][6-(дифторметокси)-2,3-дифторфенил]-метил]бензолацетамид. Хиназолиноны включают проквиназид. Бензофеноны включают метрафенон. Триазолопиримидины включают аметоктрадин. Класс (b46.6) включает 1-[4-[4-[5-(2,6-дифторфенил)-4,5-дигидро-3-изоксазолил]-2-тиазолил]-1-пиперидинил]-2-[5-метил-3-(трифторметил)-1H-пиразол-1-ил]этанон. Класс (b46) также включает бетоксазин, флорметоквин, нео-азорин (метанарсонат железа), пириофенон, пирролнитрин, хинометионат, тебуфлорвин, N-[2-[4-[[3-(4-хлорфенил)-2-пропин-1-ил]окси]-3-метоксифенил]этил]-3-метил-2-[(метилсульфонил)амино]бутанамид, N-[2-[4-[[3-(4-хлорфенил)-2-пропин-1-ил]окси]-3-метоксифенил]этил]-3-метил-2-[(этилсульфонил)амино]бутанамид, (2Z)-2-[[2-фтор-5-(трифторметил)фенил]тио]-2-[3-(2-метоксифенил)-2-тиазолидинилиден]ацетонитрил (флутианил), 3-[5-(4-хлорфенил)-2,3-диметил-3-изоксазолидинил]пиримидин, 4-фторфенил N-[1-[[[1-(4-цианофенил)этил]сульфонил]метил]пропил]карбамат, 5-хлор-6-(2,4,6-трифторфенил)-7-(4-метилпиперидин-1-ил)[1,2,4]триазоло[1,5-a]пиримидин, N-(4-хлор-2-нитрофенил)-N-этил-4-метилбензолсульфонамид, N-[[[циклопропилметокси]амино][6-(дифторметокси)-2,3-дифторфенил]метил]бензолацетамид, N'-[4-[4-хлор-3-(трифторметил)феноксид]-2,5-диметилфенил]-N-этил-N-метилметанимидамид, S-2-пропен-1-ил-5-амино-2,3-дигидро-2-(1-метилэтил)-4-(2-метилфенил)-3-оксо-1H-пиразол-1-карботиоат (фенпиразамин), N'-[4-[[3-[(4-хлорфенил)метил]-1,2,4-тиадиазол-5-ил]окси]-2,5-диметилфенил]-N-этил-

N-метил-метанимидаид, 1,1-диметилэтил N-[6-[[[(1-метил-1H-тетразол-5-ил) фенилметиле]амино]окси]метил]-2-пиридирил]карбамат, 3-бутин-1-ил N-[6-[[[(1-метил-1H-тетразол-5-ил) фенилметиле]амино]окси]метил]-2-пиридирил]карбамат, 2,6-диметил-1H,5H-[1,4]дитиино[2,3-с:5,6-с']дипиррол-1,3,5,7(2H,6H)-тетрон, 5-фтор-2-[(4-метилфенил) метокси]-4-пиримидинамин и 5-фтор-2-[(4-фторфенил) метокси]-4-пиримидинамин. Класс (b46) дополнительно включает фунгициды, ингибирующие митоз и клеточное деление, помимо фунгицидов конкретных классов, описанных выше (например, (b1), (b10) и (b22)).

Таким образом, следует особо отметить смесь (т.е. композицию), содержащую в качестве компонента (a) соединение формулы 1 (или его N-оксид или соль) и в качестве компонента (b) по меньшей мере одно фунгицидное соединение, выбранное из группы, состоящей из вышеописанных классов (b1)-(b46). Также следует отметить варианты осуществления, где компонент (b) включает по меньшей мере один фунгицид из каждой из двух различных групп, выбранных из (b1)-(b46). Также следует отметить композицию, содержащую указанную смесь (в фунгицидно эффективном количестве) и дополнительно содержащую по меньшей мере один дополнительный компонент, выбранный из группы, состоящей из поверхностно-активных веществ, твердых разбавителей и жидких разбавителей. Следует особо отметить смесь (т.е. композицию), содержащую соединение формулы 1 и по меньшей мере одно фунгицидное соединение, выбранное из группы конкретных соединений, перечисленных выше вместе с классами (b1)-(b46). Также следует особо отметить композицию, содержащую указанную смесь (в фунгицидно эффективном количестве) и дополнительно содержащую по меньшей мере одно дополнительное поверхностно-активное вещество, выбранное из группы, состоящей из поверхностно-активных веществ, твердых разбавителей и жидких разбавителей.

Примеры фунгицидов компонента (b) включают ацибензолар-S-метил, альдиморф, аметоктрадин, амисулбром, анилазин, азаконазол, азоксистробин, беналаксил (в том числе беналаксил-M), беноданил, беномил, бентиаваликарб (в том числе бентиаваликарб-изопропил), бензовиндифлупир, бетоксазин, бинапакрил, бифенил, битертанол, биксафен, бластицидин-S, боскалид, бромуконазол, бупиримат, бутиобат, каптафол, каптан, карбендазим, карбоксин, карпропамид, хлорнеб, хлороталонил, хлозолинат, клотримазол, гидроксид меди, оксихлорид меди, сульфат меди, циазофамид, цифлуфенамид, цимоксанил, ципроконазол, ципродинил, дихлофлуанид, диклоцимет, дикломезин, диклоран, диэтофенкарб, дифеноконазол, дифлуметорим, диметиримол, диметоморф, димоксистробин, диниконазол (в том числе диниконазол-M), динокап, дитианон, дитиоланы, додеморф, додин, эконазол, эдифенфос, энестробурин, эпоксиконазол, этаконазол, этабоксам, этиримол, этридиязол, этридиязол, фамоксадон, фенаримол, фенамидон, фенбуконазол, фенфурам, фенгексамид, феноксанил, фенпиклонил, фенпропидин, фенпропиморф, фенпиразамин, фентинацетат, фентинхлорид, фентингидроксид, фербам, феримзон, флометоквин, флуазинам, флудиоксонил, флуморф, флуопиколоид, флуопирам, флуоксастробин, флуквинконазол, флузилазол, флусульфамид, флутианил, флутоланил, флутриафол, флуксапироксад, фолпет, фталид, фуберидазол, фуралаксил, фураметпир, гуазатин, гексаконазол, гимексазол, имазалил, имибенконазол, иминоктадин албезилат, иминоктадин триацетат, иодокарб, ипконазол, ипробенфос, ипродион, ипроваликарб, изоконазол, изофетамид, изопропиолан, изопиразам, изотианил, касугамицин, крезоксим-метил, манкозеп, манеб, мепанипирим, мепронил, мептилдинокап, металаксил (в том числе металаксил-M/ мефеноксам), метконазол, метасульфоккарб, метирам, метоминостробин, метрафенон, миконазол, миклобутанил, нафтифин, нео-азорин, нуаримол, октилинон, офурас,

орисастробин, оксадиксил, оксолиновую кислоту, окспоконазол, оксикарбоксин, окситетрациклин, пефуразоат, пенконазол, пенцикурон, пенфлуфен, пентиопирад, фосфористую кислоту (в том числе ее соли, например, фосетил-алюминий), пикоксистробин, пипералин, полиоксин, пробеназол, прохлораз, процимидон, пропамакарб, пропиконазол, пропинеб, проквиназид, протиокарб, протиоконазол, 5 пираклостробин, пираметостробин, пираоксистробин, пиразофос, пирибенкарб, пирибутикарб, пирифенокс, пиримэтанил, пириофенон, пироквилон, пирролнитрин, квинконазол, хинометионат, квиноксифен, квинтозен, силтиофам, симеконазол, спироksamин, стрептомицин, серу, тебуконазол, тебуфлоквин, тебуфлоквин, 10 теклофталам, текназен, тербинафин, тетраконазол, тиабендазол, тифлузамид, тиофанат, тиофанат-метил, тирам, тиадинил, толклофос-метил, толпрокарб, толилфлуанид, триадимефон, триадименол, триаримол, тритиконазол, триазоксид, трехосновный сульфат меди, трициклазол, тридеморф, трифлуксистробин, трифлумизол, трифорин, триморфамид, ункаоназол, валидамицин, валифеналат, валифенал, винклозолин, цинеб, 15 цирам, зоксамид, α -(1-хлорциклопропил)- α -[2-(2,2-дихлорциклопропил)этил]-1Н-1,2,4-триазол-1-этанол, N-циклопропил-3-(дифторметил)-5-фтор-1-метил-N-[[2-(1-метилэтил)фенил]метил]-1Н-пиразол-4-карбоксамид, N-[2-(2,4-дихлорфенил)-2-метокси-1-метилэтил]-3-(дифторметил)-1-метил-1Н-пиразол-4-карбоксамид, 3-(дифторметил)-N-(2,3-дигидро-1,1,3-триметил-1Н-инден-4-ил)-1-метил-1Н-пиразол-4-карбоксамид, 1,1-диметилэтил-20 N-[6-[[[(1-метил-1Н-тетразол-5-ил)фенилметил]амино]окси]метил]-2-пиридинил]карбамат, 1-[4-[4-[5-(2,6-дифторфенил)-4,5-дигидро-3-изоксазолил]-2-тиазолил]-1-пиперидинил]-2-[5-метил-3-(трифторметил)-1Н-пиразол-1-ил]этанон, 2,6-диметил-1Н,5Н-[1,4]дитиино[2,3-с:5,6-с']дипиррол-1,3,5,7(2Н,6Н)-тетрон, 2-[(2,5-диметилфенокси)метил]- α -метокси-N-бензолацетамид, 3-[5-(4-хлорфенил)-2,3-диметил-3-изоксазолидинил] 25 пиридин, 3-бутин-1-ил N-[6-[[[(1-метил-1Н-тетразол-5-ил)фенилметил]амино]окси]метил]-2-пиридинил]карбамат, 4-фторфенил N-[1-[[[1-(4-цианофенил)этил]сульфонил]метил]пропил]карбамат, 5-хлор-6-(2,4,6-трифторфенил)-7-(4-метилпиперидин-1-ил)[1,2,4]триазоло[1,5-а]пиримидин, 5-фтор-2-[(4-фторфенил)метокси]-4-пиримидинамин, 5-фтор-2-[(4-метилфенил)метокси]-4-пиримидинамин, N-(4-хлор-2-нитрофенил)-N-этил-30 4-метилбензолсульфонамид, N-[(циклопропилметокси)амино][6-(дифторметокси)-2,3-дифторфенил]метил]бензолацетамид, N-[(циклопропилметокси)амино][6-(дифторметокси)-2,3-дифторфенил]-метил]бензолацетамид, N-[2-(1S,2R)-[1,1'-бициклопропил]-2-илфенил]-3-(дифторметил)-1-метил-1Н-пиразол-4-карбоксамид, (α S)-[3-(4-хлор-2-фторфенил)-5-(2,4-дифторфенил)-4-изоксазолил]-3-пиридинметанол, N-[2-[4-[3-(4-хлорфенил)-2-пропин-1-ил]окси]-3-метоксифенил]этил]-3-метил-2-[(метилсульфонил)амино]бутанамид, N-[2-[4-[3-(4-хлорфенил)-2-пропин-1-ил]окси]-3-метоксифенил]этил]-3-метил-2-[(этилсульфонил)амино]бутанамид, N-[2-[4-[3-(4-хлорфенил)-2-пропин-1-ил]окси]-3-метоксифенил]этил]-3-метил-2-[(метилсульфонил)амино]бутанамид и N-[2-[4-[3-(4-хлорфенил)-2-пропин-1-ил]окси]-3-метоксифенил] 40 этил]-3-метил-2-[(этилсульфонил)амино]бутанамид, N'-[4-[3-[(4-хлорфенил)метил]-1,2,4-тиадиазол-5-ил]окси]-2,5-диметилфенил]-N-этил-N-метил-метанимидамид, N'-[4-[4-хлор-3-(трифторметил)фенокси]-2,5-диметилфенил]-N-этил-N-метилметанимидамид, α -[метоксиимино]-N-метил-2-[[[1-[3-(трифторметил)фенил]этокси]имино]метил]бензолацетамид, rel-1-[(2R,3S)-3-(2-хлорфенил)-2-(2,4-дифторфенил)-2-оксиранил]метил]-1Н-1,2,4-триазол, rel-2-[(2R,3S)-3-(2-хлорфенил)-2-(2,4-дифторфенил)-2-оксиранил]метил]-1,2-дигидро-3Н-1,2,4-триазол-3-тион и rel-1-[(2R,3S)-3-(2-хлорфенил)-2-(2,4-дифторфенил)-2-оксиранил]метил]-5-(2-пропен-1-илтио)-1Н-1,2,4-триазол. Таким образом, следует отметить фунгицидную композицию, содержащую в качестве

компонента (а) соединение формулы 1 (или его N-оксид или соль) и в качестве компонента (б) по меньшей мере один фунгицид, выбранный из вышеуказанного перечня.

В качестве особенно применимых объектов смеси (т.е. компонента (б) в композициях) в комбинации с соединениями формулы 1 (или их N-оксидом или солью) (т.е. компонента (а)) для контроля болезней листьев растений следует отметить азоксистробин, бензовиндифлупир, биксафен, каптан, карпропамид, хлороталонил, соли меди (в том числе гидроксид меди(II)), цимоксанил, ципроконазол, ципродинил, диэтофенкарб, дифеноконазол, диметоморф, эпоксиконазол, этабоксам, фенаримол, фенгексамид, флуазилам, флудиоксонил, флуопирам, флузилазол, флутианил, флутриафол, флуксопирад, фолпет, ипродион, изофетамид, изопиразам, крезоксим-метил, манкозеп, мептилдинокап, металаксил, метконазол, метрафенон, миклобутанил, пенфлуфен, пентиопирад, фосфористую кислоту (в том числе ее соли), пикоксистробин, пропиконазол, проквиназид, протиоконазол, пираклостробин, пириметанил, седаксан, спирокамин, серу, тебуконазол, тиофанат-метил, трифлуксистробин, зоксамид, 3-бутин-1-ил N-[6-[[[(Z)-[(1-метил-1H-тетразол-5-ил)фенилметил]амино]окси]метил]-2-пиридирил]карбамат, α -(1-хлорциклопропил)- α -[2-(2,2-дихлорциклопропил)этил]-1H-1,2,4-триазол-1-этанол, (α S)-[3-(4-хлор-2-фторфенил)-5-(2,4-дифторфенил)-4-изоксазолил]-3-пиридинметанол, 2-[[[(2S,3R)-3-(2-хлорфенил)-2-(2,4-дифторфенил)-2-оксиранил]метил]-1,2-дигидро-3H-1,2,4-триазол-3-тион, 1-[[[(2S,3R)-3-(2-хлорфенил)-2-(2,4-дифторфенил)-2-оксиранил]метил]-5-(2-пропен-1-илтио)-1H-1,2,4-триазол, 1-[[[(2S,3R)-3-(2-хлорфенил)-2-(2,4-дифторфенил)-2-оксиранил]метил]-1H-1,2,4-триазол, N'-[4-[[3-[(4-хлорфенил)метил]-1,2,4-тиадиазол-5-ил]окси]-2,5-диметилфенил]-N-этил-N-метил-метанимидаид, N-циклопропил-3-(дифторметил)-5-фтор-1-метил-N-[[2-(1-метилэтил)фенил]метил]-1H-пиразол-4-карбоксамид, N-[2-(2,4-дихлорфенил)-2-метокси-1-метилэтил]-3-(дифторметил)-1-метил-1H-пиразол-4-карбоксамид, 3-(дифторметил)-N-(2,3-дигидро-1,1,3-триметил-1H-инден-4-ил)-1-метил-1H-пиразол-4-карбоксамид, 1-[4-[4-[5-(2,6-дифторфенил)-4,5-дигидро-3-изоксазолил]-2-тиазолил]-1-пиперидинил]-2-[5-метил-3-(трифторметил)-1H-пиразол-1-ил]этанон, 2,6-диметил-1H,5H-[1,4]дитиино[2,3-с:5,6-с']дипиррол-1,3,5,7(2H,6H)-тетрон, 1,1-диметилэтил N-[6-[[[(Z)-[(1-метил-1H-тетразол-5-ил)фенилметил]амино]окси]метил]-2-пиридирил]карбамат, (α R)-2-[(2,5-диметилфеноксид)метил]- α -метокси-N-метилбензолацетамид, 5-фтор-2-[(4-метилфенил)метокси]-4-пиримидинамин и 5-фтор-2-[(4-фторфенил)метокси]-4-пиримидинамин. В комбинации с соединениями формулы 1 следует особо отметить метконазол или протиоконазол.

Также, следует отметить комбинации соединений формулы 1 (или их N-оксида или соли) (т.е. компонента (а) в композициях) с азоксистробином, крезоксим-метилом, трифлуксистробином, пираклостробином, пикоксистробином, пираметостробином, пираоксистробином, димоксистробином, метоминостробином/феноминостробином, карбендазимом, хлороталонилом, квиноксифеном, метрафеноном, цифлufenамидом, фенпропидином, фенпропиморфом, бромуконазолом, ципроконазолом, дифеноконазолом, эпоксиконазолом, фенбуконазолом, флузилазолом, флуксапироксадом, гексаконазолом, ипконазолом, метконазолом, пенконазолом, пропиконазолом, проквиназидом, протиоконазолом, пириофеноном, тебуконазолом, тритиконазолом, фамоксадоном, прохлоразом, пентиопирадом или боскалидом (никобифеном) (т.е. в качестве компонента (б) в композициях).

