



УКРАЇНА

(19) UA

(11) 128485

(13) C2

(51) МПК

C07D 277/56 (2006.01)

A01N 43/78 (2006.01)

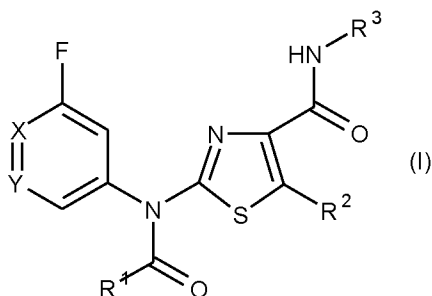
НАЦІОНАЛЬНИЙ ОРГАН
ІНТЕЛЕКТУАЛЬНОЇ ВЛАСНОСТІ
ДЕРЖАВНА ОРГАНІЗАЦІЯ
"УКРАЇНСЬКИЙ НАЦІОНАЛЬНИЙ
ОФІС ІНТЕЛЕКТУАЛЬНОЇ
ВЛАСНОСТІ ТА ІННОВАЦІЙ"

(12) ОПИС ДО ПАТЕНТУ НА ВІНАХІД

(21) Номер заявки:	а 2021 03633	(72) Винахідник(и):	Бернс Девід (GB), Монако Маттіа Ріккардо (CH), Рендіне Стефано (CH), Ламберт Клеменс (CH), Блум Матіас (CH)
(22) Дата подання заявки:	28.11.2019	(73) Володілець (володільці):	СІНГЕНТА КРОП ПРОТЕКШН АГ, Rosentalstrasse 67, 4058 Basel, Switzerland (CH)
(24) Дата, з якої є чинними права інтелектуальної власності:	25.07.2024	(74) Представник:	Петров Андрій Володимирович, реєстр. №139
(31) Номер попередньої заявки відповідно до Парижської конвенції:	18209586.9	(56) Перелік документів, взятих до уваги експертизою:	WO 2010/012793 A1, 04.02.2010 WO 2017/207362 A1, 07.12.2017
(32) Дата подання попередньої заявки відповідно до Парижської конвенції:	30.11.2018		
(33) Код держави-учасниці Парижської конвенції, до якої подано попередню заявку:	EP		
(41) Публікація відомостей про заявку:	08.09.2021, Бюл.№ 36		
(46) Публікація відомостей про державну реєстрацію:	24.07.2024, Бюл.№ 30		
(86) Номер та дата подання міжнародної заявки, поданої відповідно до Договору РСТ	PCT/EP2019/082978, 28.11.2019		

(54) МІКРОБІОЦИДНІ 2-АЦИЛАМІНОТІАЗОЛ-4-КАРБОКСАМІДНІ ПОХІДНІ**(57)** Реферат:

Сполуки формули (I):



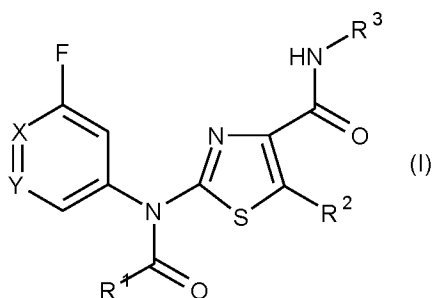
де замісники, визначені в п. 1 формули винаходу, є застосовними як пестициди і, зокрема, фунгіциди.

UA 128485 C2

Даний винахід стосується тiazольних похідних, що характеризуються мікробіоцидною активністю, наприклад таких як активні інгредієнти, які характеризуються мікробіоцидною активністю, зокрема фунгіцидною активністю. Даний винахід також стосується одержання таких тiazольних похідних, агрохімічних композицій, що містять щонайменше одну з тiazольних похідних, і варіантів застосування тiazольних похідних або композицій на їхній основі у сільському господарстві або садівництві для контролю або попередження зараження рослин, зібраних продовольчих сільськогосподарських культур, насіння або неживих матеріалів фітопатогенними мікроорганізмами, переважно грибами.

У WO 2010/012793 та WO 2017/207362 описані тiazольні похідні як пестицидні засоби.

Згідно з даним винаходом передбачена сполука формули (I),



де

Y являє собою C-F, C-H або N;

R¹ являє собою водень, C₁-C₆алкіл, C₁-C₆алкокси, C₁-C₆галогеналкіл, C₁-C₆гідроксиалкіл, C₁-C₆алкоксиC₁-C₆алкіл, C₃-C₆циклоалкіл, C₁-C₆алкоксиC₁-C₃алкокси, C₁-C₆алкоксикарбоніл, C₁-C₆алкоксикарбонілC₁-C₄алкіл, C₁-C₆алкоксикарбонілоксиC₁-C₄алкіл, C₁-C₆алкілкарбонілоксиC₁-C₄алкіл, C₂-C₆алкенілокси, C₂-C₆алкінілокси, C₁-C₆алкілсульфаніл, ді(C₁-C₆алкіл)аміно, феніл, фенілC₁-C₃алкіл, фенілC₁-C₃алкоксиC₁-C₃алкіл, фенокси або гетероарил, де гетероарил являє собою 5- або 6-членне ароматичне моноциклічне кільце, що містить 1 або 2 гетероатоми, окремо вибрані з азоту, кисню та сірки;

R² являє собою водень, галоген, ціано, C₁-C₄алкіл, C₁-C₄алкокси, C₁-C₄галогеналкіл або HC(O)NH-;

R³ являє собою C₁-C₈алкіл, C₁-C₈галогеналкіл, C₁-C₈алкокси, C₃-C₈циклоалкіл, C₃-C₈циклоалкілC₁-C₂алкіл (де циклоалкільні групи необов'язково заміщені 1–3 групами, представленими R⁴), феніл, фенілC₁-C₂алкіл, гетероарил, гетероарилC₁-C₂алкіл, де гетероарил являє собою 5- або 6-членне ароматичне моноциклічне кільце, що містить 1, 2, 3 або 4 гетероатоми, окремо вибрані з азоту, кисню та сірки, гетероцикліл, гетероциклілC₁-C₂алкіл, де гетероцикліл являє собою 4-, 5- або 6-членне неароматичне моноциклічне кільце, що містить 1, 2 або 3 гетероатоми, окремо вибрані з азоту, кисню та сірки, або 5-10-членну неароматичну спіроциклічну карбобі- або карботрициклічну кільцеву систему, що необов'язково містить 1, 2, 3, 4 або 5 гетероатомів, окремо вибраних з азоту, кисню та сірки, і де кожна з указаних спіроциклічних карбобі- або карботрициклічних кільцевих систем необов'язково зв'язана з рештою молекули за допомогою C₁-C₂алкіленового лінкера;

R⁴ являє собою галоген, C₁-C₄алкіл, C₁-C₄алкокси або C₁-C₄галогеналкіл;

X являє собою N або C-H;

або її сіль або N-оксид.

При цьому сполука формули (I) не являє собою 2-(N-ацетил-3-фторанілін)-N-ізопропіл-5-метилтіазол-4-карбоксамід або 2-(N-ацетил-3-фторанілін)-5-метил-N-втор-бутилтіазол-4-карбоксамід.

Несподівано було виявлено, що нові сполуки формули (I) характеризуються для практичних цілей дуже ефективним рівнем біологічної активності для захисту рослин від захворювань, спричинених грибами.

Додатково до цього було виявлено, що нові сполуки формули (I), де R¹ являє собою водень, C₁-C₆алкіл, C₁-C₆алкокси, C₁-C₆галогеналкіл, C₁-C₆гідроксиалкіл, C₁-C₆алкоксиC₁-C₆алкіл, C₃-C₆циклоалкіл, C₁-C₆алкоксиC₁-C₃алкокси, C₁-C₆алкоксикарбоніл, C₁-C₆алкоксикарбонілC₁-C₄алкіл, C₁-C₆алкоксикарбонілоксиC₁-C₄алкіл, C₁-C₆алкілкарбонілоксиC₁-C₄алкіл, C₂-C₆алкенілокси, C₂-C₆алкінілокси, C₁-C₆алкілсульфаніл, ді(C₁-C₆алкіл)аміно, феніл, фенілC₁-C₃алкіл, фенілC₁-C₃алкоксиC₁-C₃алкіл, фенокси або гетероарил, де гетероарил являє собою 5- або 6-членне ароматичне моноциклічне кільце, що містить 1 або 2 гетероатоми, окремо вибрані

з азоту, кисню та сірки, зокрема, якщо R^1 являє собою водень, C_1 - C_6 алкіл, C_1 - C_6 алкокси, C_1 - C_6 галогеналкіл, C_1 - C_6 алкокси C_1 - C_6 алкіл, C_3 - C_6 циклоалкіл, C_1 - C_6 алкокси C_1 - C_3 алкокси, C_1 - C_6 алкоксикарбоніл, C_1 - C_6 алкоксикарбоніл C_1 - C_4 алкіл, C_2 - C_6 алкенілокси, C_2 - C_6 алкінілокси, C_1 - C_6 алкілсульфаніл, феніл, фенокси або гетероарил, де гетероарил являє собою 5- або 6-членне ароматичне моноциклічне кільце, що містить 1 або 2 гетероатоми, окремо вибрані з азоту, кисню та сірки, можуть виявляти поліпшені властивості розчинності (зокрема, у неполярних розчинниках) та/або властивості світлостабільності порівняно з їхнім відповідним аміном, які відомі, наприклад, із WO 2017/207362.

Згідно з другим аспектом даного винаходу передбачена агрохімічна композиція, що містить фунгіцидно ефективну кількість сполуки формули (I) згідно з даним винаходом. Така композиція, яка застосовується у сільському господарстві, може додатково містити щонайменше один додатковий активний інгредієнт та/або агрохімічно прийнятний розріджувач або носій.

Згідно з третім аспектом даного винаходу передбачений спосіб контролю або попередження зараження корисних рослин фітопатогенними мікроорганізмами, де фунгіцидно ефективну кількість сполуки формули (I) або композиції, що містить дану сполуку як активний інгредієнт, застосовують щодо рослин, їхніх частин або їхнього місця зростання.

Згідно з четвертим аспектом даного винаходу передбачене застосування сполуки формули (I) як фунгіциду. Згідно з даним конкретним аспектом даного винаходу застосування може включати або може не включати способи лікування організму людини або тварини шляхом хірургічного втручання або терапії.

Якщо вказано, що замісники "необов'язково заміщені", це означає, що вони можуть нести або можуть не нести один або декілька ідентичних або різних замісників, наприклад один, два або три замісники R^4 . Наприклад, C_1 - C_8 алкіл, заміщений 1, 2 або 3 атомами галогену, може включати без обмеження групи $-CH_2Cl$, $-CHCl_2$, $-CCl_3$, $-CH_2F$, $-CHF_2$, $-CF_3$, $-CH_2CF_3$ або $-CF_2CH_3$. Як інший приклад C_1 - C_6 алкокси, заміщений 1, 2 або 3 атомами галогену, може включати без обмеження групи CH_2Cl -, $CHCl_2O$ -, CCl_3O -, CH_2FO -, CHF_2O -, CF_3O -, CF_3CH_2O - або CH_3CF_2O -.

Застосовуваний у даному документі термін "ціано" означає групу $-CN$.

Застосовуваний у даному документі термін "галоген" стосується фтору (фтору), хлору (хлору), броду (броду) або йоду (йоду).

Застосовуваний у даному документі термін " C_1 - C_8 алкіл" означає радикал із прямим або розгалуженим вуглеводневим ланцюгом, який складається лише з атомів вуглецю та водню, не містить ненасичених зв'язків, містить від одного до восьми атомів вуглецю та який приєднаний до решти молекули одинарним зв'язком. " C_1 - C_6 алкіл", " C_1 - C_4 алкіл" та " C_1 - C_3 алкіл" слід розуміти відповідним чином. Приклади C_1 - C_8 алкілу включають без обмеження метил, етил, н-пропіл та їхні ізомери, наприклад ізопропіл. Група " C_1 - C_6 алкілен" стосується відповідного визначення C_1 - C_6 алкілу, за винятком того, що такий радикал приєднаний до решти молекули двома одинарними зв'язками. Термін " C_1 - C_2 алкілен" слід розуміти відповідним чином. Приклади C_1 - C_6 алкілену включають без обмеження $-CH_2-$, $-CH_2CH_2-$ і $-(CH_2)_3-$.

Застосовуваний у даному документі термін " C_1 - C_6 гідроксиалкіл" стосується C_1 - C_6 алкільного радикала, який загалом визначений вище, заміщеного однією або декількома гідроксигрупами. Приклади C_1 - C_6 гідроксиалкілу включають без обмеження 1-гідроксиетил.

Застосовуваний у даному документі термін " C_1 - C_8 галогеналкіл" стосується C_1 - C_8 алкільного радикала, який загалом визначений вище, заміщеного одним або декількома однаковими або різними атомами галогену. Приклади C_1 - C_8 галогеналкілу включають без обмеження трифторметил.

Застосовуваний у даному документі термін " C_1 - C_8 алкокси" стосується радикала формули $-OR_a$, де R_a являє собою C_1 - C_8 алкільний радикал, який загалом визначений вище. Терміни " C_1 - C_6 алкокси", " C_1 - C_4 алкокси" та " C_1 - C_3 алкокси" слід розуміти відповідним чином. Приклади C_1 - C_8 алкокси включають без обмеження метокси, етокси, 1-метилетокси (ізопропокси) та пропокси.

Застосовуваний у даному документі термін " C_2 - C_6 алкеніл" стосується групи, яка являє собою вуглеводневий радикал із прямим або розгалуженим ланцюгом, що складається тільки з атомів вуглецю та водню, містить щонайменше один подвійний зв'язок, який може знаходитися або в (E)-, або в (Z)-конфігурації, має від двох до шести атомів вуглецю і приєднаний до решти молекули одинарним зв'язком. Термін " C_2 - C_3 алкеніл" слід розуміти відповідним чином. Приклади C_2 - C_6 алкенілу включають без обмеження етеніл (вініл), проп-1-еніл, проп-2-еніл (аліл), бут-1-еніл.

Застосовуваний у даному документі термін " C_2 - C_6 алкенілокси" стосується радикала формули $-OR_a$, де R_a являє собою C_2 - C_6 алкенільний радикал, який загалом визначений вище.

Застосовуваний у даному документі термін " C_2 - C_6 алкініл" стосується групи, яка являє собою вуглеводневий радикал із прямим або розгалуженим ланцюгом, що складається тільки з атомів

вуглецю і водню, містить щонайменше один потрійний зв'язок, має від двох до шести атомів вуглецю і приєднаний до решти молекули одинарним зв'язком. Термін "C₂-С₃алкініл" слід розуміти відповідним чином. Приклади C₂-С₆алкінілу включають без обмеження етиніл, проп-1-ініл, бут-1-ініл.

5 Застосовуваний у даному документі термін "C₂-С₆алкінілокси" стосується радикала формули -OR_a, де R_a являє собою C₂-С₆алкінільний радикал, який загалом визначений вище.

Застосовуваний у даному документі термін "C₁-С₆алкоксиC₁-С₆алкіл" стосується радикала формули R_bOR_a-, де R_b являє собою C₁-С₆алкільний радикал, який загалом визначений вище, та R_a являє собою C₁-С₆алкіленовий радикал, який загалом визначений вище.

10 Застосовуваний у даному документі термін "C₁-С₆алкоксиC₁-С₃алкокси" стосується радикала формули R_bOR_aO-, де R_b являє собою C₁-С₆алкільний радикал, який загалом визначений вище, та R_a являє собою C₁-С₃алкільний радикал, який загалом визначений вище.