Предпочтительными для лучшего контроля болезней растений, вызванных патогенными для растений грибами, (например, более низкая норма применения или более широкий спектр контролируемых патогенов растений) или для преодоления

устойчивости являются смеси соединения по настоящему изобретению с фунгицидом, выбранным из группы азоксистробина, крезоксим-метила, трифлуксистробина, пираклостробина, пикоксистробина, пираметостробина, пироксистробина, димоксистробина, метоминостробина/феноминостробина, квиноксифена, метрафенона, 5 цифлуфенамида, фенпропицина, фенпропиморфа, ципроконазола, эпоксиконазола, флузилазола, метконазола, пропиконазола, проквиназида, протиокконазола, пириофенона, тебуконазола, тритиконазола, фамоксадона и пентипирада.

Примерами других биологически активных соединений или средств, с которыми соединения по настоящему изобретению могут быть составлены, являются инсектициды, 10 такие как абамектин, ацефат, ацетамиприд, акринатрин, амидофлумет (S-1955), авермектин, азадирахтин, азинфос-метил, бифентрин, бифеназат, бупрофезин, карбофуран, картап, хлорантранилипрол, хлорфенапир, хлорфлуазурон, хлорпирифос, хлорпирифос-метил, хромафенозид, клотианидин, циантранилипрол (3-бром-1-(3-хлор-2-пиридинил)-N-[4-циано-2-метил-6-[(метиламино)карбонил]фенил]-1H-пиразол-5- 15 карбоксамид), цифлуметофен, цифлутрин, бета-цифлутрин, цигалотрин, лямбда-цигалотрин, суперметрин, циромазин, дельтаметрин, диафентиурон, диазинон, диелдрин, дифлубензурон, димефлутрин, диметоат, динотефуран, диофенолан, эмабектин, эндосульфат, эсфенвалерат, этипрол, фенотиокарб, феноксикарб, фенпропатрин, фенвалерат, фипронил, флониамид, флубендиамид, флуцитринат, тау-флювалинат, 20 флуфенерим (UR-50701), флуфеноксурон, фонофос, галофенозид, гексафлумурон, гидраметилнон, имидаклоприд, индоксакарб, изофенфос, люфенурон, малатион, меперфлутрин, метафлумизон, метальдегид, метамидофос, метидатион, метомил, метопрен, метоксихлор, метоксифенозид, метофлутрин, милбемицин оксим, монокротофос, никотин, нитенпирам, нитиазин, новалурон, новифлумурон (XDE-007), 25 оксамил, паратион, паратион-метил, перметрин, фонат, фозалон, фосмет, фосфамидон, пиримикарб, профенофос, профлутрин, пиметрозин, пиралфлупрол, пиретрин, пиридалил, пирифлуквиназон, пирипрол, пирипроксифен, ротенон, рианодин, спинеторам, спиносид, спироциклофен, спиромезифен (BSN 2060), спиротетрамат, сульфоксафлор, сульпрофос, тебуфенозид, тефлубензурон, тефлутрин, тербуфос, тетрахлорвинфос, 30 тетраметилфлутрин, тиаклоприд, тиаметоксам, тиодикарб, тиосульфат-натрий, толфенпирад, тралометрин, триазамат, трихлорфон и трифлумурон; и биологические средства, включая энтомопатогенные бактерии, такие как *Bacillus thuringiensis* subsp. *aizawai*, *Bacillus thuringiensis* subsp. *kurstaki*, и инкапсулированные дельта-эндотоксины *Bacillus thuringiensis* (например, Cellcap, MPV, MPVII); энтомопатогенные грибы, такие 35 как грибок, вызывающий зеленую мускардину; и энтомопатогенный вирус, включая бакуловирус, нуклеополигедровирус (NPV), такой как HzNPV, AfNPV; и вирус гранулеза (GV), такой как CpGV.

Соединения по настоящему изобретению и его композиции можно наносить на растения в основном в преобразованном виде для экспрессии белков, токсичных для 40 беспозвоночных вредителей (таких как дельта-эндотоксины *Bacillus thuringiensis*). Эффект от экзогенно применяемых фунгицидных соединений по настоящему изобретению может быть синергическим с экспрессированными белками токсина.

Основные справочные материалы для данных сельскохозяйственных защитных средств (т.е. инсектицидов, фунгицидов, нематоцидов, акарицидов, гербицидов и 45 биологических средств) включают The Pesticide Manual, 13th Edition, C.D.S. Tomlin, Ed., British Crop Protection Council, Farnham, Surrey, U.K., 2003, и The BioPesticide Manual, 2nd Edition, L.G. Copping, Ed., British Crop Protection Council, Farnham, Surrey, U.K., 2001.

Для вариантов осуществления, где применяется один или несколько из данных

различных объектов смешивания, весовое соотношение данных различных объектов смешивания (в сумме) и соединения формулы 1, как правило, составляет от приблизительно 1:3000 до приблизительно 3000:1. Примечательными являются весовые соотношения от приблизительно 1:300 до приблизительно 300:1 (например, соотношения от приблизительно 1:30 до приблизительно 30:1). Специалист в данной области может легко определить путем простого проведения опытов биологически эффективные количества активных ингредиентов, требуемые для необходимого спектра биологической активности. В смесях активные ингредиенты зачастую применяют при норме применения, составляющей от половины до полной нормы применения, указанной на товарных этикетках для применения активного ингредиента отдельно. Будет очевидно, что включение данных дополнительных компонентов может расширить спектр контролируемых болезней за рамки спектра контроля посредством только соединения формулы 1.

В определенных случаях комбинации соединения по настоящему изобретению с другими биологически активными (в частности фунгицидными) соединениями или средствами (т.е. активными ингредиентами) могут привести к эффекту, большему, чем аддитивный (т.е. синергическому). Снижение количества активных ингредиентов, выделенных в среду обитания, всегда желательно при обеспечении эффективного контроля вредителей. В случае синергизма фунгицидных активных ингредиентов при нормах применения, обеспечивающих агрономически удовлетворительные уровни фунгицидного контроля, такие комбинации могут быть предпочтительными для уменьшения стоимости продукции растениеводства и снижения нагрузки на окружающую среду.

Также в некоторых случаях комбинации соединения по настоящему изобретению с другими биологически активными соединениями или средствами могут привести к эффекту, меньшему, чем аддитивный (т.е. эффекту антитота), в отношении организмов, полезных для агрономического окружения. Например, соединение по настоящему изобретению может выступать антитотом гербицида в отношении культурных растений или защищать полезный вид насекомых (например, насекомых-хищников, опылителей, таких как пчелы) от инсектицида.

Следует отметить комбинацию соединения формулы 1 по меньшей мере с одним другим фунгицидным активным ингредиентом. Следует особо отметить такую комбинацию, в которой другой фунгицидный активный ингредиент имеет иное место приложения действия, чем соединение формулы 1. В определенных случаях комбинация, в которой по меньшей мере один другой фунгицидный активный ингредиент имеет сходный спектр контроля, но иное место приложения действия, будет особенно предпочтительной для преодоления устойчивости. Таким образом, композиция по настоящему изобретению может дополнительно содержать фунгицидно эффективное количество по меньшей мере одного дополнительного фунгицидного активного ингредиента, имеющего сходный спектр контроля, но иное место приложения действия.

Следует особо отметить композиции, которые помимо соединения формулы 1 включают по меньшей мере одно соединение, выбранное из группы, состоящей из (1) фунгицидов на основе алкиленбис(дитиокарбамата); (2) цимоксанила; (3) фунгицидов на основе фениламида; (4) проквиназида (6-йод-3-пропил-2-пропилокси-4(3H)-хиназолинона); (5) хлороталонила; (6) карбоксаминов, воздействующих на комплекс II в участке митохондриальной дыхательной цепи переноса электронов у грибов; (7) квиноксифена; (8) метрафенона; (9) цифлуфенамида; (10) ципродинила; (11) соединений меди; (12) фунгицидов на основе фталимида; (13) фосетил-алюминия; (14) фунгицидов

на основе бензимидазола; (15) циазофамида; (16) флуазинама; (17) ипроваликарба; (18) пропамокарба; (19) валидомицина; (20) фунгицидов на основе дихлорфенилдикарбоксимида; (21) зоксамида; (22) флуопиколида; (23) мандипропамида; (24) амидов карбоновых кислот, воздействующих на биосинтез и отложение на клеточной стенке фосфолипидов; (25) диметоморфа; (26) не-DMI ингибиторов биосинтеза стерола; (27) ингибиторов деметилазы в биосинтезе стерола; (28) воздействующих на bc1-комплекс фунгицидов и солей соединений (1)-(28).

Дополнительные описания классов фунгицидных соединений представлены ниже.

Ингибиторы биосинтеза стерола (группа (27)) осуществляют контроль грибов путем

ингибирования ферментов в пути биосинтеза стерола. Фунгициды, ингибирующие деметилазу, имеют общее место приложения действия в пути биосинтеза стерола у грибов, включая ингибирование деметилирования в положении 14 в ланостероле или 24-метилендигидроланостероле, которые являются предшественниками стеролов у грибов. Соединения, имеющие такое место приложения действия, часто называют ингибиторами деметилазы, DMI-фунгицидами или DMI. Фермент деметилаза иногда имеет другие названия в биохимической литературе, в том числе цитохром P-450 (14DM). Фермент деметилаза описан, например, в J. Biol. Chem. 1992, 267, 13175-79 и справочных материалах, указанных в нем. DMI-фунгициды разделены на несколько химических классов: азолы (в том числе триазолы и имидазолы), пиримидины, пиперазины и пиридины. Триазолы включают азаконазол, бромуконазол, ципроконазол, дифеноконазол, диниконазол (в том числе диниконазол-М), эпоксиконазол, этаконазол, фенбуконазол, флуквинконазол, флузилазол, флутриафол, гексаконазол, имибенконазол, ипконазол, метконазол, миклобутанил, пенконазол, пропиконазол, протиоконазол, квинконазол, симеконазол, тебуконазол, тетраконазол, триадимефон, триадименол, тритиконазол и униконазол. Имидазолы включают клотримазол, эконазол, имазалил, изоконазол, миконазол, окспоконазол, прохлораз и трифлумизол. Пиримидины включают фенаримол, нуаримол и триаримол. Пиперазины включают трифорин. Пиридины включают бутиобат и пирифенокс. Биохимические исследования показали, что все из вышеупомянутых фунгицидов относятся к DMI-фунгицидам, как описано К.Н. Kuck et al. в *Modern Selective Fungicides - Properties, Applications and Mechanisms of Action*, H. Lyr (Ed.), Gustav Fischer Verlag: New York, 1995, 205-258.

Фунгициды, воздействующие на bc1-комплекс (группа 28), имеют фунгицидный механизм действия, при котором происходит ингибирование bc1-комплекса в митохондриальной дыхательной цепи. В биохимической литературе bc1-комплекс иногда имеет другие названия, в том числе комплекс III цепи переноса электронов и убихинон:цитохром c-оксидоредуктаза. Данный комплекс исключительно идентифицируется номером согласно Комиссии по ферментам EC1.10.2.2. bc1 комплекс описан, например, в J. Biol. Chem. 1989, 264, 14543-48; *Methods Enzymol.* 1986, 126, 253-71; и справочных материалах, указанных в них. Фунгициды на основе стробилурина, такие как азоксистробин, димоксистробин, эноксастробин (SYP-Z071), флуоксастробин, крезоксим-метил, метоминостробин, орикастробин, пикоксистробин, пиракlostробин, пираметостробин, пираоксистробин и трифлуксистробин, как известно, характеризуются таким механизмом действия (H. Sauter et al., *Angew. Chem. Int. Ed.* 1999, 38, 1328-1349). Другие фунгицидные соединения, которые ингибируют bc1-комплекс в митохондриальной дыхательной цепи, включают фамоксадон и фенамидон.

Алкиленбис(дитиокарбамат)ы (группа (1)) включают такие соединения, как манкозеп, манеб, пропинеб и цинеб. Фениламиды (группа (3)) включают такие соединения, как металаксил, беналаксил, фуралаксил и оксадиксил. Карбоксамида (группа (6)) включают

такие соединения, как боскалид, карбоксин, фенфурам, флутоланил, фураметпир, мепронил, оксикарбоксин, тифлузамид, пентиопирад и N-[2-(1,3-диметилбутил)фенил]-5-фтор-1,3-диметил-1Н-пиразол-4-карбоксамид (патентная публикация по РСТ WO 2003/010149), и, как известно, ингибируют работу митохондрий путем разрушения комплекса II (сукцинатдегидрогеназы) в дыхательной цепи переноса электронов.

Соединения меди (группа (11)) включают такие соединения, как оксихлорид меди, сульфат меди и гидроксид меди, включая композиции, такие как бордоская смесь (трехосновный сульфат меди). Фталимиды (группа (12)) включают такие соединения, как фолпет и каптан. Фунгициды на основе бензимидазола (группа (14)) включают беномил и карбендазим. Фунгициды на основе дихлорфенилдикарбоксимида (группа (20)) включают хлозолинат, дихлозолин, ипродион, изоваледион, миклозолин, процимидон и винклозолин.

Не-DMI ингибиторы биосинтеза стерола (группа (26)) включают фунгициды на основе морфолина и пиперидина. Морфолины и пиперидины являются ингибиторами биосинтеза стерола, которые, как было показано, ингибируют стадии в пути биосинтеза стерола в более поздний момент, чем при ингибировании, достигаемом с помощью DMI-ингибиторов биосинтеза стерола (группа (27)). Морфолины включают альдиморф, додеморф, фенпропиморф, тридеморф и триморфамид. Пиперидины включают фенпропидин.

Дополнительно следует отметить комбинации соединений формулы 1 с азоксистробином, крезоксим-метилом, трифлуксистробином, пираклостробином, пикоксистробином, димоксистробином, метоминостробином/феноминостробином, карбендазимом, хлороталонилом, квиноксифеном, метрафеноном, цифлуфенамидом, фенпропидином, фенпропиморфом, бромуконазолом, ципроконазолом, дифеноконазолом, эпоксиконазолом, фенбуконазолом, флузилазолом, гексаконазолом, ипконазолом, метконазолом, пенконазолом, пропиконазолом, проквиназидом, протиоконазолом, тебуконазолом, тритиконазолом, фамоксадоном, прохлоразом, пентиопирадом и боскалидом (никобифеном).

Фунгициды, которые следует отметить, для составления с соединениями формулы 1 с получением смесей, применимых в обработке семян, включают без ограничений амисулбром, азоксистробин, боскалид, карбендазим, карбоксин, цимоксанил, ципроконазол, дифеноконазол, диметоморф, флуазилам, флудиоксонил, флуквинконазол, флуопиколит, флуоксастробин, флутриафол, флуксапироксад, ипконазол, ипродион, металаксил, мефеноксам, метконазол, миклобутанил, паклобутразол, пенфлуфен, пикоксистробин, протиоконазол, пираклостробин, седаксан, силтиофам, тебуконазол, тиабендазол, тиофанат-метил, тирам, трифлуксистробин и тритиконазол.

Инсектициды или нематоциды, с которыми соединения формулы 1 могут быть составлены для обеспечения смесей, применимых при обработке семени, включают без ограничений абамектин, ацетамиприд, акринатрин, амитраз, авермектин, азадирахтин, бенсултап, бифентрин, бупрофезин, кадусафос, карбарил, карбофуран, картап, хлорантранилипрол, хлорфенапир, хлорпирифос, клотианидин, циантранилипрол, цифлутрин, бета-цифлутрин, цигалотрин, гамма-цигалотрин, лямбда-цигалотрин, циперметрин, альфа-циперметрин, зета-циперметрин, циромазин, дельтаметрин, диелдрин, динотефуран, диофенолан, эмаектин, эндосульфат, эсфенвалерат, этипрол, этофенпрокс, этоксазол, фенотиокарб, феноксикарб, фенвалерат, фипронил, флониламид, флубендиамид, флуфеноксурон, флювалинат, форметанат, фостиазат, гексафлумурон, гидраметилнон, имидаклоприд, индоксакарб, люфенурон, метафлумизон, метиокарб, метомил, метопрен, метоксифенозид, нитенпирам, нитиазин,

новалурон, оксамил, пиметрозин, пиретрин, пиридабен, пиридалил, пирипроксифен, рианодин, спинеторам, спиносад, спироциклофен, спиромезифен, спиротетрамат, сульфоксафлор, тебуфенозид, тетраметрин, тиаклоприд, тиаметоксам, тиодикарб, тиосултап-натрий, тралометрин, триазамат, трифлумурон, дельта-эндотоксины *Bacillus*

thuringiensis, все штаммы *Bacillus thuringiensis* и все штаммы вирусов Nucleo polyhydrosis. Композиции, содержащие соединения формулы 1, применимые для обработки семени, дополнительно могут содержать бактерии и грибы, которые обладают способностью обеспечивать защиту от вредных влияний патогенных для растений грибов или бактерий и/или почвенных животных, таких как нематоды. Бактерии, проявляющие нематоцидные свойства, могут включать без ограничения *Bacillus firmus*, *Bacillus cereus*, *Bacillus subtilis* и *Pasteuria penetrans*. Приемлемым штаммом является штамм *Bacillus firmus* CNCM I-1582 (GB-126), который коммерчески доступен как BioNem™. Приемлемым штаммом *Bacillus cereus* является штамм NCMM I-1592. Оба штамма *Bacillus* раскрыты в патенте США №6406690. Другими приемлемыми бактериями, обладающими нематоцидной активностью, являются *B. amyloliquefaciens* IN937a и штамм *B. subtilis* GB03. Бактерии, обладающие фунгицидными свойствами, могут включать без ограничения штамм *B. pumilus* GB34. Виды грибов, обладающие нематоцидными свойствами, могут включать без ограничения *Myrothecium verrucaria*, *Paecilomyces lilacinus* и *Purpureocillium lilacinum*.

Обработка семени также может предусматривать одно или несколько нематоцидных средств природного происхождения, таких как элизиторный белок, называемый гарпин, который выделяют из определенных бактериальных патогенов растений, таких как *Erwinia amylovora*. Примером является технология обработки семени Harpin-N-Tek, доступная как N-Hibit™ Gold CST.

Обработки семени также могут предусматривать один или несколько видов обитающих в корнях бобовых клубеньковых бактерий, таких как микросимбионтная фиксирующая азот бактерия *Bradyrhizobium japonicum*. Эти инокулянты необязательно могут включать один или несколько липохитоолигосахаридов (LCO), которые являются факторами образования клубеньков (Nod), продуцируемыми клубеньковыми бактериями в ходе инициации образования клубеньков на корнях бобовых. Например, технология обработки семени Optimize® включает LCO Promoter Technology™ в комбинации с инокулянтом.

Обработки семени также могут предусматривать один или несколько изофлавонов, которые могут повышать уровень колонизации корней микоризными грибами. Микоризные грибы улучшают рост растений путем усиления поглощения корнями питательных веществ, таких как вода, сульфаты, нитраты, фосфаты и металлы. Примеры изофлавонов включают в себя без ограничения генистеин, биоханин А, формонетин, даидзеин, глицитеин, гесперетин, нарингенин и пратензеин. Формонетин доступен как активный ингредиент в микоризном инокулянтном продукте, таком как RHC Colonize® AG.

Обработки семян также могут предусматривать один или несколько активаторов растений, которые индуцируют системную приобретенную устойчивость у растений после контакта с патогеном. Примером активатора растений, который индуцирует такие защитные механизмы, является ацибензолар-S-метил.

Следующие тесты демонстрируют эффективность контроля соединений по настоящему изобретению против конкретных патогенов. Однако защита посредством контроля патогенов, обеспечиваемая соединениями, не ограничивается данными видами.

Описания соединений см. в таблицах индексов 1-6. Данные ¹H ЯМР см. в таблице индексов 7. Данные по точкам плавления см. в таблице индексов 8. В таблицах индексов

используют следующие сокращения: Me обозначает метил, Et обозначает этил, с-Pr обозначает циклопропил, i-Pr обозначает изопропил, Ph обозначает фенил, OMe или MeO обозначает метокси, OEt или EtO обозначает этокси, и Cn обозначает циано.

Структуры отдельных заместителей “А” в таблицах индексов изображены в приложении 4. Сокращение “Пр.” обозначает “пример”, и за ним следует число, указывающее, в каком примере получено соединение. Дефис “-” в колонке $(R^2)_n$ означает, что n равняется

0, а атомы водорода вместо заместителей R^2 связаны с доступными атомами кольца.

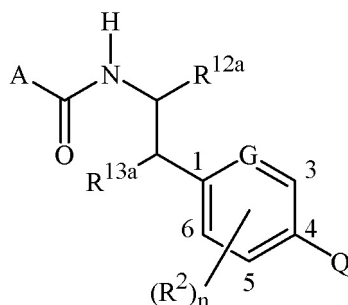
Аналогично, дефис “-” в колонке $(R^{31})_p$ означает, что p равняется 0, а атомы водорода вместо заместителей R^{31} связаны с доступными атомами кольца. Массовые спектры

представлены в виде молекулярного веса исходного иона с самым высоким

относительным содержанием изотопа (M+1), образованного при добавлении H^+

(молекулярный вес 1) к молекуле, или (M-1), образованного при потере H^+ (молекулярный вес 1) молекулой, наблюдаемого при применении жидкостной хроматографии совместно с масс-спектрометром (MS) с применением либо химической ионизации при атмосферном давлении (AP^+), либо электрораспылительной ионизации (ESI^+), где “amu” означает атомные единицы массы.

ТАБЛИЦА ИНДЕКСОВ 1



№ соед.	A	R ^{12a}	R ^{13a}	G	(R ²) _n	Q	M+1	M-1
1	A-1f	Me	H	C-Cl	-	3-CF ₃ -1H-пиразол-1-ил	**	
2	A-1l	Me	H	C-Cl	-	3-CF ₃ -1H-пиразол-1-ил	477	
3	A-1l	H	H	C-H	-	3-CF ₃ -1H-пиразол-1-ил	429	
4	A-1d	H	H	C-H	-	3-CF ₃ -1H-пиразол-1-ил	429	
5 (Пр. 3)	A-1a	H	H	C-H	-	3-CF ₃ -1H-пиразол-1-ил	***	
6	A-1j	H	H	C-H	-	3-CF ₃ -1H-пиразол-1-ил	395	
7	A-1f	Me	H	C-H	-	3-CF ₃ -1H-пиразол-1-ил		408
8	A-1a	Me	H	C-H	-	3-CF ₃ -1H-пиразол-1-ил	442	
9	A-1l	Me	H	C-H	-	3-CF ₃ -1H-пиразол-1-ил		441

10	A-1j	Me	H	C-H	-	3-CF ₃ -1H-пиразол-1-ил		407
11	A-1f	Et	H	C-H	-	3-CF ₃ -1H-пиразол-1-ил	425	
12	A-1f	Et	H	C-Cl	-	3-CF ₃ -1H-пиразол-1-ил	460	
13	A-1l	Et	H	C-Cl	-	3-CF ₃ -1H-пиразол-1-ил		489
14	A-1l	Et	H	C-Me	-	3-CF ₃ -1H-пиразол-1-ил		469
15	A-1f	Et	H	C-Me	-	3-CF ₃ -1H-пиразол-1-ил		436
16	A-1f	Me	H	C-Br	-	3-CF ₃ -1H-пиразол-1-ил	490	
17	A-1j	Me	H	C-Br	-	3-CF ₃ -1H-пиразол-1-ил	489	

5	18	A-1d	Me	H	C-Br	-	3-CF ₃ -1H-пиразол-1-ил		520
	19	A-1a	Me	H	C-Br	-	3-CF ₃ -1H-пиразол-1-ил	522	
	20	A-1j	Et	H	C-Cl	-	3-CF ₃ -1H-пиразол-1-ил		455
	21	A-1a	Et	H	C-Cl	-	3-CF ₃ -1H-пиразол-1-ил		488
	22	A-1d	Et	H	C-Cl	-	3-CF ₃ -1H-пиразол-1-ил		489
10	23	A-1d	Et	H	C-Me	-	3-CF ₃ -1H-пиразол-1-ил		469
	24	A-1a	Et	H	C-Me	-	3-CF ₃ -1H-пиразол-1-ил	470	
	25	A-1j	Et	H	C-Me	-	3-CF ₃ -1H-пиразол-1-ил		435
	26	A-1l	Me	H	C-Br	-	3-CF ₃ -1H-пиразол-1-ил	523	
	27	A-1h	H	H	C-H	-	3-CF ₃ -1H-пиразол-1-ил	430	
15	28	A-1a	H	H	C-H	-	3-CF ₃ -1H-пиразол-1-ил	428	
	29	A-1f	Me	H	C-Cl	-	4-CF ₃ -1H-имидазол-1-ил		443
	30	A-1n	Et	H	C-H	-	3-CF ₃ -1H-пиразол-1-ил	515	
	31	A-1h	Me	H	C-Cl	-	3-CF ₃ -1H-пиразол-1-ил	478	
	32	A-1d	Me	H	C-Cl	-	3-CF ₃ -1H-пиразол-1-ил	477	
20	33	A-1h	Me	H	C-Br	-	3-CF ₃ -1H-пиразол-1-ил	523	
	34	A-1h	Me	H	C-H	-	3-CF ₃ -1H-пиразол-1-ил	444	
	35	A-1d	Me	H	C-H	-	3-CF ₃ -1H-пиразол-1-ил	443	
	36	A-1h	H	H	C-Cl	-	3-CF ₃ -1H-пиразол-1-ил		462
	37	A-1f	H	H	C-Cl	-	3-CF ₃ -1H-пиразол-1-ил	432	
25	38	A-1j	H	H	C-Cl	-	3-CF ₃ -1H-пиразол-1-ил	430	
	39	A-1l	H	H	C-Cl	-	3-CF ₃ -1H-пиразол-1-ил	464	
	40 (Пр. 5)	A-1d	H	H	C-Cl	-	3-CF ₃ -1H-пиразол-1-ил	***	
	41	A-1f	Me	H	C-Br	6-Br	3-CF ₃ -1H-пиразол-1-ил	568	
	42	A-1h	Me	H	C-Br	6-Br	3-CF ₃ -1H-пиразол-1-ил	602	
30	43	A-1j	Me	H	C-CF ₃	-	3-CF ₃ -1H-пиразол-1-ил	477	
	44	A-1a	Me	H	C-CF ₃	-	3-CF ₃ -1H-пиразол-1-ил		508
	45	A-1l	Me	H	C-CF ₃	-	3-CF ₃ -1H-пиразол-1-ил	511	
	46	A-1h	Me	H	C-CF ₃	-	3-CF ₃ -1H-пиразол-1-ил	513	
	47	A-1f	Me	H	C-CF ₃	-	3-CF ₃ -1H-пиразол-1-ил	478	
35	48	A-1d	Me	H	C-CF ₃	-	3-CF ₃ -1H-пиразол-1-ил	512	
	49	A-1j	Me	H	C-OMe	-	3-CF ₃ -1H-пиразол-1-ил	440	
	50	A-1h	Me	H	C-OMe	-	3-CF ₃ -1H-пиразол-1-ил		472
	51	A-1d	Me	H	C-OMe	-	3-CF ₃ -1H-пиразол-1-ил	474	
	52	A-1f	Me	H	C-OMe	-	3-CF ₃ -1H-пиразол-1-ил	441	
40	53	A-1f	Me	H	C-Cl	-	3-Cl-1H-пиразол-1-ил	412	
	54	A-1h	Me	H	C-Cl	-	3-Cl-1H-пиразол-1-ил	444	
	55	A-1f	Me	H	C-Cl	-	3-Br-1H-пиразол-1-ил	456	
	56	A-1h	Me	H	C-Cl	-	3-Br-1H-пиразол-1-ил	490	
	57	A-1h	Me	H	C-Cl	-	3-CF ₃ -1H-[1,2,4]триазол-1-ил	479	
45	58	A-1f	Me	H	C-Cl	-	3-CF ₃ -1H-[1,2,4]триазол-1-ил	445	
	59	A-1o	H	H	C-Cl	-	3-CF ₃ -1H-пиразол-1-ил	411	
	60	A-1b	H	H	C-Cl	-	3-CF ₃ -1H-пиразол-1-ил	431	
	61 ^b	A-1h	Me	MeO	C-Cl	-	3-CF ₃ -1H-пиразол-1-ил	**	
	62 ^c	A-1h	Me	MeO	C-Cl	-	3-CF ₃ -1H-пиразол-1-ил	**	
	63 ^d	A-1h	Me	MeO	C-Cl	-	3-CF ₃ -1H-пиразол-1-ил	**	
	64	A-1l	Et	H	C-H	-	3-CF ₃ -1H-пиразол-1-ил		455
	65	A-1j	Et	H	C-H	-	3-CF ₃ -1H-пиразол-1-ил		421

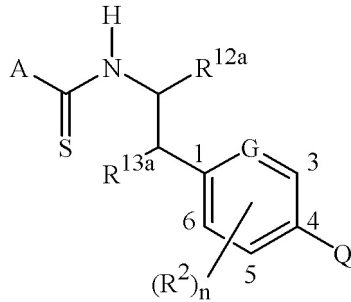
5	66	A-1d	Et	H	C-H	-	3-CF ₃ -1H-пиразол-1-ил		455
	67	A-1a	Et	H	C-H	-	3-CF ₃ -1H-пиразол-1-ил		454
	68	A-1f	Me	H	C-Me	-	3-CF ₃ -1H-пиразол-1-ил		422
	69	A-1j	Me	H	C-Me	-	3-CF ₃ -1H-пиразол-1-ил		421
	70	A-1l	Me	H	C-Me	-	3-CF ₃ -1H-пиразол-1-ил		455
10	71	A-1a	Me	H	C-Me	-	3-CF ₃ -1H-пиразол-1-ил		454
	72	A-1d	Me	H	C-Me	6-Me	3-CF ₃ -1H-пиразол-1-ил	**	
	73	A-1l	Me	H	C-Me	6-Me	3-CF ₃ -1H-пиразол-1-ил	**	
	74	A-1h	Me	H	C-Me	6-Me	3-CF ₃ -1H-пиразол-1-ил	**	
	75	A-1j	Me	H	C-Cl	6-Cl	3-CF ₃ -1H-пиразол-1-ил	**	
15	76	A-1f	Me	H	C-Cl	6-Cl	3-CF ₃ -1H-пиразол-1-ил	**	
	77	A-1a	Me	H	C-Me	6-Me	3-CF ₃ -1H-пиразол-1-ил	**	
	78	A-1f	Me	H	C-Me	6-Me	3-CF ₃ -1H-пиразол-1-ил	**	
	79	A-1j	Me	H	C-Me	6-Me	3-CF ₃ -1H-пиразол-1-ил	**	
	80	A-1a	Me	H	C-Cl	6-Cl	3-CF ₃ -1H-пиразол-1-ил	**	
20	81	A-1d	Me	H	C-Cl	6-Cl	3-CF ₃ -1H-пиразол-1-ил	**	
	82	A-1l	Me	H	C-Cl	6-Cl	3-CF ₃ -1H-пиразол-1-ил	**	
	83	A-1h	Me	H	C-Cl	6-Cl	3-CF ₃ -1H-пиразол-1-ил	**	
	84	A-1c	H	H	C-Cl	-	3-CF ₃ -1H-пиразол-1-ил	475	
	85 (Пр. 4)	A-1a	H	H	N	6-Cl	3-CF ₃ -1H-пиразол-1-ил	***	
25	86	A-1d	H	Me	C-Cl	-	3-CF ₃ -1H-пиразол-1-ил		475
	87	A-4a	H	H	C-Cl	-	3-CF ₃ -1H-пиразол-1-ил		412
	88	A-1d	H	MeO	C-Cl	-	3-CF ₃ -1H-пиразол-1-ил		491
	89	A-1j	H	H	N	6-Cl	3-CF ₃ -1H-пиразол-1-ил	**	
	90	A-1f	H	H	N	6-Cl	3-CF ₃ -1H-пиразол-1-ил	**	
30	91	A-1h	H	H	N	6-Cl	3-CF ₃ -1H-пиразол-1-ил	**	
	92	A-1l	H	H	N	6-Cl	3-CF ₃ -1H-пиразол-1-ил	**	
	93	A-1d	H	H	N	6-Cl	3-CF ₃ -1H-пиразол-1-ил	**	
	94	A-3a	H	H	C-Cl	-	3-CF ₃ -1H-пиразол-1-ил	429	
	95	A-3c	H	H	C-Cl	-	3-CF ₃ -1H-пиразол-1-ил	483	
35	96	A-1d	H	H	C-Cl	-	3-Ме,4-Br-1H-пиразол-1-ил	488	
	97	A-1d	H	H	C-Cl	-	3-CF ₃ ,4-Br-1H-пиразол-1-ил		540
	98	A-1h	Me	MeO	C-Cl	-	4-Cl-1H-пиразол-1-ил		472
	99	A-1h	Me	MeO	C-Cl	-	3-Br-1H-пиразол-1-ил		518
	100	A-1h	Me	MeO	C-Cl	-	3-Cl-1H-пиразол-1-ил		472
40	101	A-1h	Me	MeO	C-Cl	-	3-Ме-1H-пиразол-1-ил		452
	102	A-1h	Me	MeO	C-Cl	-	3-Ph-1H-пиразол-1-ил		514
	103	A-1h	Me	MeO	C-Cl	-	4-Br-1H-пиразол-1-ил		518
	104	A-1h	Me	MeO	C-Cl	-	4-Ме-1H-пиразол-1-ил		452
	105	A-1h	Me	MeO	C-Cl	-	3,4-ди-Ме-1H-пиразол-1-ил		466
45	106	A-1h	Me	MeO	C-Cl	-	3,5-ди-Ме-1H-пиразол-1-ил		466
	107	A-2b	Me	MeO	C-Cl	-	3-Br-1H-пиразол-1-ил		502
	108	A-2b	Me	MeO	C-Cl	-	3-Cl-1H-пиразол-1-ил		456
	109	A-2b	Me	MeO	C-Cl	-	3-Ме-1H-пиразол-1-ил		436
	110	A-2b	Me	MeO	C-Cl	-	3-Ph-1H-пиразол-1-ил		498
45	111	A-2b	Me	MeO	C-Cl	-	4-Cl-1H-пиразол-1-ил		456
	112	A-2b	Me	MeO	C-Cl	-	4-Br-1H-пиразол-1-ил		502
	113	A-2b	Me	MeO	C-Cl	-	4-Ме-1H-пиразол-1-ил		436
	114	A-2b	Me	MeO	C-Cl	-	3,4-ди-Ме-1H-пиразол-1-ил		450
	115	A-2b	Me	MeO	C-Cl	-	3,5-ди-Ме-1H-пиразол-1-ил	452	