Застосовуваний у даному документі термін "C₁-С₆алкоксикарбоніл" стосується радикала формули R_aOC(O)-, де R_a являє собою C₁-С₆алкільний радикал, який загалом визначений вище.

15 Застосовуваний у даному документі термін "C₁-С₆алкоксикарбонілC₁-С₄алкіл" стосується радикала формули R_aOC(O)R_b-, де R_a являє собою C₁-С₆алкільний радикал, який загалом визначений вище, та R_b являє собою C₁-С₄алкіленовий радикал, який загалом визначений вище.

20 Застосовуваний у даному документі термін "C₁-С₆алкоксикарбонілоксиC₁-С₄алкіл" стосується радикала формули R_aOCO₂R_b-, де R_a являє собою C₁-С₆алкільний радикал, який загалом визначений вище, та R_b являє собою C₁-С₄алкіленовий радикал, який загалом визначений вище. Приклади C₁-С₆алкоксикарбонілоксиC₁-С₄алкілу включають без обмеження 1-метоксикарбонілокси-етил та 1-метоксикарбонілокси-метил.

25 Застосовуваний у даному документі термін "C₁-С₆алкілкарбонілоксиC₁-С₄алкіл" стосується радикала формули R_aCO₂R_b-, де R_a являє собою C₁-С₆алкільний радикал, який загалом визначений вище, та R_b являє собою C₁-С₄алкіленовий радикал, який загалом визначений вище. Приклади C₁-С₆алкілкарбонілоксиC₁-С₄алкілу включають без обмеження 1-метилкарбонілокси-метил.

30 Застосовуваний у даному документі термін "C₁-С₆алкілсульфаніл" стосується радикала формули R_aS-, де R_a являє собою C₁-С₆алкільний радикал, який загалом визначений вище.

Застосовуваний у даному документі термін "ді(C₁-С₆алкіл)аміно" стосується радикала формули (R_a)(R_b)N-, де кожен з R_a та R_b окремо являє собою C₁-С₆алкільний радикал, який загалом визначений вище. Приклади ді(C₁-С₆алкіл)аміно включають без обмеження диметиламіно та діетиламіно.

35 Застосовуваний у даному документі термін "C₃-С₈циклоалкіл" стосується радикала, який являє собою моноциклічну насичену кільцеву систему і містить 3-8 атомів вуглецю. Терміни "C₃-С₆циклоалкіл", "C₃-С₄циклоалкіл" слід розуміти відповідним чином. Приклади C₃-С₆циклоалкілу включають без обмеження циклопропіл, 1-метилциклопропіл, 2-метилциклопропіл, циклобутил, 1-метилциклобутил, 1,1-диметилциклобутил, 2-метилциклобутил і 2,2-диметилциклобутил.

40 Застосовуваний у даному документі термін "C₃-С₈циклоалкілC₁-С₂алкіл" стосується C₃-С₈циклоалкільного кільця, приєднаного до решти молекули за допомогою C₁-С₂алкіленового лінкера, визначеного вище.

Застосовуваний у даному документі термін "фенілC₁-С₃алкіл" стосується фенільного кільця, приєднаного до решти молекули за допомогою C₁-С₃алкіленового лінкера, визначеного вище.

45 Застосовуваний у даному документі термін "фенілC₁-С₃алкоксиC₁-С₃алкіл" стосується радикала формули R_cR_bOR_a-, де кожен з R_a та R_b незалежно являє собою C₁-С₃алкіленовий радикал, який загалом визначений вище, та R_c являє собою фенільне кільце. Приклади фенілC₁-С₃алкоксиC₁-С₃алкілу включають без обмеження бензилоксиметил та 1-бензилоксиметил.

50 Застосовуваний у даному документі термін "гетероарил" стосується 5- або 6-членного ароматичного моноциклічного кільцевого радикала, який містить 1, 2, 3 або 4 гетероатоми, окремо вибрані з азоту, кисню та сірки. Приклади гетероарилу включають без обмеження фураніл, піроліл, тієніл, піразоліл, імідазоліл, тіазоліл, ізотіазоліл, оксазоліл, ізоксазоліл, триазоліл, тетразоліл, піразиніл, піридазиніл, піримідил або піридил.

55 Застосовуваний у даному документі термін "гетероарилC₁-С₂алкіл" стосується гетероарильного кільця, приєднаного до решти молекули за допомогою C₁-С₂алкіленового лінкера, визначеного вище.

60 Застосовуваний у даному документі термін "гетероцикліл" стосується стабільного 4-, 5- або 6-членного неароматичного моноциклічного кільця, яке містить 1, 2 або 3 гетероатоми, при цьому гетероатоми окремо вибрані з азоту, кисню та сірки. Гетероциклільний радикал може

бути зв'язаний із рештою молекули за допомогою атома вуглецю або гетероатома. Приклади гетероциклілу включають без обмеження азиридиніл, азетидиніл, оксетаніл, тіетаніл, тетрагідрофурил, піролідиніл, піразолідиніл, імідазолідиніл, піперидиніл, піперазиніл, морфолініл, діоксоланіл, дитіоланіл та тіазолідиніл.

5 Застосовуваний у даному документі термін "гетероциклілC₁-C₂алкіл" стосується гетероциклільного кільця, приєднаного до решти молекули за допомогою C₁-C₂алкіленового лінкера, визначеного вище.

Застосовуваний у даному документі вираз "спіроциклічне карбобі- або карботрициклільне кільце" означає неароматичну біциклічну кільцеву систему, що містить два кільця, з'єднані
10 разом за допомогою одного атома вуглецю, тобто які мають один сумісний атом вуглецю. Приклади спіроциклічної карбобі- або карботрициклільної кільцевої системи включають без обмеження спіро[3.3]гептаніл, спіро[3.4]октаніл, спіро[4.5]деканіл, спіро[циклобутан-1,2'-інданіл] або спіро[циклопентан-1,2'-тетралініл].

Наявність одного або декількох можливих асиметричних атомів вуглецю в сполуці формули
15 (I) означає, що сполуки можуть зустрічатися в оптично ізомерних формах, тобто енантіомерних або діастереомерних формах. Також можуть зустрічатися атропоізомери в результаті обмеженого обертання навколо одинарного зв'язку. Передбачається, що формула (I) включає всі такі можливі ізомерні форми та їх суміші. Даний винахід включає всі такі можливі ізомерні форми сполуки формули (I) та їх суміші. Аналогічно передбачається, що формула (I) включає
20 всі можливі таутомери. Даний винахід включає всі можливі таутомерні форми для сполуки формули (I).

У кожному разі сполуки формули (I) згідно з даним винаходом знаходяться у вільній формі, в окисненій формі у вигляді N-оксиду або у формі солі, наприклад у формі солі, застосовної у сільському господарстві.

25 N-оксиди являють собою окиснені форми третинних амінів або окиснені форми азотовмісних гетероароматичних сполук. Вони описані, наприклад, у книзі "Heterocyclic N-oxides", A. Albini and S. Pietra, CRC Press, Boca Raton (1991).

У наступному переліку представлені визначення, включаючи переважні визначення, замісників R¹, R², R³, R⁴, X та Y із посиланням на сполуки формули (I). Стосовно будь-якого з
30 цих замісників будь-яке з визначень, наведених нижче, можна комбінувати з будь-яким визначенням будь-якого іншого замісника, наведеним нижче або в інших частинах даного документа.

Y являє собою C-F, C-H або N. В одному варіанті здійснення Y являє собою C-F. В іншому варіанті здійснення Y являє собою C-H. У ще одному варіанті здійснення Y являє собою N.

35 R¹ являє собою водень, C₁-C₆алкіл, C₁-C₆алкокси, C₁-C₆галогеналкіл, C₁-C₆гідроксиалкіл, C₁-C₆алкоксиC₁-C₆алкіл, C₃-C₆циклоалкіл, C₁-C₆алкоксиC₁-C₃алкокси, C₁-C₆алкоксикарбоніл, C₁-C₆алкоксикарбонілC₁-C₄алкіл, C₁-C₆алкоксикарбонілоксиC₁-C₄алкіл, C₁-C₆алкілкарбонілоксиC₁-C₄алкіл, C₂-C₆алкенілокси, C₂-C₆алкінілокси, C₁-C₆алкілсульфаніл, ді(C₁-C₆алкіл)аміно, феніл, фенілC₁-C₃алкіл, фенілC₁-C₃алкоксиC₁-C₃алкіл, фенокси або гетероарил, де гетероарил являє
40 собою 5- або 6-членне ароматичне моноциклічне кільце, що містить 1 або 2 гетероатоми, окремо вибрані з азоту, кисню та сірки.

Переважно R¹ являє собою водень, C₁-C₄алкіл, C₁-C₄алкокси, C₁-C₄галогеналкіл, C₁-C₄гідроксиалкіл, C₁-C₃алкоксиC₁-C₄алкіл, C₃-C₆циклоалкіл, C₁-C₄алкоксиC₁-C₃алкокси, C₁-C₃алкоксикарбоніл, C₁-C₃алкоксикарбонілC₁-C₄алкіл, C₁-C₄алкоксикарбонілоксиC₁-C₃алкіл, C₁-C₄алкілкарбонілоксиC₁-C₃алкіл, C₃-C₅алкінілокси, C₁-C₄алкілсульфаніл, ді(C₁-C₄алкіл)аміно, феніл, фенілC₁-C₃алкіл, фенілC₁-C₃алкоксиC₁-C₃алкіл, фенокси або гетероарил, де гетероарил являє собою 5- або 6-членне ароматичне моноциклічне кільце, що містить 1 або 2 гетероатоми, окремо вибрані з азоту, кисню та сірки.

Більш переважно R¹ являє собою водень, C₁-C₃алкіл, C₁-C₃алкокси, C₁-C₃галогеналкіл, C₁-C₃гідроксиалкіл, метоксиC₁-C₄алкіл, C₃-C₄циклоалкіл, C₁-C₂алкоксиC₁-C₂алкокси, C₁-C₃алкоксикарбоніл, метоксикарбонілC₁-C₃алкіл, C₁-C₂алкоксикарбонілоксиC₁-C₂алкіл, C₁-C₂алкілкарбонілоксиC₁-C₂алкіл, C₃-C₄алкінілокси, C₁-C₃алкілсульфаніл, діетиламіно, феніл, бензил, фенокси, бензилоксиC₁-C₂алкіл або гетероарил, де гетероарил являє собою 5- або 6-членне ароматичне моноциклічне кільце, що містить один гетероатом, вибраний із кисню та
55 сірки.

Ще більш переважно R¹ являє собою водень, метил, етил, метокси, етокси, фторметил, хлорметил, бромметил, 2,2,2-трифторетил, 1-гідроксиетил, метоксиметил, 1-метоксиетил, 1-етоксиметил, 1-метокси-1-метилетил, циклопропіл, метоксиетокси, етоксикарбоніл, 2-метокси-2-оксо-етил, 2-метокси-оксо-етил, 2-метокси-оксо-пропіл, пропаргілокси, 1-метоксикарбонілокси-
60 етил, 1-етоксикарбонілокси-етил, 1-метилкарбонілокси-етил, метилкарбонілоксиметил,

метилсульфаніл, етилсульфаніл, ізопропілсульфаніл, діетиламіно, феніл, бензил, фенокси, бензилоксиметил, 1-бензилоксиетил, 2-фураніл або 2-тіофеніл.

Ще більш переважно R^1 являє собою водень, метил, етил, метокси, етокси, фторметил, 2,2,2-трифторетил, 1-гідроксиетил, 1-етоксиметил, циклопропіл, метоксиетокси, 2-метокси-2-оксо-етил, 2-метокси-оксо-етил, 2-метокси-оксо-пропіл, пропаргілокси, 1-метоксикарбонілокси-етил, 1-етоксикарбонілокси-етил, 1-метилкарбонілокси-етил, метилкарбонілоксиметил, ізопропілсульфаніл, діетиламіно, феніл, бензил, фенокси, бензилоксиметил, 1-бензилоксиетил, 2-фураніл або 2-тіофеніл.

У конкретному наборі варіантів здійснення R^1 являє собою водень, C_1 - C_6 алкіл, C_1 - C_6 алкокси, C_1 - C_6 галогеналкіл, C_1 - C_6 алкокси C_1 - C_6 алкіл, C_3 - C_6 циклоалкіл, C_1 - C_6 алкокси C_1 - C_3 алкокси, C_1 - C_6 алкоксикарбоніл, C_1 - C_6 алкоксикарбоніл C_1 - C_4 алкіл, C_2 - C_6 алкенілокси, C_2 - C_6 алкінілокси, C_1 - C_6 алкілсульфаніл, феніл, фенокси або гетероарил, де гетероарил являє собою 5- або 6-членне ароматичне моноциклічне кільце, що містить 1 або 2 гетероатоми, окремо вибрані з азоту, кисню та сірки.

Переважно R^1 являє собою водень, C_1 - C_4 алкіл, C_1 - C_4 алкокси, C_1 - C_4 галогеналкіл, C_1 - C_3 алкокси C_1 - C_4 алкіл, C_3 - C_6 циклоалкіл, C_1 - C_4 алкокси C_1 - C_3 алкокси, C_1 - C_3 алкоксикарбоніл, C_1 - C_3 алкоксикарбоніл C_1 - C_4 алкіл, C_3 - C_5 алкінілокси, C_1 - C_4 алкілсульфаніл, феніл, фенокси або гетероарил, де гетероарил являє собою 5- або 6-членне ароматичне моноциклічне кільце, що містить 1 або 2 гетероатоми, окремо вибрані з азоту, кисню та сірки.

Більш переважно R^1 являє собою водень, C_1 - C_3 алкіл, C_1 - C_3 алкокси, C_1 - C_3 галогеналкіл, метокси C_1 - C_4 алкіл, C_3 - C_4 циклоалкіл, C_1 - C_2 алкокси C_1 - C_2 алкокси, C_1 - C_3 алкоксикарбоніл, метоксикарбоніл C_1 - C_3 алкіл, C_3 - C_4 алкінілокси, C_1 - C_3 алкілсульфаніл, феніл, фенокси або гетероарил, де гетероарил являє собою 5- або 6-членне ароматичне моноциклічне кільце, що містить один гетероатом, вибраний із кисню та сірки.

Ще більш переважно R^1 являє собою водень, метил, етил, метокси, етокси, фторметил, хлорметил, бромметил, 2,2,2-трифторетил, метоксиметил, 1-метоксиетил, 1-метокси-1-метилетил, циклопропіл, метоксиетокси, етоксикарбоніл, 2-метокси-2-оксо-етил, 2-метокси-оксо-етил, 2-метокси-оксо-пропіл, пропаргілокси, метилсульфаніл, етилсульфаніл, ізопропілсульфаніл, феніл, фенокси, 2-фураніл або 2-тіофеніл.

Ще більш переважно R^1 являє собою водень, метил, етил, метокси, етокси, фторметил, 2,2,2-трифторетил, циклопропіл, метоксиетокси, 2-метокси-2-оксо-етил, 2-метокси-оксо-етил, 2-метокси-оксо-пропіл, пропаргілокси, ізопропілсульфаніл, феніл, фенокси, 2-фураніл або 2-тіофеніл.