5	116	A-1d	Me	MeO	C-Cl	-	3-Br-1H-пиразол-1-ил		517
	117	A-1d	Me	MeO	C-Cl	-	3-Ph-1H-пиразол-1-ил	515	
	118	A-1d	Me	MeO	C-Cl	-	4-Cl-1H-пиразол-1-ил	497	
	119	A-1d	Me	MeO	C-Cl	-	4-Br-1H-пиразол-1-ил	541	
	120	A-1d	Me	MeO	C-Cl	-	4-Ме-1H-пиразол-1-ил	475	
10	121	A-1d	Me	MeO	C-Cl	-	3,4-ди-Ме-1H-пиразол-1-ил	489	
	122	A-1a	H	H	C-Cl	-	3-CF ₃ -1H-пиразол-1-ил	462	
	123	A-2b	H	H	C-H	-	3-CF ₃ -1H-пиразол-1-ил	414	
	124	A-2e	H	H	C-H	-	3-CF ₃ -1H-пиразол-1-ил	466	
	125	A-3a	H	H	C-H	-	3-CF ₃ -1H-пиразол-1-ил	395	
	126	A-1a	H	H	C-H	-	3-Ме-1H-пиразол-1-ил	374	
	127	A-1a	H	H	C-H	-	1H-пиразол-1-ил	360	
	128	A-1f	H	H	C-H	-	3-CF ₃ -1H-пиразол-1-ил	396	

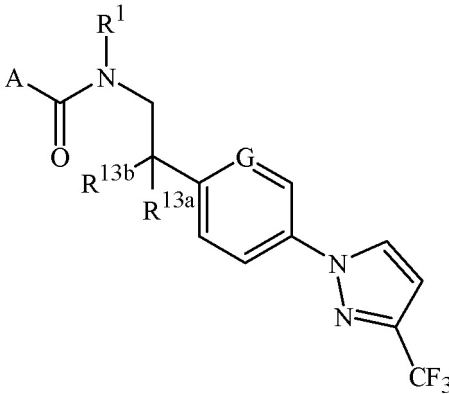
15	129	A-1a	H	H	C-H	-	3-Br-1H-пиразол-1-ил	440	
	130	A-1q	H	H	C-H	-	3-CF ₃ -1H-пиразол-1-ил	394	
	131	A-1p	H	H	C-H	-	3-CF ₃ -1H-пиразол-1-ил	438	
	132	A-1r	H	H	C-H	-	3-CF ₃ -1H-пиразол-1-ил	378	
	133	A-1n	H	H	C-H	-	3-CF ₃ -1H-пиразол-1-ил	486	
20	134	A-1s	H	H	C-H	-	3-CF ₃ -1H-пиразол-1-ил	374	
	135	A-1a	Me	H	C-Cl	-	3-CF ₃ -1H-пиразол-1-ил	**	
	136	A-1t	H	H	C-H	-	3-CF ₃ -1H-пиразол-1-ил	388	
	137	A-1j	Me	H	C-Cl	-	3-CF ₃ -1H-пиразол-1-ил	**	
	138 ^c	A-1d	Me	MeO	C-Cl	-	3-Br-1H-пиразол-1-ил		517
25	139 ^d	A-1d	Me	MeO	C-Cl	-	3-Br-1H-пиразол-1-ил		517
	140 ^c	A-1d	Me	MeO	C-Cl	-	3-Cl-1H-пиразол-1-ил	*	
	141 ^d	A-1d	Me	MeO	C-Cl	-	3-Cl-1H-пиразол-1-ил	*	
	142 ^c	A-1d	Me	MeO	C-Cl	-	3-Ме-1H-пиразол-1-ил	*	
	143 ^d	A-1d	Me	MeO	C-Cl	-	3-Ме-1H-пиразол-1-ил	*	
30	144	A-1b	H	H	C-H	3,5-di-F	3-CF ₃ -1H-пиразол-1-ил		463
	145	A-1d	H	H	C-H	3,5-di-F	3-CF ₃ -1H-пиразол-1-ил		429
	146	A-1d	Me	H	C-Cl	-	1-i-Pr-1H-пиразол-4-ил	451	
	147	A-1b	Me	H	C-Cl	-	1-i-Pr-1H-пиразол-4-ил	418	
	269	A-1h	Me	H	C-Cl	-	4-Br-1H-пиразол-1-ил	490	
35	270	A-1h	Me	H	C-Cl	-	4-Cl-1H-пиразол-1-ил	444	
	271	A-1h	Me	H	C-Cl	-	3-Br-1H-[1,2,4]триазол-1-ил	491	
	272	A-2b	Me	H	C-Cl	-	4-Br-1H-пиразол-1-ил	474	
	273	A-2b	Me	H	C-Cl	-	4-Cl-1H-пиразол-1-ил	428	
	274	A-2b	Me	H	C-Cl	-	3-Br-1H-[1,2,4]триазол-1-ил	475	
40	275	A-1d	Me	H	C-Cl	-	4-Br-1H-пиразол-1-ил	489	
	276	A-1d	Me	H	C-Cl	-	4-Cl-1H-пиразол-1-ил	443	
	277	A-1d	Me	H	C-Cl	-	3-Br-1H-[1,2,4]триазол-1-ил	490	
	278 ^b	A-1d	Me	MeO	C-Cl	-	3-CF ₃ -1H-пиразол-1-ил	507	
	279 ^b	A-2b	Me	MeO	C-Cl	-	3-CF ₃ -1H-пиразол-1-ил	492	
45	280 ^b	A-1f	Me	MeO	C-Cl	-	3-CF ₃ -1H-пиразол-1-ил	476	
	281	A-1d	H	MeO	C-Br	-	3-CF ₃ -1H-пиразол-1-ил	537	
	282	A-1d	H	MeO	C-Br	-	3-Br-1H-пиразол-1-ил	**	
	283	A-1d	H	MeO	C-Br	-	4-Br-1H-пиразол-1-ил	**	
	284	A-1d	H	MeO	C-Br	-	4-Cl-1H-пиразол-1-ил	**	
	285	A-1d	H	MeO	C-Br	-	3-Ме-5-CF ₃ -1H-пиразол-1-ил	*	
	286	A-1d	H	MeO	C-Br	-	3,5-ди-CF ₃ -1H-пиразол-1-ил	**	

	287	A-2b	H	MeO	C-Br	-	3-CF ₃ -1H-пиразол-1-ил	524	
5	288	A-2b	H	MeO	C-Br	-	3-Br-1H-пиразол-1-ил	*	
	289	A-2b	H	MeO	C-Br	-	4-Br-1H-пиразол-1-ил	*	
	290	A-2b	H	MeO	C-Br	-	4-Cl-1H-пиразол-1-ил	**	
	291	A-2b	H	MeO	C-Br	-	3-Ме-5-CF ₃ -1H-пиразол-1-ил	**	
	292	A-2b	H	MeO	C-Br	-	3,5-ди-CF ₃ -1H-пиразол-1-ил	*	
10	293	A-1f	H	MeO	C-Br	-	3-CF ₃ -1H-пиразол-1-ил	**	
	294	A-1f	H	MeO	C-Br	-	3-Br-1H-пиразол-1-ил	**	
	295	A-1f	H	MeO	C-Br	-	4-Br-1H-пиразол-1-ил	**	
	296	A-1f	H	MeO	C-Br	-	4-Cl-1H-пиразол-1-ил	**	
	297	A-1f	H	MeO	C-Br	-	3-Ме-5-CF ₃ -1H-пиразол-1-ил	**	
15	298	A-1f	H	MeO	C-Br	-	3,5-ди-CF ₃ -1H-пиразол-1-ил	**	
	299	A-1a	H	H	N	6-Cl	4-Br-1H-пиразол-1-ил	**	
	300	A-1a	H	H	N	6-Cl	1H-пиразол-1-ил	**	
	301	A-1a	H	H	N	6-Cl	4-Cl-1H-пиразол-1-ил	**	
	302	A-1a	H	H	N	6-Cl	3-Ме-1H-пиразол-1-ил	**	
20	303	A-1a	H	H	N	6-Cl	3-Ph-1H-пиразол-1-ил	**	
	304	A-1a	H	H	N	6-Cl	3-Br-1H-пиразол-1-ил	**	
	338 ^b	A-1h	Me	MeO	C-Cl	-	4-Cl-1H-пиразол-1-ил		472
	339 ^b	A-2b	Me	MeO	C-Cl	-	3-Ме-1H-пиразол-1-ил		436
	340	A-2b	H	H	C-CN	-	3-CF ₃ -1H-пиразол-1-ил	**	
25	341	A-1d	H	H	C-CN	-	3-CF ₃ -1H-пиразол-1-ил	**	
	342	A-1a	H	H	C-Br	-	3-CF ₃ -1H-пиразол-1-ил	**	
	343	A-1a	H	H	C-CN	-	3-CF ₃ -1H-пиразол-1-ил	**	
	344	A-2b	Me	H	C-Cl	-	3-Ph-1H-пиразол-1-ил	470	
	379	A-1d	H	MeONH	C-Cl	-	3-CF ₃ -1H-пиразол-1-ил	508	
30	380	A-2b	H	MeONH	C-Cl	-	3-CF ₃ -1H-пиразол-1-ил	493	
	381	A-1a	H	MeONH	C-Cl	-	3-CF ₃ -1H-пиразол-1-ил	507	
	382	A-1h	H	MeONH	C-Cl	-	3-CF ₃ -1H-пиразол-1-ил		508
	383	A-1a	H	MeONH	C-Cl	-	3-Br-1H-пиразол-1-ил	519	
	384	A-1d	H	MeONH	C-Cl	-	3-Br-1H-пиразол-1-ил	519	
35	385	A-2b	H	MeONH	C-Cl	-	3-Br-1H-пиразол-1-ил	505	
	386	A-1h	H	MeONH	C-Cl	-	3-Br-1H-пиразол-1-ил	521	
	387	A-1a	H	MeONH	C-Cl	-	4-Cl-1H-пиразол-1-ил	473	
	388	A-1d	H	MeONH	C-Cl	-	4-Cl-1H-пиразол-1-ил	476	
	389	A-2b	H	MeONH	C-Cl	-	4-Cl-1H-пиразол-1-ил		457
40	390	A-1h	H	MeONH	C-Cl	-	4-Cl-1H-пиразол-1-ил	475	
	391	A-1a	H	MeONH	C-Br	-	4-Cl-1H-пиразол-1-ил		517
	392	A-1d	H	MeONH	C-Br	-	4-Cl-1H-пиразол-1-ил		516
	393	A-2b	H	MeONH	C-Br	-	4-Cl-1H-пиразол-1-ил		503
	394	A-1h	H	MeONH	C-Br	-	4-Cl-1H-пиразол-1-ил	*	
45	395	A-1a	H	MeONH	C-Br	-	3-CF ₃ -1H-пиразол-1-ил	551	
	379	A-1d	H	MeONH	C-Cl	-	3-CF ₃ -1H-пиразол-1-ил	508	
	380	A-2b	H	MeONH	C-Cl	-	3-CF ₃ -1H-пиразол-1-ил	493	
	381	A-1a	H	MeONH	C-Cl	-	3-CF ₃ -1H-пиразол-1-ил	507	
	382	A-1h	H	MeONH	C-Cl	-	3-CF ₃ -1H-пиразол-1-ил	*	
45	383	A-1a	H	MeONH	C-Cl	-	3-Br-1H-пиразол-1-ил	*	
	384	A-1d	H	MeONH	C-Cl	-	3-Br-1H-пиразол-1-ил	*	
	385	A-2b	H	MeONH	C-Cl	-	3-Br-1H-пиразол-1-ил	503	
	386	A-1h	H	MeONH	C-Cl	-	3-Br-1H-пиразол-1-ил	*	
	387	A-1a	H	MeONH	C-Cl	-	4-Cl-1H-пиразол-1-ил	473	

388	A-1d	H	MeONH	C-Cl	-	4-Cl-1H-пиразол-1-ил	*	
389	A-2b	H	MeONH	C-Cl	-	4-Cl-1H-пиразол-1-ил		457
390	A-1h	H	MeONH	C-Cl	-	4-Cl-1H-пиразол-1-ил	*	
391	A-1a	H	MeONH	C-Br	-	4-Cl-1H-пиразол-1-ил	*	
392	A-1d	H	MeONH	C-Br	-	4-Cl-1H-пиразол-1-ил	*	
393	A-2b	H	MeONH	C-Br	-	4-Cl-1H-пиразол-1-ил	*	
394	A-1h	H	MeONH	C-Br	-	4-Cl-1H-пиразол-1-ил	*	
395	A-1a	H	MeONH	C-Br	-	3-CF ₃ -1H-пиразол-1-ил	*	
<p>* данные по ¹H ЯМР, которые можно найти в таблице индексов 7 ** данные по МР, которые можно найти в таблице индексов 8 *** данные по MS, ¹H ЯМР или МР, которые можно найти в примерах синтеза ^b Смесь рацемических син- и анти-диастереомеров ^c Рацемический анти-диастереомер ^d Рацемический син-диастереомер</p>								

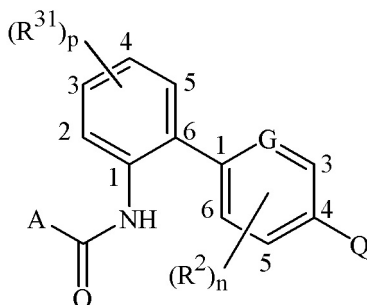
ТАБЛИЦА ИНДЕКСОВ 2								
								
№ соед.	A	R ^{12a}	R ^{13a}	G	(R ²) _n	Q	M+1	M-1
313 ^e	A-1d	H	H	C-Cl	-	3-CF ₃ -1H-пиразол-1-ил		478

^e Полученное соединение может содержать небольшое количество соединения № 40 в качестве примеси.

ТАБЛИЦА ИНДЕКСОВ 3							
							
№ соед.	A	R ¹	R ^{13a}	R ^{13b}	G	M+1	M-1
148	A-1f	c-Pr	H	H	C-H	*	
149	A-1h	c-Pr	H	H	C-H	*	
150 (Пр. 6)	A-1d	H	F	F	C-Cl	***	
304	A-1d	H	-CH ₂ CH ₂ -		C-Cl		487
306	A-1b	H	-CH ₂ CH ₂ -		C-Cl		453
307	A-1f	H	-CH ₂ CH ₂ -		C-Cl		455
308	A-2a	H	-CH ₂ CH ₂ -		C-Cl		490
309	A-1d	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -		C-Cl		515
310	A-1f	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -		C-Cl		482
311	A-2b	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -		C-Cl		500

312	A-1d	H	-CH ₂ CH ₂ -	C-F		471
* данные по ¹ H ЯМР, которые можно найти в таблице индексов 7 *** данные по MS, ¹ H ЯМР или МР, которые можно найти в примерах синтеза						

ТАБЛИЦА ИНДЕКСОВ 4



№ соед.	A	(R ³¹) _p	G	(R ²) _n	Q	M+1	M-1
151	A-1f	-	C-H	-	3-CF ₃ -1H-пиразол-1-ил	445	
152	A-2a	-	C-H	-	3-CF ₃ -1H-пиразол-1-ил		478
153	A-1a	-	C-H	-	3-CF ₃ -1H-пиразол-1-ил		474
154	A-1n	-	C-H	-	3-CF ₃ -1H-пиразол-1-ил	534	
155	A-1j	-	C-H	-	3-CF ₃ -1H-пиразол-1-ил	444	
156	A-1h	-	C-H	-	3-CF ₃ -1H-пиразол-1-ил		476
157	A-1h	3-F	C-H	-	3-CF ₃ -1H-пиразол-1-ил		494
158	A-1j	3-F	C-H	-	3-CF ₃ -1H-пиразол-1-ил		459
159	A-1h	4-Me	C-H	-	3-CF ₃ -1H-пиразол-1-ил	492	
160	A-1j	4-Me	C-H	-	3-CF ₃ -1H-пиразол-1-ил	458	
161	A-1f	-	C-H	-	3-Cl-1H-пиразол-1-ил		*
162	A-1h	-	C-H	-	3-Cl-1H-пиразол-1-ил	444	
163	A-1h	4-Cl	C-H	-	3-CF ₃ -1H-пиразол-1-ил		510
164	A-1j	4-Cl	C-H	-	3-CF ₃ -1H-пиразол-1-ил		476
165	A-1l	4-Cl	C-H	-	3-CF ₃ -1H-пиразол-1-ил	511	
166	A-1f	-	C-H	3-F	3-CF ₃ -1H-пиразол-1-ил	462	
167	A-1h	-	C-H	3-F	3-CF ₃ -1H-пиразол-1-ил	496	
168	A-1h	-	C-H	3,5-di-F	3-CF ₃ -1H-пиразол-1-ил	514	
169	A-1f	-	C-H	3,5-di-F	3-CF ₃ -1H-пиразол-1-ил	480	
170 (прим. 1)	A-1j	-	C-H	3,5-di-F	3-CF ₃ -1H-пиразол-1-ил	***	
171	A-1l	-	C-H	3,5-di-F	3-CF ₃ -1H-пиразол-1-ил	513	
172	A-1d	-	C-H	3,5-di-F	3-CF ₃ -1H-пиразол-1-ил	513	
173	A-2b	-	C-H	3,5-di-F	3-CF ₃ -1H-пиразол-1-ил	498	
174	A-1f	-	C-H	-	4-Cl-1H-пиразол-1-ил	410	
175	A-1h	-	C-H	-	4-Cl-1H-пиразол-1-ил	444	
176	A-1b	-	C-H	-	4-Cl-1H-пиразол-1-ил	409	
177	A-1a	-	C-H	-	4-Cl-1H-пиразол-1-ил	442	
178	A-4a	-	C-H	-	4-Cl-1H-пиразол-1-ил	394	
179	A-1j	-	C-H	3-F	3-CF ₃ -1H-пиразол-1-ил	461	
180	A-1l	-	C-H	3-F	3-CF ₃ -1H-пиразол-1-ил	495	
181	A-1d	-	C-H	3-F	3-CF ₃ -1H-пиразол-1-ил	495	
182	A-2b	-	C-H	3-F	3-CF ₃ -1H-пиразол-1-ил	481	
183	A-1h	-	C-H	-	1H-пиразол-1-ил	410	
184	A-1h	-	C-H	-	5-Cl-1H-пиразол-1-ил	444	
185	A-4c	-	C-H	-	3-CF ₃ -1H-пиразол-1-ил	448	

5	186	A-4d	-	C-H	-	1H-пиразол-1-ил	426	
	187	A-1a	-	C-H	-	1H-пиразол-1-ил	408	
	188	A-4a	-	C-H	-	3-CF ₃ -1H-пиразол-1-ил	428	
	189	A-1d	-	C-H	-	3-Cl-1H-пиразол-1-ил	443	
	190	A-1l	-	C-H	-	3-Cl-1H-пиразол-1-ил	443	
10	191	A-4a	-	C-H	-	3-Cl-1H-пиразол-1-ил	394	
	192	A-4d	-	C-H	-	3-CF ₃ -1H-пиразол-1-ил	494	
	193	A-3c	-	C-H	-	3-CF ₃ -1H-пиразол-1-ил	497	
	194	A-3b	-	C-H	-	3-CF ₃ -1H-пиразол-1-ил	483	
	195	A-3a	-	C-H	-	3-CF ₃ -1H-пиразол-1-ил	443	
15	196	A-4b	-	C-H	-	3-CF ₃ -1H-пиразол-1-ил	482	
	197	A-1h	-	C-H	-	2H-[1,2,3]триазол-2-ил	411	
	198	A-1d	-	C-H	-	3-CF ₃ -1H-пиразол-1-ил		475
	199	A-1b	-	C-H	-	3-CF ₃ -1H-пиразол-1-ил		441
	200	A-2b	-	C-H	3,5-di-F	3-Br-1H-пиразол-1-ил	510	
20	201	A-2b	-	C-H	3,5-di-F	4-Br-1H-пиразол-1-ил	510	
	202	A-2b	-	C-H	3,5-di-F	3-Me-1H-пиразол-1-ил	444	
	203	A-2b	-	C-H	3,5-di-F	4-Me-1H-пиразол-1-ил	444	
	204	A-2b	-	C-H	3,5-di-F	3,5-ди-Me-1H-пиразол-1-ил	458	
	205	A-2b	-	C-H	3,5-di-F	3,5-ди-CF ₃ -1H-пиразол-1-ил	566	
25	206	A-2b	-	C-H	3,5-di-F	3-Ph-1H-пиразол-1-ил	506	
	207	A-2b	-	C-H	3,5-di-F	1H-пиразол-1-ил	430	
	208	A-2b	-	C-H	3,5-di-F	1H-[1,2,4]триазол-1-ил	431	
	209	A-2b	-	C-H	3,5-di-F	3-Br-1H-[1,2,4]триазол-1-ил	511	
	210	A-2b	-	C-H	3,5-di-F	4-Cl-1H-пиразол-1-ил	464	
30	211	A-2b	-	C-H	3,5-di-F	3-Cl-1H-пиразол-1-ил		462
	212	A-1h	-	C-H	3,5-di-F	3-Br-1H-пиразол-1-ил	526	
	213	A-1h	-	C-H	3,5-di-F	4-Br-1H-пиразол-1-ил	526	
	214	A-1h	-	C-H	3,5-di-F	3-Me-1H-пиразол-1-ил	460	
	215	A-1h	-	C-H	3,5-di-F	4-Me-1H-пиразол-1-ил	460	
35	216	A-1h	-	C-H	3,5-di-F	3,5-ди-Me-1H-пиразол-1-ил	474	
	217	A-1h	-	C-H	3,5-di-F	3,5-ди-CF ₃ -1H-пиразол-1-ил	582	
	218	A-1h	-	C-H	3,5-di-F	3-Ph-1H-пиразол-1-ил	522	
	219	A-1h	-	C-H	3,5-di-F	1H-пиразол-1-ил	446	
	220	A-1h	-	C-H	3,5-di-F	1H-[1,2,4]триазол-1-ил	446	
40	221	A-1h	-	C-H	3,5-di-F	3-Br-1H-[1,2,4]триазол-1-ил	527	
	222	A-1h	-	C-H	3,5-di-F	4-Cl-1H-пиразол-1-ил	480	
	223	A-1h	-	C-H	3,5-di-F	3-Cl-1H-пиразол-1-ил		478
	224	A-1d	-	C-F	3-F	3-CF ₃ -1H-пиразол-1-ил		511
	225	A-1d	-	C-H	-	5-Cl-1H-пиразол-1-ил	443	
45	226	A-1d	-	C-H	-	2H-[1,2,3]триазол-2-ил	410	
	227	A-1d	-	C-F	5-F	3-CF ₃ -1H-пиразол-1-ил	513	
	228	A-2b	-	C-H	-	1,4-ди-Me-1H-пиразол-3-ил	422	
	229	A-2b	-	C-H	-	4-Me-1-(CF ₃ CH ₂)-1H-пиразол-3-ил	490	
	230	A-1d	-	C-H	-	1-i-Pr-1H-пиразол-4-ил	451	
50	231	A-2b	-	C-H	-	1-Me-1H-[1,2,4]триазол-3-ил	409	
	232 (прим. 2)	A-2b	-	C-H	3,5-di-F	1-Me-1H-пиразол-3-ил	444	
	233	A-2b	-	C-H	3,5-di-F	1-(CF ₃ CH ₂)-1H-пиразол-3-ил	512	
	234	A-1d	-	C-H	-	4-Me-1-(CF ₃ CH ₂)-1H-пиразол-3-ил	505	
	235	A-1d	-	C-H	-	1,4-ди-Me-1H-пиразол-3-ил	537	
55	236	A-1d	-	C-F	-	3-CF ₃ -1H-пиразол-1-ил		493
	237	A-1d	-	C-H	3,5-di-F	3-Br-1H-пиразол-1-ил	525	
	238	A-1d	-	C-H	3,5-di-F	4-Br-1H-пиразол-1-ил	525	

	239	A-1d	-	C-H	3,5-di-F	3-Ме-1Н-пиразол-1-ил	459	
	240	A-1d	-	C-H	3,5-di-F	4-Ме-1Н-пиразол-1-ил	459	
	241	A-1d	-	C-H	3,5-di-F	3,5-ди-Ме-1Н-пиразол-1-ил	473	
5	242	A-1d	-	C-H	3,5-di-F	3,5-ди-СF ₃ -1Н-пиразол-1-ил	581	
	243	A-1d	-	C-H	3,5-di-F	3-Ph-1Н-пиразол-1-ил	521	
	244	A-1d	-	C-H	3,5-di-F	1Н-пиразол-1-ил	445	
	245	A-1d	-	C-H	3,5-di-F	1Н-[1,2,4]триазол-1-ил	446	
	246	A-1d	-	C-H	3,5-di-F	3-Br-1Н-[1,2,4]триазол-1-ил	526	
10	247	A-1d	-	C-H	3,5-di-F	4-Cl-1Н-пиразол-1-ил	479	
	248	A-1d	-	C-H	3,5-di-F	3-Cl-1Н-пиразол-1-ил	479	
	249	A-1d	-	C-H	-	1-Ме-1Н-[1,2,4]триазол-3-ил	424	
	250	A-1d	-	C-H	-	1-(СF ₃ СН ₂)-1Н-[1,2,4]триазол-3-ил	492	
	251	A-1d	-	C-H	3,5-di-F	1-Ме-1Н-пиразол-3-ил	459	
15	252	A-1d	-	C-H	-	5-Ме-2,4-дигидро-3-оксопиразол-1-ил	439	
	253	A-2b	-	C-H	-	1-(СF ₃ СН ₂)-1Н-[1,2,4]триазол-3-ил	477	
	254	A-1d	-	C-H	3,5-di-F	1-(СF ₃ СН ₂)-1Н-пиразол-3-ил	527	
	255	A-1d	4-F	C-H	3,5-di-F	3-СF ₃ -1Н-пиразол-1-ил	531	
	256	A-2b	4-F	C-H	3,5-di-F	3-СF ₃ -1Н-пиразол-1-ил	516	
20	257	A-2b	-	C-H	-	1,3-ди-Ме-1Н-пиразол-4-ил	422	
	258	A-1d	-	C-H	-	5-СF ₃ -2,4-дигидро-3-оксопиразол-1-ил	493	
	259	A-1d	-	C-H	3,5-di-F	5-Ph-4,5-дигидро-изоксазол-3-ил	524	
	260	A-1d	4-Ме	C-H	-	3-СF ₃ -1Н-пиразол-1-ил	492	
	261	A-1d	-	C-H	3-CN	3-Br-1Н-пиразол-1-ил	513	
25	262	A-1d	-	C-H	3-CN	3-Ме-1Н-пиразол-1-ил	448	
	263	A-1d	-	C-H	3-CN	3-СF ₃ -1Н-пиразол-1-ил	502	
	264	A-1d	-	C-H	3-CN	4-Cl-1Н-пиразол-1-ил	468	
	265	A-1d	-	C-H	3-CN	4-Br-1Н-пиразол-1-ил	513	
	266	A-1d	-	C-H	3-CN	3-(3,5-ди-МеО-Ph)-1Н-пиразол-1-ил	570	
30	267	A-1d	-	C-H	3-CN	3-(2-F-Ph)-1Н-пиразол-1-ил	528	
	268	A-1d	-	C-H	3,5-di-F	3-СНF ₂ -1Н-пиразол-1-ил	495	
35	315	A-1h	-	C-H	3,5-di-Me	5-СF ₃ -1Н-пиразол-1-ил	**	
	316	A-1d	-	C-H	3-Cl-5-F	3-СF ₃ -1Н-пиразол-1-ил	**	
	317	A-1h	-	C-H	3-Cl-5-F	3-СF ₃ -1Н-пиразол-1-ил	**	
	318	A-2b	-	C-H	3-Cl-5-F	3-СF ₃ -1Н-пиразол-1-ил	**	
	319	A-2b	-	C-H	3,5-di-Me	3-СF ₃ -1Н-пиразол-1-ил	**	
40	320	A-1h	-	C-H	3,5-di-Cl	3-СF ₃ -1Н-пиразол-1-ил	**	
	321	A-1d	-	C-H	3-F-5-Me	3-СF ₃ -1Н-пиразол-1-ил	**	
	322	A-1d	-	C-H	3-Br-5-F	3-СF ₃ -1Н-пиразол-1-ил	**	
	323	A-1h	-	C-H	3,5-di-Me	3-СF ₃ -1Н-пиразол-1-ил	**	
	324	A-1d	-	C-H	3-Cl-5-Me	3-СF ₃ -1Н-пиразол-1-ил	**	
45	325	A-1h	-	C-H	3-Cl-5-Me	3-СF ₃ -1Н-пиразол-1-ил	**	
	326	A-1d	-	C-H	-	3-Ме-1Н-пиррол-1-ил	422	
	327	A-2b	-	C-H	3-Cl-5-Me	3-СF ₃ -1Н-пиразол-1-ил	**	
	328	A-1d	-	C-H	3,5-di-Cl	3-СF ₃ -1Н-пиразол-1-ил	**	
	329	A-1l	-	C-H	3,5-di-Cl	3-СF ₃ -1Н-пиразол-1-ил	**	
50	330	A-1d	-	C-H	-	1Н-пиррол-1-ил	408	
	331	A-1d	-	C-H	3,5-di-F	1Н-[1,2,3]триазол-1-ил	446	
	332	A-1d	-	C-H	3,5-di-F	2Н-[1,2,3]триазол-2-ил	446	
	333	A-2b	-	C-H	3-F-5-Me	3-СF ₃ -1Н-пиразол-1-ил	**	
	334	A-1h	-	C-H	3-F-5-Me	3-СF ₃ -1Н-пиразол-1-ил	**	

335	A-2b	-	C-H	3,5-di-Cl	3-CF ₃ -1H-пиразол-1-ил	**	
336	A-2b	-	C-H	3-Br-5-F	3-CF ₃ -1H-пиразол-1-ил	**	
337	A-1h	-	C-H	3-Br-5-F	3-CF ₃ -1H-пиразол-1-ил	**	
345	A-1e	-	C-H	3-F	3-CF ₃ -1H-пиразол-1-ил	**	
346	A-1e	-	C-H	3,5-di-F	3-CF ₃ -1H-пиразол-1-ил	**	
347	A-2b	-	C-H	3,5-di-F	1-изобутил-1H-пиразол-4-ил	486	
348	A-1d	-	C-H	3,5-di-F	1-Ме-1H-пиразол-4-ил	459	

349	A-2a	-	C-H	3-F	3-CF ₃ -1H-пиразол-1-ил	**	
350	A-4a	-	C-H	3,5-di-F	3-CF ₃ -1H-пиразол-1-ил	**	
351	A-2a	-	C-H	3,5-di-F	3-CF ₃ -1H-пиразол-1-ил	**	
352	A-7a	-	C-H	3-F	3-CF ₃ -1H-пиразол-1-ил	**	
353	A-6b	-	C-H	3,5-di-F	3-CF ₃ -1H-пиразол-1-ил	**	
354	A-6a	-	C-H	3,5-di-F	3-CF ₃ -1H-пиразол-1-ил	**	
355	A-1a	-	C-H	3-F	3-CF ₃ -1H-пиразол-1-ил	**	
356	A-3c	-	C-H	3,5-di-F	3-CF ₃ -1H-пиразол-1-ил	**	
357	A-1a	-	C-H	3,5-di-F	3-CF ₃ -1H-пиразол-1-ил	**	
358	A-1d	-	C-H	3,5-di-F	3-CF ₃ -5-Ме-1H-пиразол-1-ил	527	
359	A-1d	-	C-H	3,5-di-F	3,5-ди-Br-1H-[1,2,4]триазол-1-ил	604	
360	A-1d	-	C-H	3,5-di-F	3-(EtOC(=O))-1H-пиразол-1-ил	517	
361	A-1d	-	C-H	3,5-di-F	4-(EtOC(=O))-1H-пиразол-1-ил	517	
362	A-2b	-	C-H	3,5-di-F	3-CF ₃ -5-Ме-1H-пиразол-1-ил		510
363	A-2b	-	C-H	3,5-di-F	3,5-ди-Br-1H-[1,2,4]триазол-1-ил		587
364	A-2b	-	C-H	3,5-di-F	3-(EtOC(=O))-1H-пиразол-1-ил	502	
365	A-2b	-	C-H	3,5-di-F	4-(EtOC(=O))-1H-пиразол-1-ил	502	
366	A-1h	-	C-H	3,5-di-F	3-CF ₃ -5-Ме-1H-пиразол-1-ил	528	
367	A-1h	-	C-H	3,5-di-F	3,5-ди-Br-1H-[1,2,4]триазол-1-ил	605	
368	A-1h	-	C-H	3,5-di-F	3-(EtOC(=O))-1H-пиразол-1-ил	518	
369	A-1h	-	C-H	3,5-di-F	4-(EtOC(=O))-1H-пиразол-1-ил	518	
370	A-2b	-	C-H	3,5-di-F	3-Ph-4,5-дигидро-изоксазол-5-ил	509	
371	A-1d	-	C-H	3,5-di-F	3-Ph-4,5-дигидро-изоксазол-5-ил	524	
372	A-2b	-	C-H	3,5-di-F	5-Ме-фуран-2-ил	444	

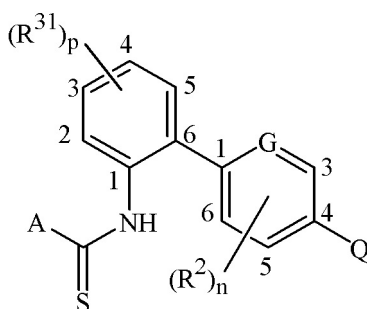
373	A-1d	-	C-H	3,5-di-F	5-(MeC(=O))-тиен-2-ил	503	
374	A-6a	-	C-H	3-F	3-CF ₃ -1H-пиразол-1-ил	**	
375	A-6b	-	C-H	3-F	3-CF ₃ -1H-пиразол-1-ил	**	
378	A-8a	-	C-H	-	3-CF ₃ -1H-пиразол-1-ил	483	

* данные по ¹H ЯМР, которые можно найти в таблице индексов 7

** данные по МР, которые можно найти в таблице индексов 8

*** данные по MS, ¹H ЯМР или МР, которые можно найти в примерах синтеза

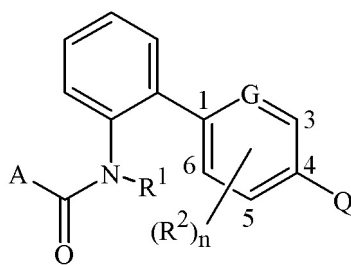
ТАБЛИЦА ИНДЕКСОВ 5



№ соед.	A	(R ³¹) _p	G	(R ²) _n	Q	M+1	M-1
	A-1d	-	C-H	-	3-CF ₃ -1H-пиразол-1-ил		491

^f Полученное соединение может содержать небольшое количество соединения № 198 в качестве примеси.