R^2 являє собою водень, галоген, ціано, C_1 - C_4 алкіл, C_1 - C_4 алкокси, C_1 - C_4 галогеналкіл або $HC(O)NH$ -. Переважно R^2 являє собою водень, галоген, C_1 - C_3 алкіл, C_1 - C_3 алкокси, C_1 - C_2 галогеналкіл або $HC(O)NH$ -, більш переважно галоген, C_1 - C_2 алкіл, C_1 - C_2 алкокси або $HC(O)NH$ -. Ще більш переважно R^2 являє собою хлор, бром, метил, метокси або $HC(O)NH$ -. Ще більш переважно R^2 являє собою метил або $HC(O)NH$ - та найбільш переважно метил.

R^3 являє собою C_1 - C_8 алкіл, C_1 - C_8 галогеналкіл, C_1 - C_8 алкокси, C_3 - C_8 циклоалкіл, C_3 - C_8 циклоалкіл C_1 - C_2 алкіл (де циклоалкільні групи необов'язково заміщені 1–3 групами, представленими R^4), феніл, феніл C_1 - C_2 алкіл, гетероарил, гетероарил C_1 - C_2 алкіл, де гетероарил являє собою 5- або 6-членне ароматичне моноциклічне кільце, що містить 1, 2, 3 або 4 гетероатоми, окремо вибрані з азоту, кисню та сірки, гетероцикліл, гетероцикліл C_1 - C_2 алкіл, де гетероцикліл являє собою 4-, 5- або 6-членне неароматичне моноциклічне кільце, що містить 1, 2 або 3 гетероатоми, окремо вибрані з азоту, кисню та сірки, або 5-10-членну неароматичну спіроциклічну карбобі- або карботрициклічну кільцеву систему, що необов'язково містить 1, 2, 3, 4 або 5 гетероатомів, окремо вибраних з азоту, кисню та сірки, і де кожна з указаних спіроциклічних карбобі- або карботрициклічних кільцевих систем необов'язково зв'язана з рештою молекули за допомогою C_1 - C_2 алкіленового лінкера.

Переважно R^3 являє собою C_1 - C_6 алкіл, C_1 - C_4 галогеналкіл, C_1 - C_4 алкокси, C_3 - C_6 циклоалкіл, C_3 - C_6 циклоалкіл C_1 - C_2 алкіл (де циклоалкільні групи необов'язково заміщені 1–3 групами, представленими R^4), феніл, гетероарил, гетероарил C_1 - C_2 алкіл, де гетероарил являє собою 5- або 6-членне ароматичне моноциклічне кільце, що містить 1, 2 або 3 гетероатоми, окремо вибрані з азоту, кисню та сірки, гетероцикліл, гетероцикліл C_1 - C_2 алкіл, де гетероцикліл являє собою 4-, 5- або 6-членне неароматичне моноциклічне кільце, що містить 1, 2 або 3 гетероатоми, окремо вибрані з азоту, кисню та сірки, або 5-12-членну неароматичну спіроциклічну карбобі- або карботрициклічну кільцеву систему, що необов'язково містить 1, 2 або 3 гетероатоми, окремо вибрані з азоту, кисню та сірки, і де кожна з указаних спіроциклічних карбобі- або карботрициклічних кільцевих систем необов'язково зв'язана з рештою молекули за допомогою C_1 - C_2 алкіленового лінкера.

Більш переважно R^3 являє собою C_1 - C_4 алкіл, C_1 - C_3 алкокси, C_3 - C_6 циклоалкіл, C_3 - C_6 циклоалкіл C_1 - C_2 алкіл (де циклоалкільні групи необов'язково заміщені 1–3 групами, представленими R^4), феніл, гетероарил, де гетероарил являє собою 5- або 6-членне ароматичне моноциклічне кільце, що містить 1, 2 або 3 гетероатоми, окремо вибрані з азоту, кисню та сірки, гетероцикліл, де гетероцикліл являє собою 4-, 5- або 6-членне неароматичне моноциклічне кільце, що містить 1, 2 або 3 гетероатоми, окремо вибрані з азоту, кисню та сірки, або 5-12-членну неароматичну спіроциклічну карбобі- або карботрициклічну кільцеву систему, що необов'язково містить один гетероатом, вибраний з азоту, кисню та сірки.

Ще більш переважно R^3 являє собою C_3 - C_6 циклоалкіл, де циклоалкільні групи необов'язково заміщені 1 або 2 групами, представленими R^4 , або R^3 являє собою 6-10-членну неароматичну спіроциклічну карбобіциклічну кільцеву систему.

Ще більш переважно R^3 являє собою C_3 - C_4 циклоалкіл, де циклоалкільні групи необов'язково заміщені 1 або 2 групами, представленими R^4 , або R^3 являє собою 6-8-членну неароматичну спіроциклічну карбобіциклічну кільцеву систему.

Ще більш переважно R^3 являє собою циклобутил, 2,2-диметилциклобутил або спіро[3.4]октаніл і найбільш переважно циклобутил, 2,2-диметилциклобутил або спіро[3.4]октан-3-іл.

R^4 являє собою галоген, C_1 - C_4 алкіл, C_1 - C_4 алкокси або C_1 - C_4 галогеналкіл. Переважно R^4 являє собою галоген, C_1 - C_3 алкіл, C_1 - C_3 алкокси, C_1 - C_2 галогеналкіл, більш переважно галоген, C_1 - C_3 алкіл, C_1 - C_3 алкокси або C_1 - C_3 галогеналкіл. Ще більш переважно R^4 являє собою C_1 - C_3 алкіл, ще більш переважно метил, етил або ізопропіл, і найбільш переважно R^4 являє собою метил.

X являє собою N або $C-H$. В одному варіанті здійснення X являє собою N . В іншому варіанті здійснення X являє собою $C-H$.

У сполучі формули (I) за даним винаходом переважно

R^1 являє собою водень, C_1 - C_6 алкіл, C_1 - C_6 алкокси, C_1 - C_6 галогеналкіл, C_1 - C_6 гідроксиалкіл, C_1 - C_6 алкокси C_1 - C_6 алкіл, C_3 - C_6 циклоалкіл, C_1 - C_6 алкокси C_1 - C_3 алкокси, C_1 - C_6 алкоксикарбоніл, C_1 - C_6 алкоксикарбоніл C_1 - C_4 алкіл, C_1 - C_6 алкоксикарбонілокси C_1 - C_4 алкіл, C_1 - C_6 алкілкарбонілокси C_1 - C_4 алкіл, C_2 - C_6 алкенілокси, C_2 - C_6 алкінілокси, C_1 - C_6 алкілсульфаніл, ді(C_1 - C_6 алкіл)аміно, феніл, феніл C_1 - C_3 алкіл, феніл C_1 - C_3 алкокси C_1 - C_3 алкіл, фенокси або гетероарил, де гетероарил являє собою 5- або 6-членне ароматичне моноциклічне кільце, що містить 1 або 2 гетероатоми, окремо вибрані з азоту, кисню та сірки;

R^2 являє собою метил;

R^3 являє собою C_1 - C_8 алкіл, C_1 - C_8 галогеналкіл, C_1 - C_8 алкокси, C_3 - C_8 циклоалкіл, C_3 - C_8 циклоалкіл C_1 - C_2 алкіл (де циклоалкільні групи необов'язково заміщені 1–3 групами, представленими R^4), феніл, феніл C_1 - C_2 алкіл, гетероарил, гетероарил C_1 - C_2 алкіл, де гетероарил являє собою 5- або 6-членне ароматичне моноциклічне кільце, що містить 1, 2, 3 або 4 гетероатоми, окремо вибрані з азоту, кисню та сірки, гетероцикліл, гетероцикліл C_1 - C_2 алкіл, де гетероцикліл являє собою 4-, 5- або 6-членне неароматичне моноциклічне кільце, що містить 1, 2 або 3 гетероатоми, окремо вибрані з азоту, кисню та сірки, або 5-10-членну неароматичну спіроциклічну карбобі- або карботрициклічну кільцеву систему, що необов'язково містить 1, 2, 3, 4 або 5 гетероатомів, окремо вибраних з азоту, кисню та сірки, і де кожна з указаних спіроциклічних карбобі- або карботрициклічних кільцевих систем необов'язково зв'язана з рештою молекули за допомогою C_1 - C_2 алкіленового лінкера;

R^4 являє собою галоген, C_1 - C_4 алкіл, C_1 - C_4 алкокси або C_1 - C_4 галогеналкіл;

X являє собою $C-N$; та

Y являє собою $C-F$.

Більш переважно R^1 являє собою водень, C_1 - C_6 алкіл, C_1 - C_6 алкокси, C_1 - C_6 галогеналкіл, C_1 - C_6 гідроксиалкіл, C_1 - C_6 алкокси C_1 - C_6 алкіл, C_3 - C_6 циклоалкіл, C_1 - C_6 алкокси C_1 - C_3 алкокси, C_1 - C_6 алкоксикарбоніл, C_1 - C_6 алкоксикарбоніл C_1 - C_4 алкіл, C_1 - C_6 алкоксикарбонілокси C_1 - C_4 алкіл, C_1 - C_6 алкілкарбонілокси C_1 - C_4 алкіл, C_2 - C_6 алкінілокси, C_1 - C_6 алкілсульфаніл, ді(C_1 - C_6 алкіл)аміно, феніл, феніл C_1 - C_3 алкіл, феніл C_1 - C_3 алкокси C_1 - C_3 алкіл, фенокси або гетероарил, де гетероарил являє собою 5- або 6-членне ароматичне моноциклічне кільце, що містить 1 або 2 гетероатоми, окремо вибрані з азоту, кисню та сірки;

R^2 являє собою метил;

R^3 являє собою C_3 - C_8 циклоалкіл, де циклоалкільні групи необов'язково заміщені 1–3 групами, представленими R^4 , або R^3 являє собою 5-10-членну неароматичну спіроциклічну карбобіциклічну кільцеву систему, що необов'язково містить 1, 2, 3, 4 або 5 гетероатомів, окремо вибрані з азоту, кисню та сірки, і де кожна з указаних спіроциклічних карбобі- або карботрициклічних кільцевих систем необов'язково зв'язана з рештою молекули за допомогою

C₁-C₂алкіленового лінкера;

X являє собою N; та

Y являє собою C-F.

Ще більш переважно R¹ являє собою водень, C₁-C₃алкіл, C₁-C₃алкокси, C₁-C₃галогеналкіл, C₁-C₃гідроксиалкіл, метоксиC₁-C₄алкіл, C₃-C₄циклоалкіл, C₁-C₂алкоксиC₁-C₂алкокси, C₁-C₃алкоксикарбоніл, метоксикарбонілC₁-C₃алкіл, C₁-C₂алкоксикарбонілоксиC₁-C₂алкіл, C₁-C₂алкілкарбонілоксиC₁-C₂алкіл, C₃-C₄алкінілокси, C₁-C₃алкілсульфаніл, діетиламіно, феніл, бензил, фенокси, бензилоксиC₁-C₂алкіл або гетероарил, де гетероарил являє собою 5- або 6-членне ароматичне моноциклічне кільце, що містить один гетероатом, вибраний із кисню та сірки;

R² являє собою метил;

R³ являє собою циклобутил, 2,2-диметилциклобутил або спіро[3.4]октан-3-іл;

X являє собою N; та

Y являє собою C-F.

Ще більш переважно R¹ являє собою водень, метил, етил, метокси, етокси, фторметил, хлорметил, бромметил, 2,2,2-трифторетил, 1-гідроксиетил, метоксиметил, 1-метоксиетил, 1-етоксиметил, 1-метокси-1-метилетил, циклопропіл, метоксиетокси, етоксикарбоніл, 2-метокси-2-оксо-етил, 2-метокси-оксо-етил, 2-метокси-оксо-пропіл, пропаргілокси, 1-метоксикарбонілокси-етил, 1-етоксикарбонілокси-етил, 1-метилкарбонілокси-етил, метилкарбонілокси-метил, метилсульфаніл, етилсульфаніл, ізопропілсульфаніл, діетиламіно, феніл, бензил, фенокси, бензилоксиметил, 1-бензилоксиетил, 2-фураніл або 2-тіофеніл;

R² являє собою метил;

R³ являє собою циклобутил, 2,2-диметилциклобутил або спіро[3.4]октан-3-іл;

X являє собою N; та

Y являє собою C-F.

У конкретному наборі варіантів здійснення у сполучі формули (I) за даним винаходом переважно

R¹ являє собою водень, C₁-C₆алкіл, C₁-C₆алкокси, C₁-C₆галогеналкіл, C₁-C₆алкоксиC₁-C₆алкіл, C₃-C₆циклоалкіл, C₁-C₆алкоксиC₁-C₃алкокси, C₁-C₆алкоксикарбоніл, C₁-C₆алкоксикарбонілC₁-C₄алкіл, C₂-C₆алкінілокси, C₂-C₆алкінілокси, C₁-C₆алкілсульфаніл, феніл, фенокси або гетероарил, де гетероарил являє собою 5- або 6-членне ароматичне моноциклічне кільце, що містить 1 або 2 гетероатоми, окремо вибрані з азоту, кисню та сірки;

R² являє собою метил;

R³ являє собою C₁-C₈алкіл, C₁-C₈галогеналкіл, C₁-C₈алкокси, C₃-C₈циклоалкіл, C₃-C₈циклоалкілC₁-C₂алкіл (де циклоалкільні групи необов'язково заміщені 1–3 групами, представленими R⁴), феніл, фенілC₁-C₂алкіл, гетероарил, гетероарилC₁-C₂алкіл, де гетероарил являє собою 5- або 6-членне ароматичне моноциклічне кільце, що містить 1, 2, 3 або 4 гетероатоми, окремо вибрані з азоту, кисню та сірки, гетероцикліл, гетероциклілC₁-C₂алкіл, де гетероцикліл являє собою 4-, 5- або 6-членне неароматичне моноциклічне кільце, що містить 1, 2 або 3 гетероатоми, окремо вибрані з азоту, кисню та сірки, або 5-10-членну неароматичну спіроциклічну карбобі- або карботрициклічну кільцеву систему, що необов'язково містить 1, 2, 3, 4 або 5 гетероатомів, окремо вибраних з азоту, кисню та сірки, і де кожна з указаних спіроциклічних карбобі- або карботрициклічних кільцевих систем необов'язково зв'язана з рештою молекули за допомогою C₁-C₂алкіленового лінкера;

R⁴ являє собою галоген, C₁-C₄алкіл, C₁-C₄алкокси або C₁-C₄галогеналкіл;

X являє собою C N; та

Y являє собою C-F.

Більш переважно R¹ являє собою водень, C₁-C₆алкіл, C₁-C₆алкокси, C₁-C₆галогеналкіл, C₁-C₆алкоксиC₁-C₆алкіл, C₃-C₆циклоалкіл, C₁-C₆алкоксиC₁-C₃алкокси, C₁-C₆алкоксикарбоніл, C₁-C₆алкоксикарбонілC₁-C₄алкіл, C₂-C₆алкінілокси, C₁-C₆алкілсульфаніл, феніл, фенокси або гетероарил, де гетероарил являє собою 5- або 6-членне ароматичне моноциклічне кільце, що містить 1 або 2 гетероатоми, окремо вибрані з азоту, кисню та сірки;

R² являє собою метил;

R³ являє собою C₃-C₈циклоалкіл, де циклоалкільні групи необов'язково заміщені 1–3 групами, представленими R⁴, або R³ являє собою 5-10-членну неароматичну спіроциклічну карбобіциклічну кільцеву систему, що необов'язково містить 1, 2, 3, 4 або 5 гетероатомів, окремо вибраних з азоту, кисню та сірки, і де кожна з указаних спіроциклічних карбобі- або карботрициклічних кільцевих систем необов'язково зв'язана з рештою молекули за допомогою C₁-C₂алкіленового лінкера;

X являє собою N; та

Y являє собою C-F.