ТАБЛИЦА ИНДЕКСОВ 6



№ соедин.	A	R ¹	G	(R ²) _n	Q	M+1	M-1
376	A-2b	c-Pr	C-H	3,5-di-F	3-CF ₃ -1H-пиразол-1-ил	538	
377	A-1d	c-Pr	C-H	3,5-di-F	4-CF ₃ -1H-пиразол-1-ил	**	

ТАБЛИЦА ИНДЕКСОВ 7

№ соедин.	Данные ¹ H ЯМР (CDCl ₃)
140	δ 8,75 (d, 1H), 8,12 (d, 1H), 7,83 (d, 1H), 7,80 (s, 1H), 7,58 (m, 2H), 7,48 (m, 2H), 6,37 (s, 1H), 4,78 (s, 1H), 4,49 (m, 1H), 3,35 (s, 3H), 1,42 (d, 3H).
141	δ 7,78 (d, 1H), 8,17 (d, 1H), 7,82 (d, 2H), 7,70 (s, 1H), 7,55 (m, 3H), 6,41 (s, 1H), 4,80 (d, 1H), 4,60 (m, 1H), 3,35 (s, 3H), 1,25 (d, 3H).
142	δ 8,75 (d, 1H), 8,02 (d, 1H), 7,83 (d, 1H), 7,78 (s, 1H), 7,62 (s, 1H), 7,58 (m, 2H), 6,44 (s, 1H), 6,22 (s, 1H), 4,77 (d, 1H), 4,46 (m, 1H), 3,42 (s, 3H), 2,34 (s, 3H), 1,40 (d, 3H).
143	δ 8,76 (d, 1H), 8,10 (d, 1H), 7,83 (d, 1H), 7,78 (s, 1H), 7,62 (s, 1H), 7,56 (m, 2H), 7,46 (s, 1H), 6,21 (s, 1H), 4,76 (d, 1H), 4,46 (m, 1H), 3,34 (s, 3H), 2,34 (s, 3H), 1,41 (d, 3H).
148	δ 8,62 (s, 1H), 8,48 (d, 2H), 7,44 (d, 2H), 7,19 (d, 2H), 6,77 (s, 1H), 3,76 (t, 2H), 3,04 (m, 2H), 2,64 (m, 1H), 0,60 (m, 2H), 0,40 (m, 2H).
149	δ 8,78 (d, 2H), 7,63 (s, 1H), 7,47 (d, 2H), 7,19 (d, 2H), 6,61 (s, 1H), 3,78 (t, 2H), 3,00 (t, 2H), 2,60 (m, 1H), 0,45 (m, 4H).
158	δ 9,72 (br s, 1H), 8,57 (d, 1H), 8,51 (d, 1H), 8,33 (d, 1H), 7,92 (d, 1H), 7,80-7,76 (m, 2H), 7,56-7,52 (m, 2H), 7,49-7,44 (m, 1H), 7,34-7,25 (m, 2H), 6,45 (d, 1H).
285	δ 8,77 (s, 1H), 8,36 (m, 1H), 7,99 (br s, 1H), 7,63 (d, 1H), 7,55 (m, 1H), 7,50 (s, 1H), 7,40 (d, 1H), 6,47 (s, 1H), 4,94 (m, 1H), 3,99 (m, 1H), 3,57 (m, 1H), 3,56 (s, 3H), 2,38 (s, 3H).
288	δ 7,90 (s, 1H), 7,83 (s, 1H), 7,74 (s, 1H), 7,56 (m, 2H), 6,84 (t, 1H), 6,81 (br s, 1H), 6,50 (s, 1H), 4,81 (m, 1H), 3,93 (m, 4H), 3,40 (m, 1H), 3,33 (s, 3H).
289	δ 7,95 (s, 1H), 7,90 (s, 1H), 7,74 (s, 1H), 7,68 (m, 1H), 7,55 (m, 2H), 6,82 (t, 1H), 6,79 (br s, 1H), 4,82 (m, 1H), 3,92 (m, 4H), 3,99 (m, 1H), 3,33 (s, 3H).
292	δ 7,94 (s, 1H), 7,70 (d, 1H), 7,57 (s, 1H), 7,45 (m, 1H), 7,12 (m, 1H), 6,84 (t, 1H), 6,81 (m, 1H), 4,85 (m, 1H), 4,02 (m, 1H), 3,93 (s, 3H), 3,39 (m, 1H), 3,39 (m, 1H), 3,36 (s, 3H).
382	δ 8,81 (m, 1H), 8,74 (m, 1H), 7,94 (m, 1H), 7,81 (m, 1H), 7,75 (br m, 1H), 7,66 (m, 1H), 7,61 (m, 1H), 6,74 (m, 1H), 6,03 (br s, 1H), 4,80 (m, 1H), 3,90 (m, 2H), 3,58 (s, 3H).
383	δ 7,80 (m, 2H), 7,70 (m, 1H), 7,58 (m, 5H), 7,49 (m, 1H), 6,50 (m, 1H), 6,19 (br t, 1H), 4,72 (m, 1H), 3,86 (m, 2H), 3,56 (s, 3H).
384	δ 8,73 (m, 1H), 8,17 (m, 1H), 7,98 (m, 1H), 7,79 (m, 1H), 7,75 (m, 1H), 7,67 (m, 1H), 7,54 (m, 2H), 6,49 (m, 1H), 6,09 (br s, 1H), 4,78 (m, 1H), 3,85 (m, 2H), 3,57 (s, 3H).
386	δ 8,81 (m, 1H), 8,73 (m, 1H), 7,76 (m, 3H), 7,63 (m, 1H), 7,54 (m, 1H), 6,50 (m, 1H), 6,01 (br s, 1H), 4,77 (br t, 1H), 3,90 (m, 2H), 3,58 (s, 3H).
388	δ 8,72 (m, 1H), 8,17 (m, 1H), 7,99 (br t, 1H), 7,9 (s, 1H), 7,73 (m, 1H), 7,66 (2H), 7,55 (m, 2H), 6,06 (br s, 1H), 4,78 (m, 1H), 3,85 (m, 2H), 3,57 (s, 3H).
390	δ 8,82 (m, 1H), 8,74 (m, 1H), 7,89 (m, 1H), 7,75 (m, 2H), 7,65 (m, 2H), 7,53 (m, 1H), 6,04 (br s, 1H), 4,77 (m, 1H), 3,90 (m, 2H), 3,58 (s, 3H).
391	δ 7,9 (m, 1H), 7,76 (m, 1H), 7,69 (m, 1H), 7,58 (m, 6H), 6,20 (m, 2H), 4,72 (m, 1H), 3,87 (m, 2H), 3,56 (s, 3H).
392	δ 8,72 (m, 1H), 8,16 (m, 1H), 7,99 (br t, 1H), 7,89 (s, 1H), 7,74 (m, 1H), 7,65 (m, 2H), 7,55 (m, 2H), 6,18 (br s, 1H), 4,78 (m, 1H), 3,86 (m, 2H), 3,57 (s, 3H).
393	δ 7,89 (m, 2H), 7,73 (m, 2H), 7,62 (m, 1H), 7,52 (m, 1H), 6,79 и 6,76 (t и br s, соответственно, 3H в общем), 4,73 (m, 1H), 3,91 (s, 3H), 3,82 (m, 2H), 3,56 (s, 3H).
394	δ 8,81 (m, 1H), 8,74 (m, 1H), 7,89 (s, 1H), 7,75 (m, 2H), 7,63 (m, 2H), 7,53 (m, 1H), 6,01 (br s, 1H), 4,77 (m, 1H), 3,90 (m, 2H), 3,57 (s, 3H).
395	δ 8,08 (m, 1H), 7,88 (m, 1H), 7,66 (m, 7H), 6,75 (m, 1H), 6,33 (br t, 1H), 4,72 (m, 1H), 3,84 (m, 2H), 3,55 (s, 3H).

Данные ^1H ЯМР даны в м.д. относительно тетраметилсилана. Сочетания обозначены следующим: (s)-синглет, (br s)-широкий синглет, (d)-дублет, (br d)-широкий дублет, (t)-триплет, (br t)-широкий триплет, (q)-квартет, (m)-мультиплет и (br m)-широкий мультиплет.

5

10

15

20

25

30

ТАБЛИЦА ИНДЕКСОВ 8					
№ соед.	точка плавления ^a	№ соед.	точка плавления ^a	№ соед.	точка плавления ^a
1	140-142	286	114-116	328	140-142
61	134-136	290	132-133	329	102-104
62	183-185	291	118-120	333	135-138
63	124-127	293	113-115	334	147-149
72	152-154	294	165-166	335	118-120
73	191-194	295	159-160	336	86-89
74	188-189	296	157-158	337	143-145
75	196-198	297	115-117	340	170-172
76	204-205	298	154-156	341	217-221
77	130-132	299	154-156	342	157-159
78	204-206	300	130-133	343	180-182
79	175-176	301	137-139	345	144-147
80	158-162	302	136-139	346	180-182
81	162-163	303	164-167	349	122-124
82	211-212	304	140-143	350	140-142
83	178-180	315	135-137	351	147-149
85	118-120	316	134-136	352	111-113
89	132-134	317	157-159	353	176-177
90	152-154	318	90-92	354	132-134
91	143-145	319	73-75	355	177-179
92	154-156	320	160-162	356	100-102
93	155-157	321	132-134	357	161-163
135	170-175	322	104-106	374	112-114
137	166-168	323	169-171	375	162-164
282	135-136	324	151-154	377	110-113
283	140-141	325	136-139		
284	147-148	327	120-123		

^a данные по точке плавления представляют собой °C.

БИОЛОГИЧЕСКИЕ ПРИМЕРЫ НАСТОЯЩЕГО ИЗОБРЕТЕНИЯ

35

40

45

Общий протокол для получения тестируемых суспензий для тестов А-Н: тестируемые соединения вначале растворяли в ацетоне в количестве, равном 3% от конечного объема, а затем суспендировали в желательной концентрации (в ч/млн) в ацетоне и очищенной воде (смесь 50/50 по объему), включая 250 ч/млн поверхностно-активного вещества Trem® 014 (сложные эфиры многоатомных спиртов). Полученные в результате тестируемые суспензии затем использовали в тестах А-Н. Распыление 200 ч/млн тестируемой суспензии до момента стекания по тестируемым растениям было эквивалентно норме 600 г/га. Если не указано иное, номинальные значения указывают, что применяли 200 ч/млн тестируемой суспензии. (В таблице А, звездочка “*” рядом с номинальным значением указывает на то, что использовали 40 ч/млн тестируемой суспензии, а две звездочки “**” рядом с номинальным значением указывают на то, что использовали 130 ч/млн тестируемой суспензии, и три звездочки “***” указывают на то, что использовали 500 ч/млн тестируемой суспензии.)

ТЕСТ А

Проростки винограда инокулировали суспензией спор *Plasmopara viticola* (возбудитель

ложномучнистой росы винограда) и инкубировали в насыщенной атмосфере при 20°C в течение 24 часов. После короткого периода сушки тестируемую суспензию наносили опрыскиванием на проростки винограда до момента стекания, а затем проростки переносили в вегетационную камеру при 20°C на 4 дня, по истечении которых проростки переносили обратно в насыщенную атмосферу при 20°C на 24 часа. После удаления визуально оценивали болезнь.

ТЕСТ В

Тестируемую суспензию распыляли до момента стекания на проростки томата. На следующий день проростки инокулировали суспензией спор *Botrytis cinerea* (возбудитель болезни серая гниль томатов) и инкубировали в насыщенной атмосфере при 20°C в течение 48 часов, а затем перемещали в вегетационную камеру при 24-27°C на 2-3 дня, после чего производили визуальную оценку болезни.

ТЕСТ С

Тестируемую суспензию распыляли до момента стекания на проростки томата. На следующий день проростки инокулировали суспензией спор *Alternaria solani* (возбудитель болезни бурая пятнистость томатов) и инкубировали в насыщенной атмосфере при 27°C в течение 48 часов, а затем перемещали в вегетационную камеру при 20°C на 5 дней, после чего производили визуальную оценку болезни.

ТЕСТ D

Тестируемую суспензию распыляли до момента стекания на проростки томата. На следующий день проростки инокулировали суспензией спор *Phytophthora infestans* (возбудитель болезни фитофтороз томатов) и инкубировали в насыщенной атмосфере при 20°C в течение 24 часов, а затем перемещали в вегетационную камеру при 20°C на 5 дней, после чего производили визуальную оценку болезни.

ТЕСТ Е

Тестируемую суспензию наносили опрыскиванием на проростки пшеницы до момента стекания. На следующий день проростки инокулировали суспензией спор *Septoria nodorum* (также известных как *Stagonospora nodorum*; возбудитель болезни септориоз колосковой чешуи) и инкубировали в насыщенной атмосфере при 20-24°C в течение 48 часов, а затем перемещали в вегетационную камеру при 20°C на 6 дней, после чего производили визуальную оценку болезни.

ТЕСТ F

Тестируемую суспензию наносили опрыскиванием на проростки пшеницы до момента стекания. На следующий день проростки инокулировали суспензией спор *Septoria tritici* (возбудитель болезни септориоз колосковой чешуи) и инкубировали в насыщенной атмосфере при 24°C в течение 48 ч, а затем перемещали в вегетационную камеру при 20°C на 19 дней, после чего производили визуальную оценку болезни.

ТЕСТ G

Тестируемую суспензию наносили опрыскиванием на проростки пшеницы до момента стекания. На следующий день проростки инокулировали суспензией спор *Puccinia recondita* f. sp. *tritici* (возбудитель болезни листовая ржавчина пшеницы) и инкубировали в насыщенной атмосфере при 20°C в течение 24 часов, а затем перемещали в вегетационную камеру при 20°C на 6 дней, после чего производили визуальную оценку болезни.

ТЕСТ H

Тестируемую суспензию наносили опрыскиванием на проростки пшеницы до момента стекания. На следующий день проростки инокулировали порошком спор *Blumeria graminis* f. sp. *tritici* (также известных как *Erysiphe graminis* f. sp. *tritici*, возбудитель болезни

настоящая мучнистая роса пшеницы) и инкубировали в вегетационной камере при 20°C в течение 8 дней, после чего производили визуальную оценку болезни.

Результаты для тестов А-Н приведены в таблице А. В таблице оценка 100 указывает на 100% контроль болезни, а оценка 0 указывает на отсутствие контроля болезни (в сравнении с контролями). Дефис (-) указывает на отсутствие результатов теста. Звездочка “*” рядом с номинальным значением указывает на то, что использовали 40 ч/млн тестируемой суспензии, две звездочки “**” рядом с номинальным значением указывают на то, что использовали 130 ч/млн тестируемой суспензии, а три звездочки “***” рядом с номинальным значением указывает на то, что использовали 500 ч/млн тестируемой суспензии.