Ще більш переважно R¹ являє собою водень, C₁-C₃алкіл, C₁-C₃алкокси, C₁-C₃галогеналкіл, метоксиC₁-C₄алкіл, C₃-C₄циклоалкіл, C₁-C₂алкоксиC₁-C₂алкокси, C₁-C₃алкоксикарбоніл, метоксикарбонілC₁-C₃алкіл, C₃-C₄алкінілокси, C₁-C₃алкілсульфаніл, феніл, фенокси, гетероарил, де гетероарил являє собою 5- або 6-членне ароматичне моноциклічне кільце, що містить один гетероатом, вибраний із кисню та сірки;

R² являє собою метил;

R³ являє собою циклобутил, 2,2-диметилциклобутил або спіро[3.4]октан-3-іл;

X являє собою N; та

Y являє собою C-F.

Ще більш переважно R¹ являє собою водень, метил, етил, метокси, етокси, фторметил, хлорметил, бромметил, 2,2,2-трифторетил, метоксиметил, 1-метоксиетил, 1-метокси-1-метилетил, циклопропіл, метоксиетокси, етоксикарбоніл, 2-метокси-2-оксо-етил, 2-метокси-оксо-етил, 2-метокси-оксо-пропіл, пропаргілокси, метилсульфаніл, етилсульфаніл, ізопропілсульфаніл, феніл, фенокси, 2-фураніл або 2-тіофеніл;

R² являє собою метил;

R³ являє собою циклобутил, 2,2-диметилциклобутил або спіро[3.4]октан-3-іл;

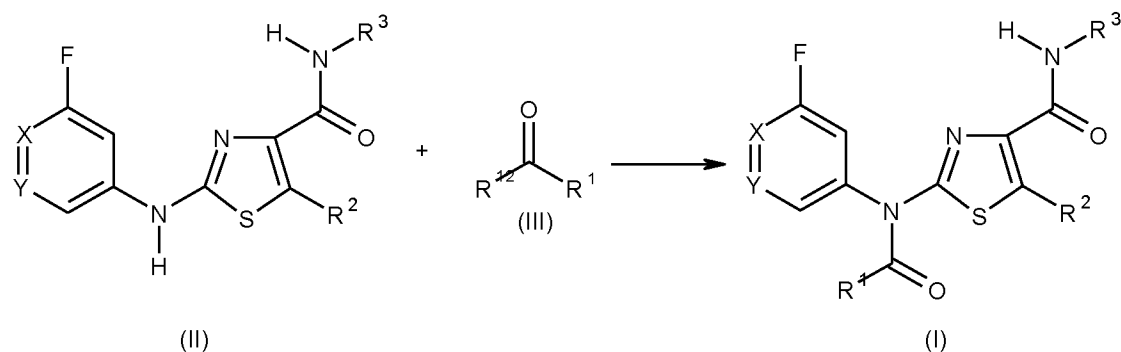
X являє собою N; та

Y являє собою C-F.

Сполуки за даним винаходом можуть бути одержані, як показано на наступних схемах, де, якщо не вказано інше, визначення кожної змінної є таким, як визначено вище для сполуки формули (I).

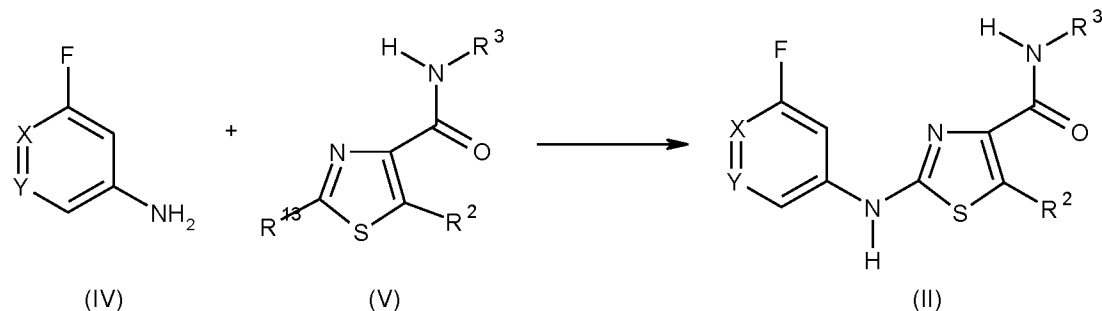
Сполуки формули (I) згідно з даним винаходом, де R¹, R², R³, X та Y є такими, як визначено для формули (I), можна одержувати шляхом перетворення сполуки формули (II), де R², R³, X та Y є такими, як визначено для формули (I), за допомогою сполуки формули (III), де R¹ є таким, як визначено для формули (I), та R¹² являє собою галоген, переважно хлор, або шляхом термічного нагрівання, або за допомогою основи. Це показано на схемі 1 нижче.

Схема 1



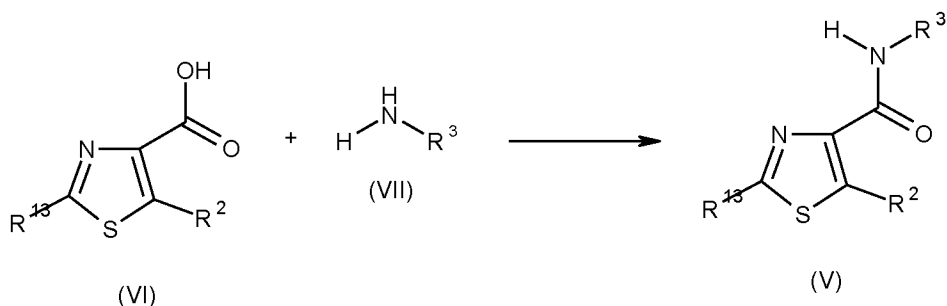
Сполуки формули (II), де R², R³, X та Y є такими, як визначено для формули (I), можна одержувати шляхом перетворення сполуки формули (IV), де X та Y є такими, як визначено для формули (I), за допомогою сполуки формули (V), де R² та R³ є такими, як визначено для формули (I), та R¹³ являє собою галоген, переважно бром, або шляхом термічного нагрівання, або за допомогою основи, або за умов каталізованого перехідним металом амінування за Бухвальдом-Хартвігом. Це показано на схемі 2 нижче.

Схема 2



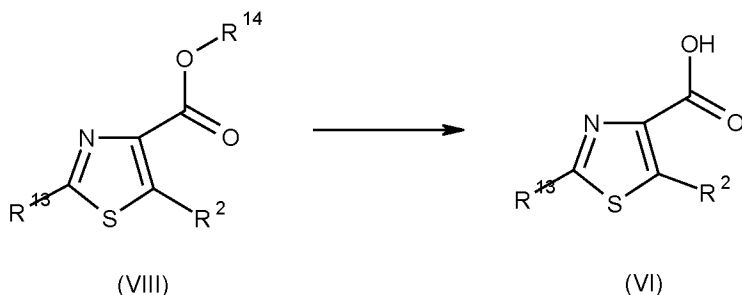
Сполуки формули (V), де R^2 та R^3 є такими, як визначено для формули (I), та R^{13} являє собою галоген, переважно бром, можна одержувати шляхом перетворення сполуки формули (VI), де R^2 є таким, як визначено для формули (I), та R^{13} являє собою галоген, переважно бром, та сполуки формули (VII), де R^3 є таким, як визначено для формули (I), або шляхом застосування проміжного хлорангідриду, або безпосередньо за допомогою пептидного засобу, що бере участь у реакції сполучення. Це показано на схемі 3 нижче.

Схема 3



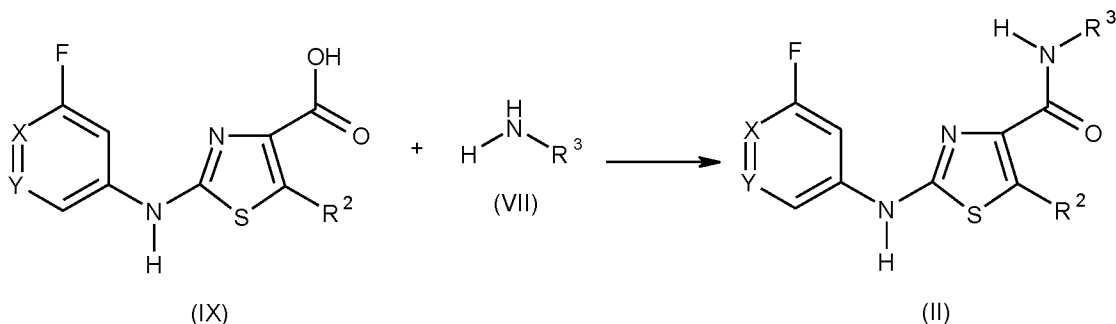
Сполуки формули (VI), де R^2 є таким, як визначено для формули (I), та R^{13} являє собою галоген, переважно бром, можна одержувати шляхом перетворення сполуки формули (VIII), де R^2 є таким, як визначено для формули (I), R^{13} являє собою галоген, переважно бром, та R^{14} являє собою C_1 - C_6 алкіл, та основи. Це показано на схемі 4 нижче.

Схема 4



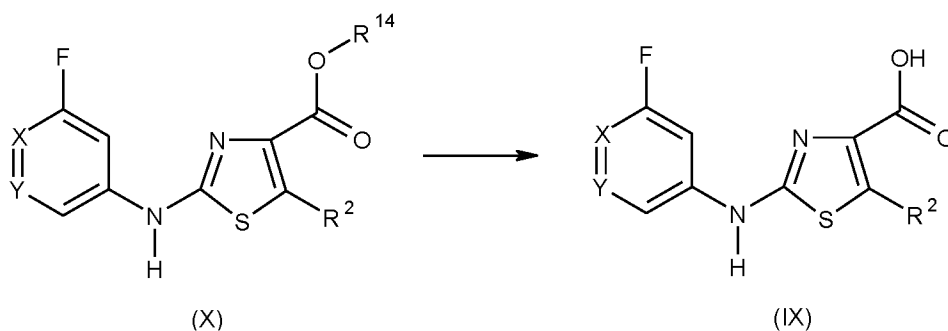
Альтернативно сполуки формули (II), де R^2 , R^3 , X та Y є такими, як визначено для формули (I), можна одержувати шляхом перетворення сполуки формули (IX), де R^2 , X та Y є такими, як визначено для формули (I), за допомогою сполуки формули (VII), де R^3 є таким, як визначено для формули (I), або шляхом застосування проміжного хлорангідриду, або безпосередньо за допомогою пептидного засобу, що бере участь у реакції сполучення. Це показано на схемі 5 нижче.

Схема 5



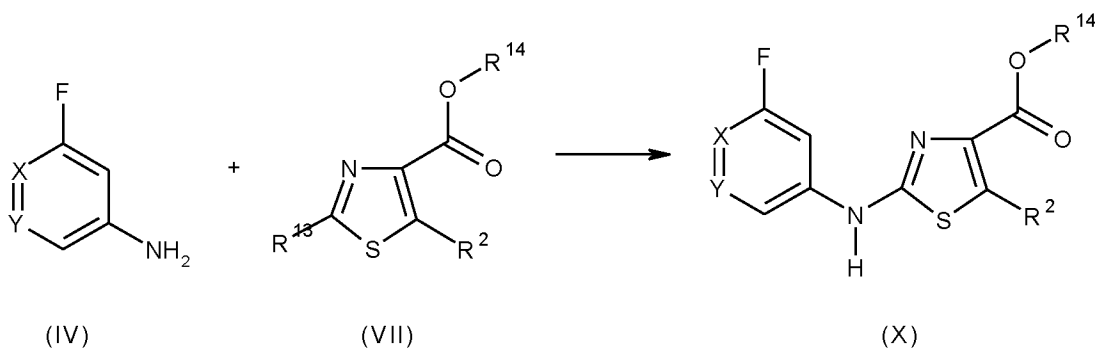
Сполуки формули (IX), де R^2 , X та Y є такими, як визначено для формули (I), можна одержувати шляхом перетворення сполуки формули (X), де R^2 , X та Y є такими, як визначено для формули (I), та R^{14} являє собою C_1 - C_6 алкіл, за допомогою основи. Це показано на схемі 6 нижче.

Схема 6



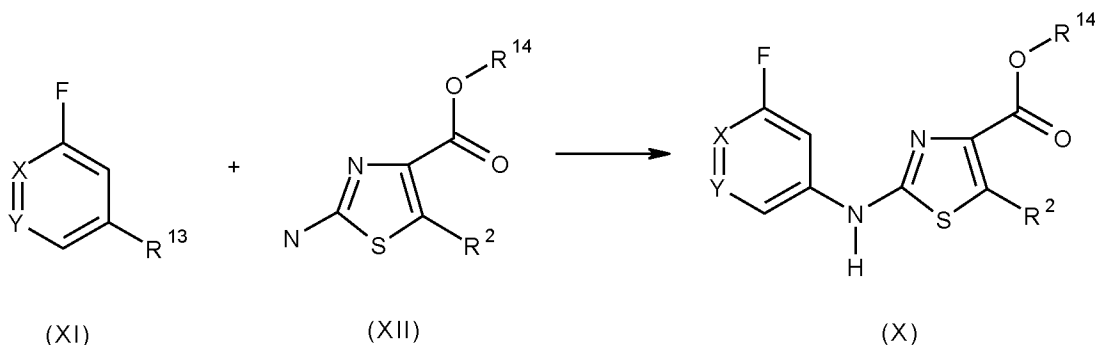
Сполуки формули (X), де R^2 , X та Y є такими, як визначено для формули (I) та R^{14} являє собою C_1 - C_6 алкіл, можна одержувати шляхом перетворення сполуки формули (IV), де X та Y є такими, як визначено для формули (I), за допомогою сполуки формули (VII), де R^2 є таким, як визначено для формули (I), R^{12} являє собою галоген, переважно бром, та R^{13} являє собою C_1 - C_6 алкіл, або шляхом термічного нагрівання, або за допомогою основи, або за умов каталізованого перехідним металом амінування за Бухвальдом-Хартвігом. Це показано на схемі 7 нижче.

Схема 7



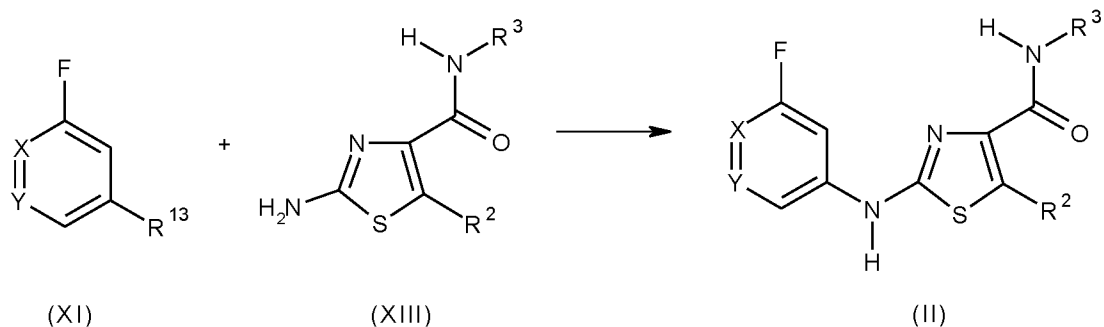
Альтернативно сполуки формули (X), де R^2 , X та Y є такими, як визначено для формули (I), та R^{14} являє собою C_1 - C_6 алкіл, можна одержувати шляхом перетворення сполуки формули (XI), де X та Y є такими, як визначено для формули (I), та R^{13} являє собою галоген, переважно бром або йод, за допомогою сполуки формули (XII), де R^2 є таким, як визначено для формули (I), та R^{14} являє собою C_1 - C_6 алкіл, за умов каталізованого перехідним металом амінування за Бухвальдом-Хартвігом. Це показано на схемі 8 нижче.

Схема 8



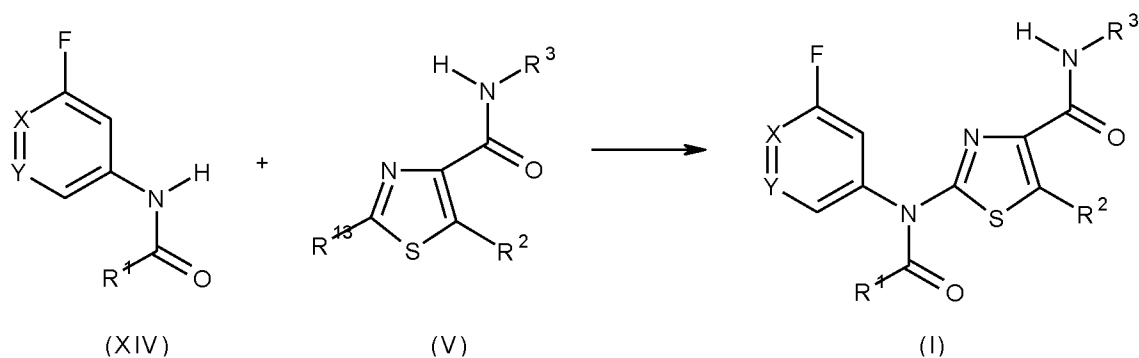
Альтернативно сполуки формули (II), де R^2 , R^3 , X та Y є такими, як визначено для формули (I), можна одержувати шляхом перетворення сполуки формули (XI), де X та Y є такими, як визначено для формули (I), та R^{13} являє собою галоген, переважно бром або йод, за допомогою сполуки формули (XIII), де R^2 та R^3 є такими, як визначено для формули (I), або шляхом термічного нагрівання, або за допомогою основи, або за умов каталізованого перехідним металом амінування за Бухвальдом-Хартвігом. Це показано на схемі 9 нижче.

Схема 9



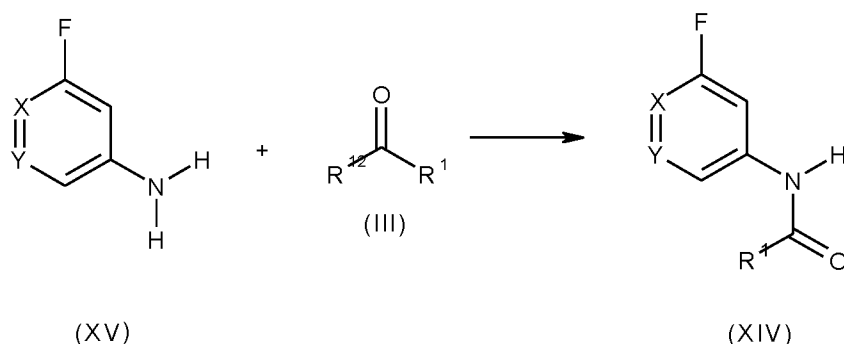
Альтернативно сполуки формули (I) згідно з даним винаходом, де R^1 , R^2 , R^3 , X та Y є такими, як визначено для формули (I), можна одержувати шляхом перетворення сполуки формули (V), де R^2 та R^3 , є такими, як визначено для формули (I), та R^{13} являє собою галоген, переважно бром, за допомогою сполуки формули (XIV), де R^1 , X та Y є такими, як визначено для формули (I), або шляхом термічного нагрівання, або за допомогою основи, або за умов каталізованого перехідним металом амінування за Бухвальдом-Хартвігом. Це показано на схемі 10 нижче.

Схема 10



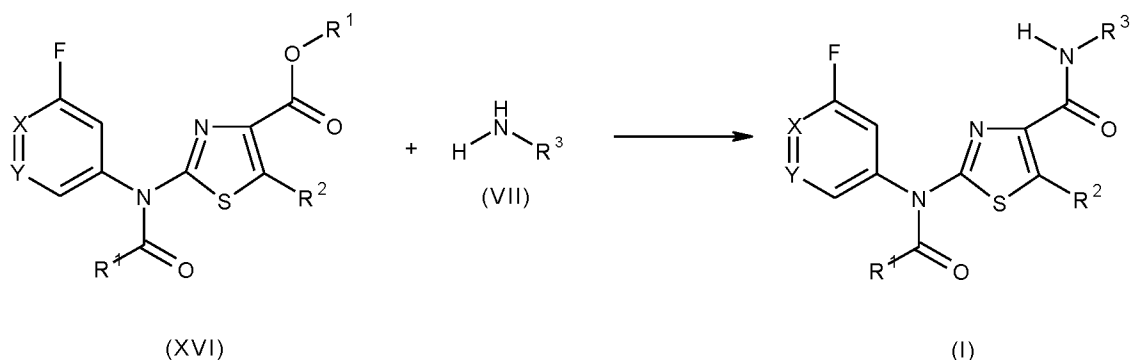
Сполуки формули (XIV), де R^1 , X та Y є такими, як визначено для формули (I), можна одержувати шляхом перетворення сполуки формули (XV), де X та Y є такими, як визначено для формули (I), за допомогою сполуки формули (III), де R^1 є таким, як визначено для формули (I), та R^{12} являє собою галоген, переважно хлор, або шляхом термічного нагрівання, або за допомогою основи. Це показано на схемі 11 нижче.

Схема 11



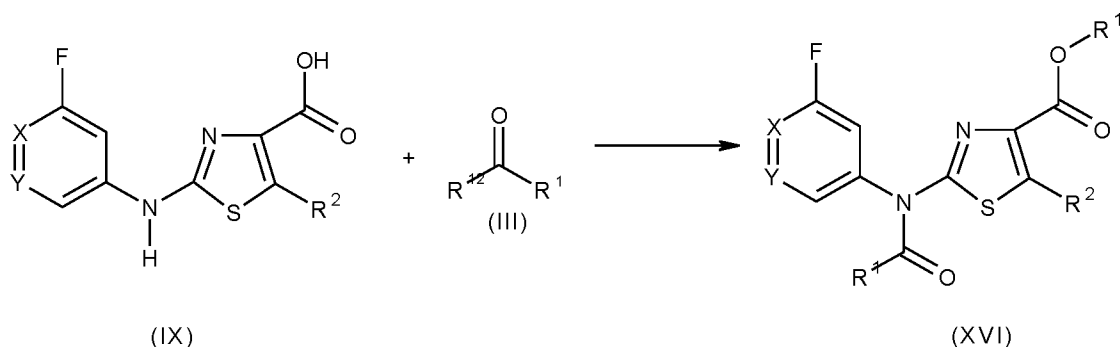
Альтернативно сполуки формули (I), де R^1 , R^2 , R^3 , X та Y є такими, як визначено для формули (I), можна одержувати шляхом перетворення сполуки формули (XVI), де R^1 , R^2 , X та Y є такими, як визначено для формули (I), за допомогою сполуки формули (VII), де R^3 є таким, як визначено для формули (I), або шляхом термічного нагрівання, або за допомогою основи. Це показано на схемі 12 нижче.

Схема 12



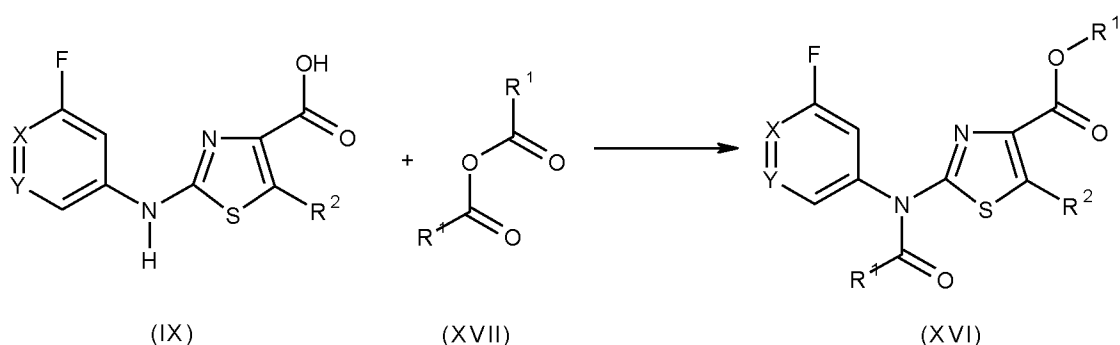
Сполуки формули (XVI), де R^1 , R^2 , X та Y є такими, як визначено для формули (I), можна одержувати шляхом перетворення сполуки формули (IX), де R^2 , X та Y є такими, як визначено для формули (I), за допомогою сполуки формули (III), де R^1 є таким, як визначено для формули (I), та R^{12} являє собою галоген, переважно хлор, або шляхом термічного нагрівання, або за допомогою основи. Це показано на схемі 13 нижче.

Схема 13



Альтернативно сполуки формули (XVI), де R^1 , R^2 , X та Y є такими, як визначено для формули (I), можна одержувати шляхом перетворення сполуки формули (IX), де R^2 , X та Y є такими, як визначено для формули (I), за допомогою сполуки формули (XVII), де R^1 є таким, як визначено для формули (I), або шляхом термічного нагрівання, або за допомогою основи. Це показано на схемі 14 нижче.

Схема 14



Несподівано на сьогодні було виявлено, що нові сполуки формули (I) характеризуються для практичних цілей дуже ефективним рівнем біологічної активності для захисту рослин від захворювань, спричинених грибами.

Сполуки формули (I) можна застосовувати в сільському господарстві та пов'язаних із ним галузях застосування, наприклад, як активні інгредієнти для контролю шкідників рослин або на неживих матеріалах для контролю мікроорганізмів, що спричиняють псування, або організмів, потенційно шкідливих для людини. Нові сполуки відрізняються відмінною активністю за низьких норм застосування, при цьому вони добре переносяться рослинами та є безпечними для навколишнього середовища. Вони характеризуються дуже корисними лікувальними, профілактичними і системними властивостями, та їх можна застосовувати для захисту

численних культивованих рослин. Сполуки формули (I) можна застосовувати для пригнічення або знищення шкідників, які зустрічаються на рослинах або частинах рослин (плодах, квітках, листках, стеблах, бульбах, коренях) різних сільськогосподарських культур корисних рослин, а також захищаючи водночас ті частини рослин, які виростають пізніше, наприклад, від фітопатогенних мікроорганізмів.

Даний винахід додатково стосується способу контролю або попередження зараження рослин або матеріалу для розмноження рослин та/або зібраних продовольчих сільськогосподарських культур, сприйнятливих до зараження мікроорганізмами, шляхом обробки рослин або матеріалу для розмноження рослин та/або зібраних продовольчих сільськогосподарських культур, де ефективну кількість сполуки формули (I) застосовують щодо рослин, їхніх частин або їхнього місця зростання.

Також сполуки формули (I) можна застосовувати як фунгіцид. Застосовуваний у даному документі термін "фунгіцид" означає сполуку, за допомогою якої контролюють, модифікують або попереджують ріст грибів. Термін "фунгіцидно ефективна кількість" означає кількість такої сполуки або комбінації таких сполук, що здатна впливати на ріст грибів. Ефекти контролю або модифікації включають усі відхилення від природного розвитку, такі як знищення, гальмування розвитку тощо, а попередження включає бар'єр або інше захисне утворення в рослині або на ній для попередження грибкової інфекції.

Також сполуки формули (I) можна застосовувати як засоби для протравлювання з метою обробки матеріалу для розмноження рослин, наприклад насінини, наприклад плодів, бульб або зерен або паростків рослини (наприклад, рису) для захисту від грибкових інфекцій, а також від фітопатогенних грибів, що зустрічаються в ґрунті. Матеріал для розмноження можна обробляти композицією, що містить сполуку формули (I), перед висадженням: насінину, наприклад, можна протравити перед висіванням.

Активні інгредієнти згідно з даним винаходом також можна застосовувати щодо зерен (нанесення покриття) або шляхом просочування насіння у рідкому складі, або шляхом покривання їх твердим складом. Композицію також можна застосовувати щодо місця посадки під час садження матеріалу для розмноження, наприклад щодо борозни для насіння під час висівання. Даний винахід також стосується таких способів обробки матеріалу для розмноження рослин та обробленого у такий спосіб матеріалу для розмноження рослин.

Додатково сполуки згідно з даним винаходом можна застосовувати для контролю грибів у суміжних галузях, наприклад, у галузі захисту технічних матеріалів, включаючи дерев'яні та пов'язані з деревом технічні продукти, у галузі зберігання продуктів харчування, у галузі організації санітарної обробки.

Крім того, даний винахід можна застосовувати для захисту неживих матеріалів від ураження грибами, наприклад пиломатеріалів, личкувальних плит і фарби.

Сполуки формули (I) можуть бути, наприклад, ефективними щодо грибів і збудників захворювань, що належать до грибів, а також щодо фітопатогенних бактерій і вірусів. Ці гриби і збудники захворювань, що належать до грибів, а також фітопатогенні бактерії та віруси являють собою, наприклад:

Absidia corymbifera, *Alternaria* spp, *Aphanomyces* spp, *Ascochyta* spp, *Aspergillus* spp., у тому числі *A. flavus*, *A. fumigatus*, *A. nidulans*, *A. niger*, *A. terreus*, *Aureobasidium* spp., у тому числі *A. pullulans*, *Blastomyces dermatitidis*, *Blumeria graminis*, *Bremia lactucae*, *Botryosphaeria* spp., у тому числі *B. dothidea*, *B. obtusa*, *Botrytis* spp., у тому числі *B. cinerea*, *Candida* spp., у тому числі *C. albicans*, *C. glabrata*, *C. krusei*, *C. lusitanae*, *C. parapsilosis*, *C. tropicalis*, *Cephalosporium* spp, *Ceratocystis* spp, *Cercospora* spp., у тому числі *C. arachidicola*, *Cercosporidium personatum*, *Cladosporium* spp, *Claviceps purpurea*, *Coccidioides immitis*, *Cochliobolus* spp, *Colletotrichum* spp., у тому числі *C. musae*, *Cryptococcus neoformans*, *Diaporthe* spp, *Didymella* spp, *Drechslera* spp, *Elsinoe* spp, *Epidermophyton* spp, *Erwinia amylovora*, *Erysiphe* spp., у тому числі *E. cichoracearum*, *Eutypa lata*, *Fusarium* spp., у тому числі *F. culmorum*, *F. graminearum*, *F. langsethiae*, *F. moniliforme*, *F. oxysporum*, *F. proliferatum*, *F. subglutinans*, *F. solani*, *Gaeumannomyces graminis*, *Gibberella fujikuroi*, *Gloeodes pomigena*, *Gloeosporium musarum*, *Glomerella cingulate*, *Guignardia bidwellii*, *Gymnosporangium juniperi-virginianae*, *Helminthosporium* spp, *Hemileia* spp, *Histoplasma* spp., у тому числі *H. capsulatum*, *Laetisaria fuciformis*, *Leptographium lindbergii*, *Leveillula taurica*, *Lophodermium seeditiosum*, *Microdochium nivale*, *Microsporium* spp, *Monilinia* spp, *Mucor* spp, *Mycosphaerella* spp., у тому числі *M. graminicola*, *M. pomi*, *Oncobasidium theobromaeon*, *Ophiostoma piceae*, *Paracoccidioides* spp, *Penicillium* spp., у тому числі *P. digitatum*, *P. italicum*, *Petriellidium* spp, *Peronosclerospora* spp., у тому числі *P. maydis*, *P. philippinensis* та *P. sorghi*, *Peronospora* spp, *Phaeosphaeria nodorum*, *Phakopsora pachyrhizi*, *Phellinus igniarius*, *Phialophora* spp, *Phoma* spp, *Phomopsis viticola*, *Phytophthora* spp., у тому числі *P. infestans*, *Plasmopara* spp.,

у тому числі *P. halstedii*, *P. viticola*, *Pleospora* spp., *Podosphaera* spp., у тому числі *P. leucotricha*, *Polymyxa graminis*, *Polymyxa betae*, *Pseudocercospora herpotrichoides*, *Pseudomonas* spp, *Pseudoperonospora* spp., у тому числі *P. cubensis*, *P. humuli*, *Pseudopeziza tracheiphila*, *Puccinia* spp., у тому числі *P. hordei*, *P. recondita*, *P. striiformis*, *P. tritici*, *Pyrenopeziza* spp, *Pyrenophora* spp, *Pyricularia* spp., у тому числі *P. oryzae*, *Pythium* spp., у тому числі *P. ultimum*, *Ramularia* spp, *Rhizoctonia* spp, *Rhizomucor pusillus*, *Rhizopus arrhizus*, *Rhynchosporium* spp, *Scedosporium* spp., у тому числі *S. apiospermum* та *S. prolificans*, *Schizothyrium pomi*,

Sclerotinia spp, *Sclerotium* spp, *Septoria* spp, у тому числі *S. nodorum*, *S. tritici*, *Sphaerotheca macularis*, *Sphaerotheca fusca* (*Sphaerotheca fuliginea*), *Sporothrix* spp, *Stagonospora nodorum*, *Stemphylium* spp., *Stereum hirsutum*, *Thanatephorus cucumeris*, *Thielaviopsis basicola*, *Tilletia* spp, *Trichoderma* spp., у тому числі *T. harzianum*, *T. pseudokoningii*, *T. viride*, *Trichophyton* spp, *Typhula* spp, *Uncinula necator*, *Urocystis* spp, *Ustilago* spp, *Venturia* spp., у тому числі *V. inaequalis*, *Verticillium* spp та *Xanthomonas* spp.