ТАБЛИЦА А

№ соедин.	Тест А	Тест В	Тест С	Тест D	Тест Е	Тест F	Тест G	Тест Н
1	-	99	-	0	100	100	54	100
2	-	64	-	0	-	100	0	95
3	-	26	-	0	-	100	0	95
4	-	24	-	0	-	100	0	97
5	-	17	83	0	0	100	0	96
6	0	68	99	0	0	99	70	93
7	-	58	-	0	-	99	0	98
8	-	0	-	0	0	100	0	0
9	-	0	-	0	0	100	0	0
10	-	0	-	0	60	100	0	50
11	-	0	-	0	0	100	0	0
12	-	40	-	0	-	100	0	90
13	-	0	-	0	-	88	0	26
14	33	0	-	0	0	95	0	21
15	7	0	-	0	0	100	0	95
16	-	95	-	0	98	100	0	99
17	-	0	-	0	-	100	0	96
18	-	0	-	0	-	100	0	96
19	-	0	-	0	-	71	0	79
20	-	36	-	0	-	71	0	0
21	-	38	-	0	-	0	0	0
22	-	0	-	0	-	0	0	0
23	-	8	-	0	-	93	0	93
24	-	15	-	0	-	50	0	0
25	-	31	-	0	-	99	0	0
26	-	31	-	0	-	99	0	87
27	-	99	-	0	-	100	28	99
28	0	0	-	0	-	0	0	0
29	-	47	-	0	0	97	68	72
31	-	92	-	0	100	100	0	100
32	-	82	-	0	0	100	0	95
33	-	67	-	0	100	100	68	100
34	-	32	-	0	0	100	28	99
35	7	85	-	0	94	100	0	100
36	-	99	-	0	99	100	41	100
37	-	99	-	0	0	100	0	99
38	-	9	-	0	0	100	0	87
39	-	0	-	0	0	100	0	96
40	-	66	-	0	100	100	0	100
41	-	46	-	0	66	99	0	95
42	-	98	-	0	100	100	0	99

RU 2 669 358 C2

5	43	6	0	-	0	0	89	84	43
	44	-	0	-	0	0	28	0	0
	45	-	9	-	0	0	100	0	94
	46	-	53	-	0	60	100	0	99
	47	-	68	-	0	95	100	0	99
	48	-	31	-	0	0	99	0	97
	49	-	60	-	0	0	100	28	99
	50	-	0	-	0	92	100	0	99
	51	-	0	-	0	75	99	0	98
	52	-	9	-	0	78	100	0	50
10	53	-	88	-	0	99	100	0	100
	54	-	80	-	0	100	100	0	100
	55	-	97	-	0	100	100	0	100
	56	-	57	-	0	100	100	0	100
	57	-	-	-	0	75	99	0	98
15	59	-	16	-	0	92	100	0	99
	60	-	29	-	0	69	100	0	100
	61	0	53	-	0	100	-	0	100
	62	0	33	-	0	100	100	27	99
	63	0	73	-	47	99	100	0	99
	64	15	0	-	0	0	94	0	0
	65	25	0	-	0	0	82	0	0
20	66	7	0	-	0	0	85	0	0
	67	7	0	-	0	0	31	0	0
	68	-	79	-	0	95	100	0	100
	69	-	40	-	0	-	99	0	98
	70	-	24	-	0	0	100	0	98
25	71	0	0	-	0	0	99	0	100
	72	7	0	-	0	97	100	0	98
	73	0	0	-	0	40	97	0	0
	74	0	66	-	0	98	99	0	90
	75	0	0	-	0	0	99	0	76
30	76	0	39	-	0	89	99	0	21
	77	0	0	-	0	0	28	0	0
	78	7	39	-	0	0	94	0	0
	79	37	9	-	0	0	82	0	0
	80	0	0	-	0	0	87	0	47
35	81	49	88	-	0	100	100	0	100
	82	0	0	-	0	0	92	0	73
	83	15	86	-	0	98	99	0	99
	84	0	61	-	0	73	100	0	90
	85	0	95	-	0	100	100	0	100
40	86	8	96	-	0	100	99	0	99
	87	16	15	-	0	0	99	0	96
	88	8	-	-	0	100	99	68	99
	89	17	-	-	0	92	100	0	100
	90	8	-	-	0	67	100	0	98
45	91	0	-	-	0	95	100	0	100
	92	0	-	-	0	100	100	0	100
	93	0	0	-	0	99	98	0	97
	94	0**	30**	-	0**	82**	100**	0**	100**
	95	0	77	-	0	89	99	0	99
	96	-	-	-	-	99	100	0	100
	97	-	-	-	-	100	100	0	100
	98	0	100	-	0	99	100	0	99
	99	0	99	-	0	100	100	0	100

RU 2 669 358 C2

5	100	0	99	-	0	100	100	0	100
	101	-	-	-	-	100	100	0	100
	102	0	99	-	0	100	99	0	95
	103	-	-	-	-	100	100	55	100
	104	-	-	-	-	100	100	0	100
	105	-	-	-	-	100	100	41	100
	106	0	99	-	0	99	99	0	99
	107	-	-	-	-	100	100	94	100
10	108	-	-	-	-	100	100	91	100
	109	0	99	-	0	99	100	0	99
	110	-	-	-	-	100	100	98	99
	111	-	-	-	-	100	100	17	100
	112	-	-	-	-	100	100	9	100
	113	-	-	-	-	100	100	0	100
	114	-	-	-	0	100	100	0	100
15	115	-	-	-	-	100	99	0	100
	116	-	-	-	0	100	100	0	100
	117	-	-	-	0	94	82	0	97
	118	-	-	-	0	100	100	0	100
	119	-	-	-	0	100	100	0	100
	120	-	-	-	0	100	99	0	100
20	121	-	-	-	0	100	100	0	100
	122	0	50	100	0	0	100	0	94
	123	0	0	99	0	90	99	41	97
	124	31	0	9	0	0	0	0	0
	125	78	0	91	0	29	98	94	99
25	127	0	0	-	0	-	94	0	0
	128	8	94	-	0	-	100	0	93
	130	17	21	-	0	-	95	0	0
	131	17	33	-	0	-	100	0	91
	132	0	0	-	0	-	0	0	0
	133	8	91	-	53	-	100	0	94
	134	0	0	-	0	-	96	0	21
30	135	0	0	-	0	-	96	0	95
	136	0	0	-	0	-	71	0	0
	137	8	56	-	17	-	99	0	98
	138	-	-	-	-	100*	100*	0*	100*
	139	-	-	-	-	100*	100*	0*	100*
	140	-	-	-	-	100*	100*	0*	100*
	141	-	-	-	-	100*	100*	0*	100*
	142	-	-	-	-	100*	100*	0*	100*
	143	-	-	-	-	100*	100*	0*	100*
	144	-	67	-	-	0	100	0	94
	145	-	8	-	-	0	97	0	64
	146	-	99	-	-	100	100	73	100
	147	-	0	-	-	97	100	94	84
	148	-	17	-	0	0	97	74	0
40	149	-	95	-	0	99	100	55	96
	150	-	-	-	-	100*	100*	0*	100*
	151	-	95	-	0	-	99	100	98
	152	2	42	-	0	-	100	100	100
	153	4	8	-	0	-	100	100	97
	154	15	0	-	0	-	74	99	91
	155	15	57	-	0	-	100	100	99
	156	-	91	-	0	100	100	100	100
	157	-	0	-	-	0	100	100	97

RU 2 669 358 C2

5	158	-	0	-	0	0	100	99	26
	159	-	39	-	0	0	100	100	97
	160	-	0	-	0	0	56	99	0
	161	-	70	-	0	0	98	99	26
	162	-	94	-	0	99	100	100	100
	163	-	26	-	0	0	97	99	98
	164	-	0	-	0	0	89	99	0
	165	-	0	-	0	0	97	100	0
10	166	-	99	-	0	0	100	99	99
	167	-	99	-	0	100	100	100	100
	168	0	37	-	0	100	100	100	100
	169	-	33	-	0	60	98	99	99

15	170	0	0	-	0	0	100	100	100
	171	8	17	-	0	0	100	100	100
	172	0	65	-	0	100	100	100	100
	173	0	72	-	0	100	100	100	100
	174	15	0	-	0	60	96	98	43
	175	8	86	-	0	100	100	100	100
	176	0	0	-	0	0	47	92	0
	177	0	0	-	0	0	58	95	43
20	178	8	0	-	0	60	100	100	98
	179	0	0	-	0	20	-	100	100
	180	0	0	-	0	98	100	100	100
	181	25	71	-	0	100	100	100	100
25	182	0	97	-	0	99	100	100	100
	183	87	99	-	0	100	100	100	100
	184	0	87	-	0	100	100	100	100
	185	0	0	-	0	0	-	99	47
	186	0	65	-	0	99	-	100	91
	187	0	0	-	0	0	-	94	0
	188	0	0	-	0	0	-	100	99
	189	0	96	-	0	100	100	100	100
30	190	8	17	-	0	0	100	100	99
	191	23	94	-	0	0	100	100	91
	192	0	-	-	0	0	99	100	69
	193	0	-	-	0	0	100	100	99
	194	0	-	-	0	92	99	100	97
	195	8	73	-	0	95	100	100	100
35	196	0	0	-	0	87	100	100	100
	197	0	100	-	0	100	99	100	100
	198	-	-	-	-	98	100	100	100
	199	-	58	-	-	0	100	99	87
	200	-	-	-	-	73*	100*	100*	100*
	201	-	-	-	-	78*	100*	100*	100*
40	202	-	-	-	-	87*	97*	100*	100*
	203	-	-	-	-	0*	100*	100*	99*

45	204	-	-	-	-	0*	97*	100*	99*
	205	-	-	-	-	94*	100*	100*	99*
	206	-	-	-	-	0*	100*	100*	91*
	207	-	-	-	-	73*	100*	100*	99*
	208	-	-	-	-	0*	0*	96*	21*
	209	-	-	-	-	0*	100*	8*	98*
	210	-	-	-	-	95*	100*	100*	100*
	211	-	-	-	-	97*	100*	100*	100*
	212	-	-	-	-	100*	100*	100*	100*

RU 2 669 358 C2

5	213	-	-	-	-	100*	100*	100*	100*
	214	-	-	-	-	100*	100*	100*	100*
	215	-	-	-	-	100*	100*	100*	100*
	216	-	-	-	-	60*	100*	100*	99*
	217	-	-	-	-	73*	100*	100*	99*
	218	-	-	-	-	73*	100*	100*	99*
	219	-	-	-	-	99*	100*	100*	100*
	220	-	-	-	-	82*	87*	88*	99*
10	221	-	-	-	-	73*	100*	100*	100*
	222	-	-	-	-	100*	100*	100*	100*
	223	-	-	-	-	100*	100*	100*	100*
	224	-	72	-	-	78	100	100	100
	225	-	-	-	-	69*	0*	98*	100*
	226	-	-	-	-	97*	100*	100*	98*
15	227	-	92	-	-	99	100	100	100
	228	-	-	-	-	0	0	82	0
	229	-	0*	-	-	0*	20*	0*	8*
	230	-	0	-	-	0	27	79	29
	231	-	0	-	-	0	0	38	90
	232	-	81	-	-	-	-	100	97
20	233	-	96	-	-	-	98	100	99
	234	-	0	-	-	0	0	0	0
	235	-	41	-	-	60	23	89	97
	236	-	95	-	-	99	100	100	97
	237	-	99*	-	-	100*	100*	100*	100*
25	238	-	97*	-	-	94*	100*	100*	100*
	239	-	99*	-	-	98*	100*	100*	99*
	240	-	99*	-	-	90*	100*	100*	99*
	241	-	92*	-	-	0*	100*	99*	100*
	242	-	29*	-	-	0*	97*	95*	100*
	243	-	73*	-	-	0*	100*	100*	98*
	244	-	99*	-	-	99*	100*	100*	100*
	245	-	98*	-	-	87*	88*	73*	96*
30	246	-	99*	-	-	94*	100*	100*	99*
	247	-	99*	-	-	100*	100*	100*	100*
	248	-	100*	-	-	100*	100*	100*	100*
	249	-	15*	-	-	0*	0*	0*	0*
	250	-	15*	-	-	0*	0*	0*	0*
	251	-	28*	-	-	60*	70*	82*	0*
35	252	-	15	-	-	0	-	0	64
	253	-	15*	-	-	0*	0*	79*	0*
	254	-	46*	-	-	0*	-	97*	87*
	255	-	0*	-	-	0*	100*	96*	100*
	256	-	54*	-	-	78*	-	100*	100*
	257	-	71	-	-	0	100	99	0
40	258	-	21	-	-	0	77	0	98
	259	-	49*	-	-	87*	-	100*	95*
	260	-	0	-	0	0	30	80	0
	261	-	60*	-	-	73*	100*	100*	99*
	262	-	51*	-	-	0*	79*	100*	90*
	263	-	9*	-	-	0*	-	100*	94*
45	264	-	94*	-	-	99*	-	100*	99*
	265	-	83*	-	-	84*	100*	100*	93*
	266	-	53*	-	-	0*	53*	85*	0*
	267	-	0*	-	-	0*	43*	99*	0*
	268	-	100*	-	-	90*	100*	100*	100*

RU 2 669 358 C2

	269	-	99*	-	-	100*	100*	0*	100*
	270	-	99*	-	-	100*	100*	0*	100*
	271	-	85*	-	-	98*	100*	0*	97*
5	272	-	99*	-	-	100*	100*	68*	100*
	273	-	99*	-	-	100*	100*	0*	100*
	274	-	44*	-	-	0*	100*	0*	95*
	275	-	89*	-	-	100*	100*	0*	100*
	276	-	99*	-	-	100*	100*	0*	100*
10	277	-	73*	-	-	87*	100*	0*	99*
	278	-	78*	-	-	100*	100*	0*	99*
	279	-	97*	-	-	100*	100*	68*	99*
	280	-	95*	-	-	100*	100*	28*	93*
	281	-	87*	-	-	100*	100*	28*	99*
15	282	-	99*	-	-	100*	100*	0*	100*
	283	-	100*	-	-	100*	100*	0*	100*
	284	-	99*	-	-	100*	100*	0*	100*
	285	-	91*	-	-	100*	100*	0*	98*
	286	-	-	-	-	99*	100*	0*	99*
20	287	-	-	-	-	100*	100*	17*	96*
	288	-	-	-	-	100*	100*	26*	100*
	289	-	-	-	-	100*	100*	0*	99*
	290	-	-	-	-	100*	100*	0*	95*
	291	-	-	-	-	100*	100*	0*	96*
25	292	-	-	-	-	100*	100*	0*	73*
	293	-	-	-	-	100*	100*	17*	93*
	294	-	-	-	-	100*	100*	0*	98*
	295	-	-	-	-	100*	100*	0*	91*
	296	-	-	-	-	100*	100*	0*	96*
30	297	-	-	-	-	100*	100*	0*	56*
	298	-	-	-	-	98*	100*	0*	79*
	299	-	17*	-	-	100*	69*	0*	99*
	300	-	100*	-	-	100*	89*	100*	99*
	301	-	100*	-	-	100*	99*	86*	99*
40	302	-	99*	-	-	100*	95*	0*	85*
	303	-	69*	-	-	87*	37*	0*	0*
	304	-	99*	-	-	100*	100*	19*	100*
	305	-	100	-	-	100	100	67	100
45	306	-	100	-	-	100	100	67	97
	307	-	99	-	-	99	100	0	90
	308	-	98	-	-	100	100	85	95
	309	-	46	-	-	99	100	28	0
	310	-	97	-	-	96	100	9	0
50	311	-	89	-	-	99	100	68	98
	312	-	-	-	-	100*	100*	26*	100*
	313	-	99	-	-	99	100	53	100
	314	-	8	-	-	0	100	100	98
	315	-	46*	-	-	95*	100*	99*	81*
55	316	-	73*	-	-	99*	100*	100*	99*
	317	-	77*	-	-	100*	100*	100*	100*
	318	-	99*	-	-	99*	100*	100*	100*
	319	-	59*	-	-	99*	77*	100*	72*
	320	-	86*	-	-	99*	100*	100*	100*
60	321	-	99*	-	-	100*	100*	100*	100*
	322	-	88*	-	-	99*	100*	100*	100*
	323	-	0*	-	-	98*	95*	100*	98*

RU 2 669 358 C2

5	324	-	78*	-	-	100*	92*	100*	99*
	325	-	0*	-	-	99*	79*	100*	99*
	326	-	6*	-	-	11*	39*	68*	0*
	327	-	94*	-	-	99*	100*	100*	96*
	328	-	92*	-	-	100*	100*	100*	99*
	329	-	67*	-	-	0*	100*	100*	99*
	330	-	56*	-	-	82*	28*	0*	0*
	331	-	81	-	-	99	100	100	96
	332	-	94	-	-	99	100	100	100
	333	-	99*	-	-	100*	100*	100*	100*
10	334	-	99*	-	-	100*	100*	100*	99*
	335	-	61*	-	-	99*	100*	100*	100*
	336	-	-	-	-	99*	100*	100*	99*
	337	-	89*	-	-	100*	100*	100*	100*
	338	0	100	-	-	99	100	0	99
	339	0	99	-	-	99	100	200	99
15	340	-	0*	-	-	0*	22*	0*	0*
	341	-	0*	-	-	0*	4*	0*	0*
	342	-	33*	-	-	0*	47*	25*	0*
	343	-	0*	-	-	0*	10*	53*	0*
	344	-	-	-	-	100	100	85	98
20	345	-	0***	-	-	0***	0***	40***	0***
	346	-	15***	-	-	0***	0***	17***	0***
	347	-	78*	-	-	97*	100*	100*	43*
	348	-	0*	-	-	98*	46*	86*	0*
	349	-	97*	-	-	99*	100*	100*	99*
25	350	-	81*	-	-	-	100*	100*	97*
	351	-	28*	-	-	99*	100*	100*	99*
	352	-	40*	-	-	0*	100*	100*	90*
	353	-	0*	-	-	0*	10*	99*	0*
	354	-	99*	-	-	0*	97*	99*	0*
30	355	-	20*	-	-	0*	43*	88*	69*
	356	-	0*	-	-	60*	100*	100*	96*
	357	-	0*	-	-	0*	100*	100*	98*
	358	-	41*	-	-	90*	100*	97*	100*
	359	-	99*	-	-	99*	100*	100*	100*
35	360	-	62*	-	-	90*	100*	98*	0*
	361	-	0*	-	-	0*	100*	97*	91*
	362	-	62*	-	-	99*	100*	100*	100*
	363	-	99*	-	-	98*	100*	100*	100*
	364	-	31*	-	-	99*	100*	96*	26*
40	365	-	98*	-	-	69*	100*	100*	98*
	366	-	87*	-	-	99*	100*	100*	100*
	367	-	66*	-	-	100*	100*	100*	100*
	368	-	68*	-	-	51*	100*	98*	21*
	369	-	97*	-	-	95*	100*	100*	99*
45	370	-	-	-	-	69	100	100	96
	371	-	-	-	-	0	100	99	96
	372	-	-	-	-	100	100	100	99
	373	-	-	-	-	0*	88*	79*	0*
	374	-	99*	-	-	0*	88*	100*	0*
	375	-	-	-	-	0*	100*	100*	0*
	376	-	28*	-	-	0*	76*	99*	0*
	377	-	43*	-	-	100*	23*	100*	0*
	378	-	-	-	-	0	100	100	100

ТЕСТ I

Контроль южной галловой нематоды (*Meloidogyne incognita*) с помощью способов контактного и/или системного воздействия оценивали в тестовых модулях, включавших небольшие открытые контейнеры, заполненные смесью песчаного грунта и проростками

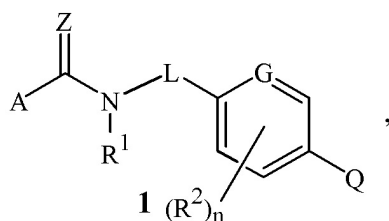
огурцов. Тестируемые соединения были составлены с использованием раствора, содержащего 50% ацетона и 50% воды. Тестируемые соединения вносили непосредственно в почву тестовых модулей при концентрациях активного ингредиента 250 или 50 ч/млн. Каждый тест повторяли 3 раза. После обработки тестовым модулям давали возможность сохнуть в течение 1 ч, после чего приблизительно 250 молодых личинок второй стадии (J2) вносили пипеткой в почву. Тестовые модули содержали при 27°C и поливали по мере необходимости в течение 7 дней.