В обсязі даного винаходу цільові сільськогосподарські культури та/або корисні рослини, що підлягають захисту, зазвичай включають багаторічні й однорічні сільськогосподарські культури, такі як ягідні рослини, наприклад різновиди ожини, чорниці, журавлини, малини та полуниці; зернові, наприклад ячмінь, маїс (кукурудза), просо, різновиди вівса, рис, жито, сорго, тритикале та пшениця; волокнисті рослини, наприклад бавовник, льон, коноплі, джут та сизаль; польові сільськогосподарські культури, наприклад цукровий і кормовий буряк, кавове дерево, різновиди хмелю, гірчиця, олійний ріпак (канола), мак, цукрова тростина, соняшник, чайний кущ і тютюн; фруктові дерева, наприклад яблуня, абрикос, авокадо, банан, вишня, цитрус, нектарин, персик, груша та слива; злакові трави, наприклад бермудська трава, тонконіг, мітлиця, еремохля змієхвоста, костриця, пажитниця, августинова трава та цойсія японська; ароматичні трави, такі як базилік, бурачник, шніт-цибуля, коріандр, лаванда, любисток, м'ята, орегано, петрушка, розмарин, шавлія та чебрець; бобові, наприклад різновиди квасолі, сочевиці, гороху та сої; горіхи, наприклад мигдаль, кеш'ю, земляний горіх, ліщина, арахіс, пекан, фісташкове дерево та волоський горіх; пальми, наприклад олійна пальма; декоративні рослини, наприклад квіти, чагарники та дерева; інші дерева, наприклад какао-дерево, кокосова пальма, оливкове дерево та каучукове дерево; овочі, наприклад спаржа, баклажан, броколі, капуста, морква, огірок, часник, салат-латук, кабачок, диня, окра, цибуля ріпчаста, перець, картопля, гарбуз, ревінь, шпинат і томат; а також виноградні, наприклад різновиди винограду.

Термін "корисні рослини" слід розуміти як такий, що включає також корисні рослини, яким була надана толерантність до гербіцидів, таких як бромексиніл, або класів гербіцидів (таких як, наприклад, інгібітори HPPD, інгібітори ALS, наприклад примісульфурон, просульфурон і трифлорисульфурон, інгібітори EPSPS (5-енол-піровіл-шикімат-3-фосфатсинтази), інгібітори GS (глутамінсинтази) або інгібітори PPO (протопорфіриногеноксидази)) у результаті традиційних способів селекції або генної інженерії. Прикладом сільськогосподарської культури, якій була надана толерантність до імідазолінів, наприклад імазамоксу, за допомогою традиційних способів селекції (мутагенезу), є суріпиця Clearfield® (канола). Приклади сільськогосподарських культур, яким була надана толерантність до гербіцидів або класів гербіцидів за допомогою способів генної інженерії, включають стійкі до гліфосату і глюфосинату сорти маїсу, комерційно доступні під торговими назвами RoundupReady®, Herculex I® і LibertyLink®.

Термін "корисні рослини" треба розуміти також як такий, що включає корисні рослини, які були трансформовані за допомогою застосування методик із застосуванням рекомбінантних ДНК таким чином, що вони стали здатними синтезувати один або декілька токсинів вибіркової дії, таких як відомі, наприклад, у токсинотворювальних бактерій, особливо бактерій роду *Bacillus*.

Прикладами таких рослин є: YieldGard® (сорт маїсу, що експресує токсин CryIA(b)); YieldGard Rootworm® (сорт маїсу, що експресує токсин CryIIIB(b1)); YieldGard Plus® (сорт маїсу, що експресує токсин CryIA(b) і CryIIIB(b1)); Starlink® (сорт маїсу, що експресує токсин Cry9(c)); Herculex I® (сорт маїсу, що експресує токсин CryIF(a2) і фермент фосфінотрицин-N-ацетилтрансферазу (PAT) із досягненням толерантності до гербіциду глюфосинату амонію); NuCOTN 33B® (сорт бавовнику, що експресує токсин CryIA(c)); Bollgard I® (сорт бавовнику, що експресує токсин CryIA(c)); Bollgard II® (сорт бавовнику, що експресує токсин CryIA(c) і CryIIA(b)); VIPCOT® (сорт бавовнику, що експресує токсин VIP); NewLeaf® (сорт картоплі, що експресує токсин CryIIA); NatureGard®, Agrisure® GT Advantage (GA21 з ознакою толерантності до гліфосату), Agrisure® CB Advantage (Bt11 з ознакою стійкості до кукурудзяного метелика (CB)), Agrisure® RW (з ознакою стійкості до західного кукурудзяного жука) і Protecta®.

Термін "сільськогосподарські культури" слід розуміти як такий, що включає також культурні рослини, які були трансформовані за допомогою методик із застосуванням рекомбінантних ДНК таким чином, що вони стали здатними синтезувати один або декілька токсинів вибіркової дії, таких як відомі, наприклад, у токсиноутворювальних бактерій, особливо бактерій роду *Bacillus*.

Токсини, які можуть експресуватися такими трансгенними рослинами, включають, наприклад, інсектицидні білки із *Bacillus cereus* або *Bacillus popilliae*; або інсектицидні білки із *Bacillus thuringiensis*, такі як δ -ендотоксини, наприклад Cry1Ab, Cry1Ac, Cry1F, Cry1Fa2, Cry2Ab, Cry3A, Cry3Bb1 або Cry9C, або вегетативні інсектицидні білки (Vip), наприклад Vip1, Vip2, Vip3 або Vip3A; або інсектицидні білки бактерій, які колонізують нематод, наприклад *Photorhabdus* spp. або *Xenorhabdus* spp., таких як *Photorhabdus luminescens*, *Xenorhabdus nematophilus*; токсини, які продукуються тваринами, такі як токсини скорпіонів, токсини павукоподібних, токсини ос та інші специфічні для комах нейротоксини; токсини, які продукуються грибами, такі як токсини *Streptomyces*, рослинні лектини, такі як лектини гороху, лектини ячменю або лектини підсніжника; аглютиніни; інгібітори протеїнази, такі як інгібітори трипсину, інгібітори серинпротеази, пататин, цистатин, інгібітори папаїну; білки, що інактивують рибосому (RIP), такі як рицин, RIP маїсу, абрин, люфін, сапорин або бріудин; ферменти метаболізму стероїдів, такі як 3-гідроксистероїдоксидаза, екдистероїд-UDP-глікозилтрансфераза, холестеролоксидази, інгібітори екдизону, HMG-CoA-редуктаза, блокатори іонних каналів, такі як блокатори натрієвих або кальцієвих каналів, естераза ювенільного гормону, рецептори діуретичних гормонів, стильбенсинтаза, дибензилсинтаза, хітинази і глюканази.

У контексті даного винаходу під δ -ендотоксинами, наприклад Cry1Ab, Cry1Ac, Cry1F, Cry1Fa2, Cry2Ab, Cry3A, Cry3Bb1 або Cry9C, або вегетативними інсектицидними білками (Vip), наприклад Vip1, Vip2, Vip3 або Vip3A, безперечно, слід розуміти також гібридні токсини, усічені токсини та модифіковані токсини. Гібридні токсини одержують рекомбінантним способом за допомогою нової комбінації різних доменів тих білків (див., наприклад, WO 02/15701). Відомі усічені токсини, наприклад усічений Cry1Ab. У випадку модифікованих токсинів одна або декілька амінокислот токсину, що зустрічається в природі, є заміщеними. У разі таких амінокислотних замін у токсин переважно вводять послідовності, що не зустрічаються в природному токсині, які розпізнаються протеазами, так, наприклад, у випадку Cry3A055 у токсин Cry3A вводять послідовність, що розпізнається катепсином G (див. WO 03/018810).

Приклади таких токсинів або трансгенних рослин, здатних синтезувати такі токсини, розкриті, наприклад, в EP-A-0374753, WO 93/07278, WO 95/34656, EP-A-0427529, EP-A-451878 і WO 03/052073.

Способи одержання таких трансгенних рослин загалом відомі фахівцю у даній галузі та описані, наприклад, у публікаціях, що згадуються вище. Дезоксирибонуклеїнові кислоти Cry1-типу та їх одержання відомі, наприклад, із WO 95/34656, EP-A-0367474, EP-A-0401979 і WO 90/13651.

Токсин, що міститься у трансгенних рослинах, надає рослинам толерантності щодо шкідливих комах. Такі комахи можуть належати до будь-якої таксономічної групи комах, але особливо часто зустрічаються серед жуків (Coleoptera), двокрилих комах (Diptera) та метеликів (Lepidoptera).

Відомі трансгенні рослини, що містять один або декілька генів, які кодують стійкість до інсектицидів, та експресують один або декілька токсинів, і деякі з них є комерційно доступними. Прикладами таких рослин є: YieldGard® (сорт маїсу, що експресує токсин Cry1Ab); YieldGard Rootworm® (сорт маїсу, що експресує токсин Cry3Bb1); YieldGard Plus® (сорт маїсу, що експресує токсин Cry1Ab і Cry3Bb1); Starlink® (сорт маїсу, що експресує токсин Cry9C); Herculex I® (сорт маїсу, що експресує токсин Cry1Fa2 і фермент фосфінотрицин-N-ацетилтрансферазу (PAT) із досягненням толерантності до гербіциду глюфосинату амонію); NuCOTN 33B® (сорт бавовнику, що експресує токсин Cry1Ac); Bollgard I® (сорт бавовнику, що експресує токсин Cry1Ac); Bollgard II® (сорт бавовнику, що експресує токсин Cry1Ac і Cry2Ab); VipCot® (сорт бавовнику, що експресує токсин Vip3A і Cry1Ab); NewLeaf® (сорт картоплі, що експресує токсин Cry3A); NatureGard®, Agrisure® GT Advantage (GA21 з ознакою толерантності до глюфосату), Agrisure® CB Advantage (Bt11 з ознакою стійкості до кукурудзяного метелика (CB)) і Protecta®.

Додатковими прикладами таких трансгенних сільськогосподарських культур є наступні.

1. Маїс Bt11 від Syngenta Seeds SAS, Chemin de l'Hobit 27, F-31 790 Сен-Совер, Франція, реєстраційний номер C/FR/96/05/10. Генетично модифікований *Zea mays*, якому надали стійкості до ураження кукурудзяним метеликом (*Ostrinia nubilalis* та *Sesamia nonagrioides*) шляхом трансгенної експресії усіченого токсину Cry1Ab. Маїс Bt11 також трансгенно експресує PAT-фермент із забезпеченням толерантності до гербіциду глюфосинату амонію.

2. Маїс Bt176 від Syngenta Seeds SAS, Chemin de l'Hobit 27, F-31 790 Сен-Совер, Франція, реєстраційний номер C/FR/96/05/10. Генетично модифікований *Zea mays*, якому надали стійкості до ураження кукурудзяним метеликом (*Ostrinia nubilalis* та *Sesamia nonagrioides*) шляхом трансгенної експресії токсину Cry1Ab. Маїс Bt176 також трансгенно експресує PAT-фермент із досягненням толерантності до гербіциду глюфосинату амонію.

3. Маїс MIR604 від Syngenta Seeds SAS, Chemin de l'Hobit 27, F-31 790 Сен-Совер, Франція, реєстраційний номер C/FR/96/05/10. Маїс, якому надали стійкості до комах шляхом трансгенної експресії модифікованого токсину Cry3A. Даний токсин являє собою Cry3A055, модифікований шляхом введення послідовності, що розпізнається протеазою катепсином G. Одержання таких трансгенних рослин маїсу описане у WO 03/018810.

4. Маїс MON 863 від Monsanto Europe S.A. 270-272 Avenue de Tervuren, B-1150 Брюссель, Бельгія, реєстраційний номер C/DE/02/9. MON 863 експресує токсин Cry3Bb1 і має стійкість до деяких комах із ряду Coleoptera.

5. Бавовник IPC 531 від Monsanto Europe S.A. 270-272 Avenue de Tervuren, B-1150 Брюссель, Бельгія, реєстраційний номер C/ES/96/02.

6. Маїс 1507 від Pioneer Overseas Corporation, Avenue Tedesco, 7 B-1160 Брюссель, Бельгія, реєстраційний номер C/NL/00/10. Генетично модифікований маїс для експресії білка Cry1F із забезпеченням стійкості до деяких комах із ряду Lepidoptera та білка PAT із забезпеченням толерантності до гербіциду глюфосинату амонію.

7. Маїс NK603 × MON 810 від Monsanto Europe S.A. 270-272 Avenue de Tervuren, B-1150 Брюссель, Бельгія, реєстраційний номер C/GB/02/M3/03. Складається із сортів гібридного маїсу, традиційно виведених шляхом схрещування генетично модифікованих сортів NK603 та MON 810. Маїс NK603 × MON 810 трансгенно експресує білок CP4 EPSPS, одержаний зі штаму CP4 *Agrobacterium* sp., який надає толерантності до гербіциду Roundup® (містить гліфосат), а також токсин Cry1Ab, одержаний із *Bacillus thuringiensis* subsp. *kurstaki*, який забезпечує толерантність до деяких представників із ряду Lepidoptera, зокрема до кукурудзяного метелика.

Застосовуваний у даному документі термін "місце зростання" означає поля, на яких або в яких вирощують рослини, або на яких висівають насіння культивованих рослин, або де насінину будуть поміщати в ґрунт. Він включає ґрунт, насіння та саджанці, а також наявні зелені рослини.

Термін "рослини" означає всі фізичні частини рослини, включаючи насіння, саджанці, пагони, корені, бульби, стебла, квітконіжки, листя та плоди.

Термін "матеріал для розмноження рослин" слід розуміти як такий, що означає генеративні частини рослини, такі як насіння, що можна застосовувати для розмноження останньої, і вегетативний матеріал, такий як паростки або бульби, наприклад картопляні. Можуть бути згадані, наприклад, насіння (у більш точному розумінні), коріння, плоди, бульби, цибулини, кореневища та частини рослин. Також можуть бути згадані пророслі рослини та молоді рослини, які треба пересадити після проростання або після появи сходів із ґрунту. Ці молоді рослини можна захистити до пересадки повною або частковою обробкою шляхом занурення. Переважно "матеріал для розмноження рослин" слід розуміти як такий, що означає насіння.

Пестицидні засоби, наведені в цьому документі з використанням їхньої загальноприйнятої назви, відомі, наприклад, із "The Pesticide Manual", 15th Ed., British Crop Protection Council 2009.

Сполуки формули (I) можна застосовувати в немодифікованій формі або переважно разом із допоміжними речовинами, які традиційно застосовують у галузі складання. Для цього їх можна зручно складати відомим способом в здатні до емульгування концентрати, пасти, які наносять у вигляді покриття, розчини або суспензії, які безпосередньо розпилюють або розводять, розведені емульсії, змочувані порошки, розчинні порошки, пілоподібні препарати, грануляти, а також інкапсульовані форми, наприклад, у полімерних речовинах. Як і у випадку з типом композицій, способи застосування, такі як розпилення, дрібнодисперсне розпилення, обпилення, розсіювання, нанесення покриття або полив, вибирають згідно з передбаченими цілями та переважними умовами. Композиції також можуть містити додаткові допоміжні речовини, такі як стабілізатори, піногасники, регулятори в'язкості, зв'язувальні речовини або речовини для підвищення клейкості, а також добрива, донори мікроелементів або інші складові для одержання особливих ефектів.

Придатні носії і допоміжні речовини, наприклад, для застосування у сільському господарстві можуть бути твердими або рідкими та являти собою речовини, застосовні у технології складання, наприклад природні або регенеровані мінеральні речовини, розчинники, диспергувальні речовини, змочувальні засоби, речовини для підвищення клейкості, загусники, зв'язувальні речовини або добрива. Такі носії, наприклад, описані у WO 97/33890.

Сполуки формули (I) зазвичай застосовують у формі композицій, та їх можна застосовувати щодо посівної площі або рослини, що підлягає обробці, одночасно або послідовно з

додатковими сполуками. Такі додаткові сполуки можуть являти собою, наприклад, добрива, або донори мікроелементів, або інші препарати, які впливають на ріст рослин. Вони також можуть являти собою селективні гербіциди або неселективні гербіциди, а також інсектициди, фунгіциди, бактерициди, нематоциди, молюскоциди або суміші декількох із таких препаратів, якщо це необхідно, разом із додатковими носіями, поверхнево-активними речовинами або допоміжними речовинами, що полегшують застосування, зазвичай застосовуваними в галузі складання.

Сполуки формули (I) можна застосовувати у формі (фунгіцидних) композицій для контролю або захисту від фітопатогенних мікроорганізмів, що містять як активний інгредієнт щонайменше одну сполуку формули (I) або щонайменше одну переважну окрему сполуку, як визначено вище, у вільній формі або у формі агрохімічно застосовної солі та щонайменше одну з наведених вище допоміжних речовин.

У даному винаході передбачена композиція, переважно фунгіцидна композиція, що містить щонайменше одну сполуку формули (I), прийнятний для сільського господарства носій і необов'язково допоміжну речовину. Прийнятний для сільського господарства носій являє собою, наприклад, носій, який є придатним для застосування у сільському господарстві. Носії для сільського господарства добре відомі з рівня техніки. Переважно вказана композиція може містити щонайменше одну або декілька пестицидно активних сполук, наприклад додатковий фунгіцидно активний інгредієнт додатково до сполуки формули (I).

Сполука формули (I) може бути єдиним активним інгредієнтом у композиції, або вона може бути змішана з одним або декількома додатковими активними інгредієнтами, такими як пестицид, фунгіцид, синергіст, гербіцид або регулятор росту рослин, якщо це необхідно. Додатковий активний інгредієнт може у деяких випадках зумовлювати появу неочікуваних синергічних активностей.

Приклади придатних додаткових активних інгредієнтів включають наступні: фунгіциди групи ациклоамінокислоти, фунгіциди групи аліфатичних азотовмісних сполук, фунгіциди групи амідів, фунгіциди групи анілідів, фунгіциди групи антибіотиків, фунгіциди групи ароматичних сполук, миш'яковмісні фунгіциди, фунгіциди групи арилфенілкетонів, фунгіциди групи бензамідів, фунгіциди групи бензанілідів, фунгіциди групи бензімідазолів, фунгіциди групи бензотіазолів, рослинні фунгіциди, фунгіциди групи місткових дифенілів, фунгіциди групи карбаматів, фунгіциди групи карбанілатів, фунгіциди групи коназолів, фунгіциди, що містять мідь, фунгіциди групи дикарбоксимідів, фунгіциди групи динітрофенолів, фунгіциди групи дитіокарбаматів, фунгіциди групи дитіоланів, фунгіциди групи фурамідів, фунгіциди групи фуранілідів, фунгіциди групи гідразидів, фунгіциди групи імідазолів, фунгіциди, що містять ртуть, фунгіциди групи морфолінів, фунгіциди групи фосфорорганічних сполук, фунгіциди групи оловоорганічних сполук, фунгіциди групи оксатінінів, фунгіциди групи оксазолів, фунгіциди групи фенілсульфамідів, фунгіциди групи полісульфідів, фунгіциди групи піразолів, фунгіциди групи піридинів, фунгіциди групи піримідинів, фунгіциди групи піролів, фунгіциди групи четвертинних амонієвих сполук, фунгіциди групи хінолінів, фунгіциди групи хінонів, фунгіциди групи хіноксалінів, фунгіциди групи стробілуринів, фунгіциди групи сульфоналідів, фунгіциди групи тіадіазолів, фунгіциди групи тіазолів, фунгіциди групи тіазолідинів, фунгіциди групи тіокарбаматів, фунгіциди групи тіофенів, фунгіциди групи триазинів, фунгіциди групи триазолів, фунгіциди групи триазолопіримідинів, фунгіциди групи сечовини, фунгіциди групи валінамідів та фунгіциди, що містять цинк.

Приклади придатних додаткових активних інгредієнтів також включають наступні сполуки: нафтові масла, 1,1-біс(4-хлорфеніл)-2-етоксиетанол, 2,4-дихлорфенілбензолсульфонат, 2-фтор-N-метил-N-1-нафтилацетамід, 4-хлорфенілфенілсульфон, ацетопрол, альдоксикарб, амідітін, амідотіоат, амітон, амітону гідрогеносалат, амітраз, араміт, оксид миш'яку, азобензол, азотоат, беноміл, беноксафос, бензилбензоат, біксафен, брофенвалерат, бромоциклен, бромофос, бромопропілат, бупрофезин, буткарбоксим, бутоксикарбоксим, бутілпіридабен, полісульфід кальцію, камфехлор, карбанолат, карбофенотіон, циміазол, хінометіонат, хлорбензид, хлордифеформ, гідрохлорид хлордифеформу, хлорфенетол, хлорфенсон, хлорфенсульфід, хлоробензилат, хлоромебуформ, хлорометіурон, хлорпропілат, хлортіофос, цинерин I, цинерин II, цинерини, клозантел, кумафос, кротамітон, кротоксифос, куфранеб, ціантоат, DCPM, DDT, демефіон, демефіон-О, демефіон-S, деметон-метил, деметон-О, деметон-О-метил, деметон-S, деметон-S-метил, деметон-S-метилсульфон, дихлорфлуанід, дихлофос, дикліфос, дієнохлор, димефокс, динекс, динекс-диклексин, динокап-4, динокап-6, диноктон, динопентон, диносальфон, динотербон, діоксатіон, дифенілсульфон, дисульфідрам, DNOC, дофенапін, дорамектин, ендотіон, епріномектин, етоат-метил, етримфос, феназафлор, оксид фенбутатину, фенотіокарб, фенпірад, фенпіроксимат, фенпіразамін, фензон, фентрифеніл, флубензімін, флуциклоксурон, флуенетил, флуорбензид, FMC 1137,

форметанат, гідрохлорид форметанату, формпаранат, гамма-НСН, гліодин, галфенпрокс, гексадецилциклопропанкарбоксилат, ізокарбофос, жасмолін I, жасмолін II, йодофенфос, ліндан, малонобен, мекарбам, мефосфолан, месульфен, метакрифос, метилбромід, метолкарб, мексакарбат, оксим мілбеміцину, міпафокс, монокротофос, морфотіон, моксидактин, налед, 4-хлор-2-(2-хлор-2-метилпропіл)-5-[(6-йод-3-піридил)метокси]піридазин-3-он, ніфлуридид, нікоміцини, нітрилакарб, комплекс нітрилакарбу та хлориду цинку 1:1, ометоат, оксидепрофос, оксидисульфотон, pp'-DDT, паратіон, перметрин, фенкаптон, фозалон, фосфолан, фосфамідон, поліхлортерпени, полінактини, проклонол, промацил, пропоксур, протидатіон, протоат, піретрин I, піретрин II, піретрини, піридафентіон, піримітат, квіналфос, квінтіофос, R-1492, фосгліцин, ротенон, шрадан, себуфос, селамектин, софамід, SSI-121, сульфірам, сульфлурамід, сульфотеп, сірку, дифловідазин, тау-флювалінат, ТЕРР, тербам, тетрадифон, тетрасул, тіафенокс, тіокарбоксим, тіофанокс, тіометон, тіоквінокс, турингієнсин, триаміфос, триаратен, триазофос, триазурон, трифенофос, тринактин, вамідотіон, ваніліпрол, бетоксазин, діоктаноат міді, сульфат міді, цибутрин, дихлон, дихлорофен, ендотал, фентин, гашене вапно, набам, квіноксамід, квінонамід, симазин, ацетат трифенілтіну, гідроксид трифенілтіну, круфомат, піперазин, тіофанат, хлоралозу, фентіон, піридин-4-амін, стрихнін, 1-гідрокси-1Н-піридин-2-тіон, 4-(хіноксалін-2-іламіно)бензолсульфонамід, 8-гідроксихінолінсульфат, бронопол, гідроксид міді, крезол, дипіритіон, додицин, фенаміносульф, формальдегід, гідраргафен, касугаміцин, гідрат гідрохлориду касугаміцину, біс(диметилдітіокарбамат) нікелю, нітрапірин, октилінон, оксолінову кислоту, окситетрациклін, гідроксихінолінсульфат калію, пробеназол, стрептоміцин, сесквісульфат стрептоміцину, теклофталам, тіомерсал, *Adoxophyes orana* GV, *Agrobacterium radiobacter*, *Amblyseius* spp., *Anagrapha falcifera* NPV, *Anagrus atomus*, *Aphelinus abdominalis*, *Aphidius colemani*, *Aphidoletes aphidimyza*, *Autographa californica* NPV, *Bacillus sphaericus* Neide, *Beauveria brongniartii*, *Chrysoperla carnea*, *Cryptolaemus montrouzieri*, *Cydia pomonella* GV, *Dacnusa sibirica*, *Diglyphus isaea*, *Encarsia formosa*, *Eretmocerus eremicus*, *Heterorhabditis bacteriophora* та *H. megidis*, *Hippodamia convergens*, *Leptomastix dactylopii*, *Macrolophus caliginosus*, *Mamestra brassicae* NPV, *Metaphycus helvolus*, *Metarhizium anisopliae* var. *acridum*, *Metarhizium anisopliae* var. *anisopliae*, *Neodiprion sertifer* NPV та *N. lecontei* NPV, *Orius* spp., *Paecilomyces fumosoroseus*, *Phytoseiulus persimilis*, *Steinernema bibionis*, *Steinernema carpocapsae*, *Steinernema feltiae*, *Steinernema glaseri*, *Steinernema riobrave*, *Steinernema riobrave*, *Steinernema scapterisci*, *Steinernema* spp., *Trichogramma* spp., *Typhlodromus occidentalis*, *Verticillium lecanii*, афолат, бісазир, бусульфам, диматиф, хемел, хемпу, метепу, метіотепу, метилафолат, морзид, пенфлурон, тепу, тіохемпу, тіотепу, третамін, уредепу, (Е)-дец-5-ен-1-іл-ацетат із (Е)-дец-5-ен-1-олом, (Е)-тридец-4-ен-1-іл-ацетат, (Е)-6-метилгепт-2-ен-4-ол, (Е, Z)-тетрадека-4,10-дієн-1-іл-ацетат, (Z)-додец-7-ен-1-іл-ацетат, (Z)-гексадец-11-еналь, (Z)-гексадец-11-ен-1-іл-ацетат, (Z)-гексадец-13-ен-11-ін-1-іл-ацетат, (Z)-ікоз-13-ен-10-он, (Z)-тетрадец-7-ен-1-аль, (Z)-тетрадец-9-ен-1-ол, (Z)-тетрадец-9-ен-1-іл-ацетат, (7Е, 9Z)-додека-7,9-дієн-1-іл-ацетат, (9Z, 11Е)-тетрадека-9,11-дієн-1-іл-ацетат, (9Z, 12Е)-тетрадека-9,12-дієн-1-іл-ацетат, 14-метилоктадец-1-ен, 4-метилнонан-5-ол із 4-метилнонан-5-оном, альфа-мультистриатин, бревікомін, кодлелур, кодлемон, куелур, диспарлур, додец-8-ен-1-іл-ацетат, додец-9-ен-1-іл-ацетат, додека-8, 10-дієн-1-іл-ацетат, домінікалур, етил-4-метилоктаноат, евгенол, фронталін, грандлур, грандлур I, грандлур II, грандлур III, грандлур IV, гексалур, іпсдієнол, іпсенол, японілур, лінеатин, літлур, луплур, медлур, мегатомову кислоту, метилевгенол, мускалур, октадека-2,13-дієн-1-іл-ацетат, октадека-3,13-дієн-1-іл-ацетат, орфралур, орикталур, острамон, сиглур, сордідин, сулкатол, тетрадец-11-ен-1-іл-ацетат, тримедлур, тримедлур А, тримедлур В₁, тримедлур В₂, тримедлур С, транк-кол, 2-(октилтіо)етанол, бутопіроноксил, бутокси(поліпропіленгліколь), дибутиладіпат, дибутилфталат, дибутилсукцинат, діетилтолуамід, диметилкарбат, диметилфталат, етилгександіол, гексамід, метоквін-бутил, метилнеодеканамід, оксамат, пікаридин, 1-дихлор-1-нітроетан, 1,1-дихлор-2,2-біс(4-етилфеніл)етан, 1,2-дихлорпропан із 1,3-дихлорпропеном, 1-бром-2-хлоретан, 2,2,2-трихлор-1-(3,4-дихлорфеніл)етилацетат, 2,2-дихлорвініл-2-етилсульфінетилметилфосфат, 2-(1,3-дитіолан-2-іл)фенілдиметилкарбамат, 2-(2-бутоксietокси)етилтіоціанат, 2-(4,5-диметил-1,3-діоксолан-2-іл)фенілметилкарбамат, 2-(4-хлор-3,5-ксілілокси)етанол, 2-хлорвінілдіетилфосфат, 2-імідазолідон, 2-ізовалериліндан-1,3-діон, 2-метил(проп-2-ініл)амінофенілметилкарбамат, 2-тіоціанатоетиллаурат, 3-бром-1-хлорпроп-1-ен, 3-метил-1-фенілпіразол-5-іл-диметилкарбамат, 4-метил(проп-2-ініл)аміно-3,5-ксілілметилкарбамат, 5,5-диметил-3-оксоциклогекс-1-еніл-диметилкарбамат, ацетіон, акрилонітрил, альдрин, алозамідин, аліксикарб, альфа-екдизон, фосфід алюмінію, амінокарб, анабазин, атидатіон, азаметифос, дельта-ендотоксини *Bacillus thuringiensis*, гексафторсилікат барію, полісульфід барію, бартрин, Bayer 22/190, Bayer 22408, бета-цифлутрин, бета-циперметрин, біоетанометрин, біоперметрин, біс(2-хлоретил) етер, буру,