Нематоцидную эффективность определяли по количеству образованных корневых галл, наблюдавшихся при сравнении с необработанным контролем. Отсутствие образования галл свидетельствовало о 100% контроле нематод. Образование галл, равное таковому, обнаруживаемому у необработанного контроля, свидетельствовало о 0% контроле. Оценку контроля нематод не присваивали соединениям, проявлявшим значительную фитотоксичность.

Из соединений, протестированных при концентрации 250 ч/млн, обеспечивали высокие уровни защиты растений (уменьшение образования корневых галл на 50% или более по сравнению с контролями, обработанными растворителем) и не проявляли значительную фитотоксичность следующие: 1, 2, 3, 4, 5, 6, 7, 9, 10, 17, 27, 29, 31, 33, 34, 35, 36, 37, 40, 50, 51, 53, 54, 55, 56, 58, 59, 60, 62, 69, 70, 71, 75, 84, 85, 86, 89, 92, 93, 96, 97, 99, 100, 101, 103, 105, 112, 128, 129, 130, 131, 133, 134, 135, 137, 142, 144 и 150.

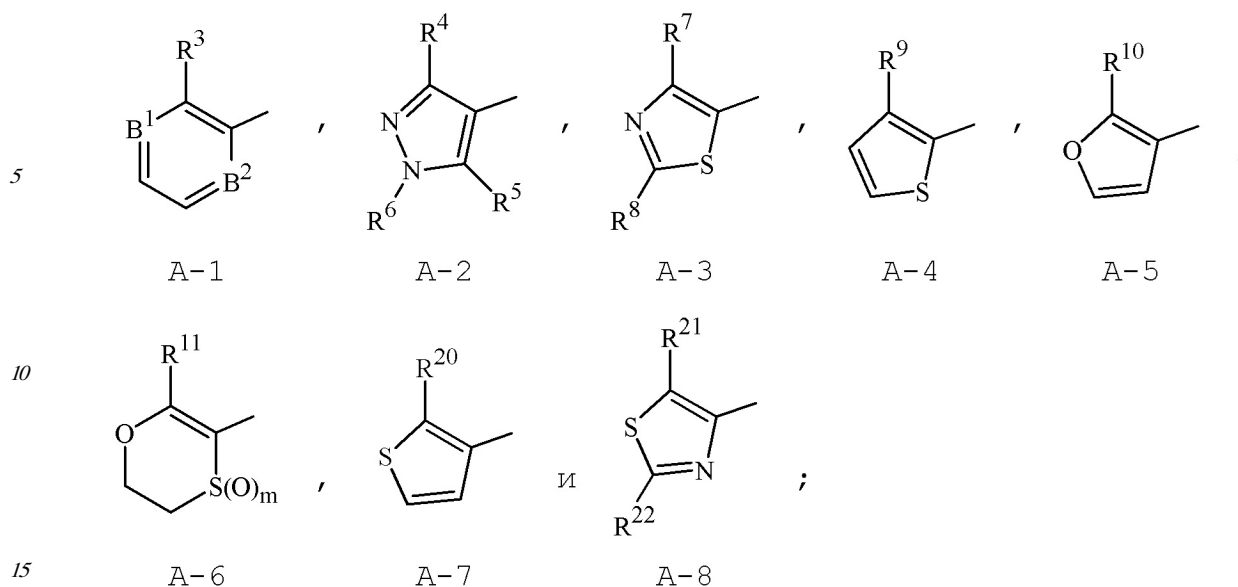
(57) Формула изобретения

1. Соединение, выбранное из формулы 1 и соли:



где

A представляет собой радикал, выбранный из группы, состоящей из



R^1 представляет собой H или циклопропил;

Z представляет собой O или S;

L представляет собой $-C(R^{12a})R^{12b}-C(R^{13a})R^{13b}-$, где атом углерода, связанный с R^{12a} и R^{12b} , также связан с атомом азота карбоксиамида в формуле 1; или 1,2-фенилен, необязательно имеющий до 4 заместителей, независимо выбранных из галогена и C_1 - C_2 алкила;

G представляет собой N или $C-R^{2a}$;

каждый R^2 независимо представляет собой галоген, нитро, циано, C_1 - C_2 алкил или C_1 - C_2 галогеналкил;

n равняется 0, 1, 2 или 3;

R^{2a} представляет собой H, галоген, C_1 - C_2 алкил, C_1 - C_2 галогеналкил или C_1 - C_2 алкокси;

B^1 представляет собой CH или N;

B^2 представляет собой CH или N;

R^3 представляет собой галоген, C_1 - C_3 алкил или C_1 - C_3 галогеналкил;

R^4 представляет собой C_1 - C_3 галогеналкил;

R^5 представляет собой H;

R^6 представляет собой C_1 - C_2 алкил;

R^7 представляет собой C_1 - C_3 алкил или C_1 - C_3 галогеналкил;

R^8 представляет собой H или C_1 - C_2 алкил;

R^9 представляет собой галоген, C_1 - C_3 алкил или C_1 - C_3 галогеналкил;

R^{11} представляет собой C_1 - C_3 алкил;

m равняется 0, 1 или 2;

каждый из R^{12a} и R^{12b} независимо представляет собой H, C_1 - C_2 алкил;

R^{12a} и R^{12b} , взятые вместе, представляют собой C_2 - C_4 алкандиил;

R^{13a} представляет собой H, галоген, C_1 - C_2 алкил, C_1 - C_2 алкокси или C_1 - C_2 алкоксиамино;

R^{13b} представляет собой H, галоген; или

R^{13a} и R^{13b} , взятые вместе, представляют собой C_2 - C_4 алкандиил;

Q представляет собой 5-членное ненасыщенное гетероциклическое кольцо, содержащее члены кольца, выбранные из атомов углерода и до 3 гетероатомов, независимо выбранных из до 1 атома O, до 3 атомов N, где до 1 члена кольца, представляющего собой атом углерода, независимо выбран из $C(=O)$, причем кольцо обязательно замещено одним заместителем при члене кольца, удаленном относительно члена кольца, соединяющего кольцо с остальной частью формулы 1, причем указанный необязательный заместитель выбран из R^{14c} при членах кольца, представляющих собой атом углерода, и из R^{14n} при членах кольца, представляющих собой атом азота, при этом гетероциклическое кольцо дополнительно обязательно замещено заместителями, выбранными из R^{15c} при членах кольца, представляющих собой атом углерода, и R^{15n} при членах кольца, представляющих собой атом азота;

каждый R^{14c} независимо представляет собой галоген, C_1 - C_3 алкил, C_1 - C_3 галогеналкил, C_2 - C_3 алкоксикарбонил; или фенильное кольцо, которое обязательно имеет до 2 заместителей, независимо выбранных из R^{16} ;

каждый R^{14n} независимо представляет собой C_1 - C_3 алкил, C_1 - C_3 галогеналкил;

каждый R^{15c} независимо представляет собой галоген, C_1 - C_3 алкил, C_1 - C_3 галогеналкил;

каждый R^{15n} независимо представляет собой C_1 - C_3 алкил;

каждый из R^{16} представляет собой галоген

R^{20} представляет собой C_1 - C_3 алкил;

R^{21} представляет собой C_1 - C_3 алкил или C_1 - C_3 галогеналкил; и

R^{22} представляет собой H;

при условии, что соединение формулы 1 является отличным от следующих: 2-метил-N-[2-[4-(1H-пиразол-1-ил)фенил]этил]-5-тиазолкарбоксамид, N-[2-[4-(3,5-диметил-1H-пиразол-1-ил)фенил]этил]-1,3,5-триметил-1H-пиразол-4-карбоксамид, 2-бром-N-[2-[4-(1H-пиразол-1-ил)фенил]этил]бензамид, 3-метил-N-[2-[4-(1H-пиразол-1-ил)фенил]этил]-2-тиофенкарбоксамид, 2-метил-N-[2-[4-(1H-пиразол-1-ил)фенил]этил]бензамид, 2-йод-N-[2-[4-(1H-пиразол-1-ил)фенил]этил]бензамид, 2-фтор-N-[2-[4-(1H-пиразол-1-ил)фенил]этил]бензамид, 2-хлор-N-[2-[4-(1H-пиразол-1-ил)фенил]этил]бензамид, 5-хлор-1,3-диметил-N-[2-[4-(2-метил-4-тиазолил)фенил]этил]-1H-пиразол-4-карбоксамид, 2-метил-N-[2-[4-(2-метил-4-тиазолил)фенил]этил]бензамид, 2-метил-N-[2-[4-(2-метил-4-тиазолил)фенил]этил]-3-фуранкарбоксамид, 2-фтор-N-[2-[4-(2-метил-4-тиазолил)фенил]этил]бензамид, 2-бром-N-[2-[4-(2-метил-4-тиазолил)фенил]этил]бензамид, 2-йод-N-[2-[4-(2-метил-4-тиазолил)фенил]этил]бензамид, N-[2-[4-(2-метил-4-тиазолил)фенил]этил]-2-(трифторметил)бензамид и 2-хлор-N-[2-[4-(2-метил-4-тиазолил)фенил]этил]бензамид.

2. Соединение по п. 1, где

Z представляет собой O;

L представляет собой $-C(R^{12a})R^{12b}-C(R^{13a})R^{13b}-$ или 1,2-фенилен, необязательно

имеющий до 2 заместителей, независимо выбранных из F, Cl, Br и CH₃;

каждый R² независимо представляет собой F, Cl, Br или CH₃;

R^{2a} представляет собой H, F, Cl, Br или CH₃;

R³ представляет собой F, Cl, Br, CH₃, CHF₂ или CF₃;

R⁴ представляет собой CHF₂ или CF₃;

R⁶ представляет собой CH₃;

R⁷ представляет собой CH₃, CHF₂ или CF₃;

R⁸ представляет собой H или CH₃;

R⁹ представляет собой F, Cl, Br, CH₃, CHF₂ или CF₃;

R¹¹ представляет собой CH₃;

R^{12a} представляет собой H или CH₃;

R^{12b} представляет собой H;

R^{13a} представляет собой H, CH₃ или OCH₃;

R^{13b} представляет собой H;

R¹⁶ представляет собой F, Cl, Br.

3. Соединение по п. 2, где

A представляет собой A-1, A-2, A-3 или A-4;

каждый R^{14c} независимо представляет собой F, Cl, Br, CH₃, CHF₂ или CF₃;

каждый R¹⁴ⁿ представляет собой CH₃;

каждый R^{15c} независимо представляет собой F, Cl, Br, CH₃, CHF₂ или CF₃; и

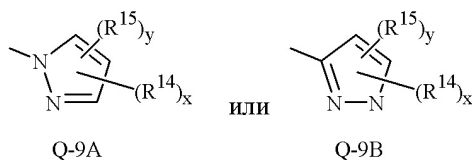
каждый R¹⁵ⁿ представляет собой CH₃.

4. Соединение по п. 3, где

A представляет собой A-1, A-2 или A-4;

B² представляет собой N; и

Q представляет собой



R¹⁴ является связанным с членом кольца, удаленным относительно члена кольца, соединяющего кольцо Q с остальной частью формулы 1, и независимо выбран из R^{14c} на членах кольца, представляющих собой атом углерода, и R¹⁴ⁿ на членах кольца, представляющих собой атом азота;

каждый R¹⁵ независимо выбирают из R^{15c} на членах кольца, представляющих собой атом углерода, и R¹⁵ⁿ на членах кольца, представляющих собой атом азота; каждый x представляет собой независимо 0 или 1; и

каждый у представляет собой независимо 0, 1 или 2.

5. Соединение по п. 4, где

L представляет собой $-C(R^{12a})R^{12b}-C(R^{13a})R^{13b}-$;

R^{2a} представляет собой H, F или Cl; и

каждый R^2 представляет собой F или Cl;

при условии когда G представляет собой N или R^{2a} представляет собой H, кольцо, содержащее G, замещено R^2 в орто-положении относительно связи с L.

6. Соединение по п. 4, где

L представляет собой 1,2-фенилен, необязательно имеющий до 2 заместителей, независимо выбранных из F, Cl, Br и CH_3 ;

R^{2a} представляет собой H, F или Cl;

каждый R^2 представляет собой F или Cl; и

кольцо, содержащее G, замещено по меньшей мере одним R^2 в орто-положении относительно связи с Q.

7. Соединение по п. 1, в котором, когда G представляет собой N или R^{2a} представляет собой H, кольцо, содержащее G, замещено по меньшей мере одним из вариантов R^2 .

8. Соединение по п. 1, где L представляет собой $-C(R^{12a})R^{12b}-C(R^{13a})R^{13b}-$.

9. Соединение по п. 1, выбранное из группы, состоящей из

3-хлор-N-[2-[2-хлор-4-(3-трифторметил)-1H-пиразол-1-ил]фенил-1-метилэтил]-2-пиразинкарбоксамида,

N-[2-[2-хлор-4-[3-(трифторметил)-1H-пиразол-1-ил]фенил]этил-3-(трифторметил)-2-пиридинкарбоксамида,

N-[3',5'-дифтор-4'-[3-(трифторметил)-1H-пиразол-1-ил][1,1'-бифенил]-2-ил]-3-(трифторметил)-2-пиридинкарбоксамида,

3-(дифторметил)-N-[3',5'-дифтор-4'-[3-(трифторметил)-1H-пиразол-1-ил][1,1'-бифенил]-2-ил]-1-метил-1H-пиразол-4-карбоксамида и

N-[2-[3-хлор-5-[3-(трифторметил)-1H-пиразол-1-ил]-2-пиридинил]этил]-2-(трифторметил)бензамида.

10. Фунгицидная композиция, содержащая (а) соединение по п. 1 и (б) по меньшей мере один другой фунгицид в соотношении в интервале между 300:1 и 1:300.

11. Фунгицидная композиция, содержащая (а) от 1 до 50 масс.% соединения по п. 1 и (б) по меньшей мере один дополнительный компонент, выбранный из группы, состоящей из от 0 до 50 масс.% поверхностно-активных веществ, от 40 до 99 масс.% твердых разбавителей и от 40 до 90 масс.% жидких разбавителей.

12. Способ защиты растения или семени растения от болезней, вызванных патогенными грибами, включающий применение по отношению к растению или семени растения фунгицидно эффективного количества соединения по любому из пп. 1-9.

13. Способ контроля растительной нематоды, включающий обеспечение контакта нематоды или ее среды обитания с нематоцидно эффективным количеством соединения по п. 8.

14. Способ по п. 12, где патогенные грибы являются устойчивыми к ингибиторам сукцинатдегидрогеназы.

15. Способ по п. 14, где патогенные грибы, устойчивые к ингибиторам сукцинатдегидрогеназы, выбирают из группы, состоящей из *Alternaria alternata*, *Aspergillus*

oryzae, *Botrytis cinerea*, *Botrytis elliptica*, *Corynespora cassiicola*, *Didymella bryoniae*, *Mycosphaerella graminicola*, *Podosphaera xanthii*, *Sclerotinia sclerotiorum*, *Ustilago maydis*, *Stemphylium botryose* and *Ustilago maydis*.

5

10

15

20

25

30

35

40

45