бромфенвінфос, бром-DDT, буфенкарб, бутакарб, бутатіофос, бутонат, арсенат кальцію, ціанід кальцію, сірковуглець, тетрахлорметан, гідрохлорид картапу, цевадин, хлорбіциклен, хлордан, хлордекон, хлороформ, хлорпікрин, хлорфоксим, хлорпразофос, цис-ресметрин, цисметрин, клоцитрин, ацетоарсеніт міді, арсенат міді, олеат міді, кумітоат, кріоліт, CS 708, ціанофенфос,

5 ціанофос, циклетрин, цитіоат, d-тетраметрин, DAEP, дазомет, декарбофуран, діамідафос, дикаптон, дихлофентіон, дикрезил, дицикланіл, діелдрин, діетил-5-метилпіразол-3-іл-фосфат, дилор, димефлутрин, диметан, диметрин, диметилвінфос, диметилан, динопроп, диносам, диносеб, діофенолан, діоксабензофос, дитикрофос, DSP, екдистерон, EI 1642, EMPC, EPBP, етафос, етіофенкарб, етилформіат, етилендибромід, етилендихлорид, оксид етилену, EXD,

10 фенхлорфос, фенетакарб, фенітротіон, феноксаkrim, фенпіритрин, фенсульфотіон, фентіон-етил, флукофурун, фосметилан, фоспірат, фостіетан, фураціокарб, фуретрин, гуазатин, ацетати гуазатину, тетратіокарбонат натрію, галфенпрокс, HCH, HEOD, гептахлор, гетерофос, HHDN, синільну кислоту, хіквінкарб, IPSP, ізазофос, ізобензан, ізодрин, ізофенфос, ізолан, ізопротіолан, ізоксатіон, ювенільний гормон I, ювенільний гормон II, ювенільний гормон III,

15 келеван, кінопрен, арсенат свинцю, лептофос, лірімфос, літідатіон, м-куменілметилкарбамат, фосфід магнію, мазидокс, мекарфон, меназон, хлорид ртуті, месульфенфос, метам, метам-калій, метам-натрій, метансульфонілфторид, метокротофос, метопрен, метотрин, метоксихлор, метилізотіоціанат, метилхлороформ, метиленхлорид, метоксadiaзон, мірекс, нафталофос, нафталін, NC-170, нікотин, сульфат нікотину, нітіазин, норнікотин, O-5-дихлор-4-йодфеніл-O-

20 етилетилфосфонотіоат, O, O-діетил-O-4-метил-2-оксо-2H-хромен-7-іл-фосфоротіоат, O, O-діетил-O-6-метил-2-пропілпіримідин-4-ілфосфоротіоат, O, O,O',O'-тетрапропілдітіопірофосфат, олеїнову кислоту, пара-дихлорбензол, паратіон-метил, пентахлорфенол, пентахлорфеніллаурат, PH 60-38, фенкаптон, фосніхлор, фосфін, фоксим-метил, піриметафос, ізомери поліхлордициклопентадієну, арсеніт калію, тіоціанат калію, прекоцен I, прекоцен II,

25 прекоцен III, примідофос, профлутрин, промеккарб, протіофос, піразофос, піресметрин, квасію, квіналфос-метил, квінотіон, рафоксанід, ресметрин, ротенон, кадетрин, ріанію, ріанодин, сабадилу, шрадан, себуфос, SI-0009, тіапроніл, арсеніт натрію, ціанід натрію, фторид натрію, гексафторсилікат натрію, пентахлорфеноксид натрію, селенат натрію, тіоціанат натрію, сулкофурун, сулкофурун-натрій, сульфурилфторид, сульпрофос, дьогтьові масла, тазимкарб,

30 TDE, тебупіримфос, темефос, тералетрин, тетрахлоретан, тикрофос, тіоциклам, гідрогеноксалат тіоцикламу, тіоназин, тіосултап, тіосултап-натрій, тралометрин, трансперметрин, триазамат, трихлорметафос-3, трихлоронат, триметакарб, толпрокарб, трихлопірикарб, трипрен, вератридин, вератрин, ХМС, зетаметрин, фосфід цинку, золапрофос та меперфлутрин, тетраметилфлутрин, біс(трибутилтин)оксид, бромацетамід, фосфат заліза,

35 ніккосамід-оламін, оксид трибутилтину, піриморф, трифенморф, 1,2-дибром-3-хлорпропан, 1,3-дихлорпропен, 3,4-дихлортетрагідротіофен-1,1-діоксид, 3-(4-хлорфеніл)-5-метилроданін, 5-метил-6-тіоксо-1,3,5-тіадіазинан-3-ілоцтову кислоту, 6-ізопентеніламінопурін, бенклотіаз, цитокініні, DCIP, фурфурол, ізамідофос, кінетин, композицію на основі *Myrothecium verrucaria*, тетрахлортіофен, ксиленоли, зеатин, етилксантат калію, ацибензолар, ацибензолар-S-метил,

40 екстракт *Reynoutria sachalinensis*, альфа-хлоргідрин, анту, карбонат барію, бістіосемі, бродифакум, бромадіолон, брометалін, хлорофацинон, холекальциферол, кумахлор, кумафурил, куматетраліл, кримідин, дифенакум, дифетіалон, дифацинон, ергокальциферол, флокумафен, флуороацетамід, флупропадин, гідрохлорид флупропадину, норбормід, фосацетим, фосфор, піндон, піринурон, скілірозид, фторацетат натрію, сульфат талію,

45 варфарин, 2-(2-бутоксietокси)етилпіперонілат, 5-(1,3-бензодіоксол-5-іл)-3-гексилциклогекс-2-енон, фарнезол із неролідолом, вербутин, MGK 264, піперонілбутоксид, піпротал, ізомер пропілу, S421, сезамекс, сезасмолін, сульфоксид, антрахінон, нафтенат міді, оксихлорид міді, дициклопентадієн, тирам, нафтенат цинку, цирам, іманін, рибавірин, оксид ртуті, тіофанат-метил, азаконазол, бітертанол, бромуконазол, ципроконазол, дифеноконазол, диніконазол,

50 епоксиконазол, фенбуконазол, флуквіконазол, флузилазол, флутриафол, фураметпір, гексаконазол, імазаліл, імібенконазол, іпконазол, метконазол, міклобутаніл, паклобутразол, пефуразоат, пенконазол, протіоконазол, пірифенокс, прохлораз, пропіконазол, піризоксазол, симеконазол, тебуконазол, тетраконазол, триадимефон, триадименол, трифлумізол, тритиконазол, анцимідол, фенаримол, нуаримол, бупіримат, диметиримол, етиримол,

55 додеморф, фенпропідин, фенпропіморф, спіроксамін, тридеморф, ципродиніл, мепаніпірим, піриметаніл, фенпиклоніл, флудіоксоніл, беналаксил, фуралаксил, металаксил, R-металаксил, офурас, оксаксидил, карбендазим, дебакарб, фуберидазол, тіабендазол, хлосолінат, дихлосолін, міклозолін, процимідон, вінклозолін, боскалід, карбоксин, фенфурам, флутоланіл, мепроніл, оксикарбоксин, пентіопірад, тифлузамід, додин, іміноктадин, азоксистробін,

60 димоксистробін, енестробурин, фенамінстробін, флуфеноксистробін, флуоксастробін,

крезоксим-метил, метоміностробін, трифлуксистробін, орикастобін, пікоксистробін, піраклостробін, піраметостробін, піраоксистробін, фербам, манкозеб, манеб, метирам, пропінеб, цинеб, каптафол, каптан, фтороїмід, фолпет, толілфлуанід, бордоську суміш, оксид міді, манкопер, оксинову мідь, нітротал-ізопропіл, едифенфос, іпробенфос, фосдифен, толклофос-метил, анілазин, бентіавакарб, бластицидин-S, хлоронеб, хлороталоніл, цифлуфенамід, цимоксаніл, диклоцимет, дикломезин, диклоран, діетофенкарб, диметоморф, флуморф, дитіанон, етабоксам, етридіазол, фамоксадон, фенамідон, феноксаніл, феримзон, флуазинам, флуопіколід, флусульфамід, флуксапіроксад, фенгексамід, фосетил-алюміній, хімеказол, іпровалікарб, ціазофамід, метасульфокарб, метрафенон, пенцикурон, фталід, поліоксини, пропамокарб, пірибенкарб, проквіназид, піроквілон, пірофенон, квіноксифен, квінтозен, тіадиніл, триазоксид, трициклазол, трифорин, валідаміцин, валіфеналат, зоксамід, мандипропамід, ізопіразам, седаксан, бензовіндифлупір, підифлуметофен, 3-дифторметил-1-метил-1Н-піразол-4-карбонову кислоту (3',4',5'-трифтор-біфеніл-2-іл)-амід, ізофлуципрам, ізотіаніл, дипіметитрон, 6-етил-5,7-діоксо-піроло[4,5][1,4]дитііно[1,2-с]ізотіазол-3-карбонітрил, 2-(дифторметил)-N-[3-етил-1,1-диметил-індан-4-іл]піридин-3-карбоксамід, 4-(2,6-дифторфеніл)-6-метил-5-феніл-піридазин-3-карбонітрил, (R)-3-(дифторметил)-1-метил-N-[1,1,3-триметиліндан-4-іл]піразол-4-карбоксамід, 4-(2-бром-4-фтор-феніл)-N-(2-хлор-6-фтор-феніл)-2,5-диметил-піразол-3-амін, 4-(2-бром-4-фторфеніл)-N-(2-хлор-6-фторфеніл)-1,3-диметил-1Н-піразол-5-амін, флуїндапір, куметоксистробін (цзясянцзюньчжи), лвбенміксіанан, дихлобентіазокс, мандестробін, 3-(4,4-дифтор-3,4-дигідро-3,3-диметилізохінолін-1-іл)хінолон, 2-[2-фтор-6-[(8-фтор-2-метил-3-хінолід)окси]феніл]пропан-2-ол, оксатіапіпролін, трет-бутил-N-[6-[[[(1-метилтетразол-5-іл)-феніл-метиле]аміно]оксиметил]-2-піридил]карбамат, піразифлумід, інпірфлуксам, тролпрокарб, мефентрифлуконазол, іпфентрифлуконазол, 2-(дифторметил)-N-[(3R)-3-етил-1,1-диметил-індан-4-іл]піридин-3-карбоксамід, N'-(2,5-диметил-4-феноксифеніл)-N-етил-N-метил-формамідин, N'-[4-(4,5-дихлортіазол-2-іл)окси-2,5-диметил-феніл]-N-етил-N-метил-формамідин, [2-[3-[2-[1-[2-[3,5-біс(дифторметил)піразол-1-іл]ацетил]-4-піперидил]тіазол-4-іл]-4,5-дигідроізоксазол-5-іл]-3-хлор-феніл]метансульфонат, бут-3-ініл-N-[6-[(Z)-[(1-метилтетразол-5-іл)-феніл-метиле]аміно]оксиметил]-2-піридил]карбамат, метил-N-[5-[4-(2,4-диметилфеніл)тріазол-2-іл]-2-метил-феніл]метил]карбамат, 3-хлор-6-метил-5-феніл-4-(2,4,6-трифторфеніл)піридазин, піридахлометил, 3-(дифторметил)-1-метил-N-[1,1,3-триметиліндан-4-іл]піразол-4-карбоксамід, 1-[2-[1-(4-хлорфеніл)піразол-3-іл]оксиметил]-3-метил-феніл]-4-метил-тетразол-5-он, 1-метил-4-[3-метил-2-[2-метил-4-(3,4,5-триметилпіразол-1-іл)феноксифеніл]тетразол-5-он, амінопірифен, аметоктрадин, амісулбром, пенфлуфен, (Z, 2E)-5-[1-(4-хлорфеніл)піразол-3-іл]окси-2-метоксиіміно-N, 3-диметил-пент-3-енамід, флорилпікоксамід, фенпікоксамід, тебуфловкін, іпфлуфеноквін, квінофумелін, ізофетамід, N-[2-[2,4-дихлор-феноксифеніл]-3-(дифторметил)-1-метил-піразол-4-карбоксамід, N-[2-[2-хлор-4-(трифторметил)феноксифеніл]-3-(дифторметил)-1-метил-піразол-4-карбоксамід, бензотіостробін, фенамакрил, цинкову сіль 5-аміно-1,3,4-тіадіазол-2-тіолу (1:2), флуопірам, флутіаніл, флуопімомід, пірапропон, пікарбутразокс, 2-(дифторметил)-N-(3-етил-1,1-диметил-індан-4-іл)піридин-3-карбоксамід, 2-(дифторметил)-N-((3R)-1,1,3-триметиліндан-4-іл)піридин-3-карбоксамід, 4-[[6-[2-(2,4-дифторфеніл)-1,1-дифтор-2-гідрокси-3-(1,2,4-тріазол-1-іл)пропіл]-3-піридил]окси]бензонітрил, метилтетрапрол, 2-(дифторметил)-N-((3R)-1,1,3-триметиліндан-4-іл)піридин-3-карбоксамід, α-(1,1-диметилетил)-α-[4'-(трифторметокси)[1,1'-біфеніл]-4-іл]-5-піримідинметанол, флуоксапіпролін, енокастробін, 4-[[6-[2-(2,4-дифторфеніл)-1,1-дифтор-2-гідрокси-3-(1,2,4-тріазол-1-іл)пропіл]-3-піридил]окси]бензонітрил, 4-[[6-[2-(2,4-дифторфеніл)-1,1-дифтор-2-гідрокси-3-(5-сульфаніл-1,2,4-тріазол-1-іл)пропіл]-3-піридил]окси]бензонітрил, 4-[[6-[2-(2,4-дифторфеніл)-1,1-дифтор-2-гідрокси-3-(5-тіоксо-4Н-1,2,4-тріазол-1-іл)пропіл]-3-піридил]окси]бензонітрил, тринексапак, кумоксистробін, чжуншенміцин, тіодіазол міді, тіазол цинку, амектотрактин, іпродіон, N-метокси-N-[[4-[5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл]феніл]метил]циклопропанкарбоксамід, N, 2-диметокси-N-[[4-[5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл]феніл]метил]пропанамід, N-етил-2-метил-N-[[4-[5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл]феніл]метил]пропанамід, 1-метокси-3-метил-1-[[4-[5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл]феніл]метил]сечовину, 1,3-диметокси-1-[[4-[5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл]феніл]метил]сечовину, 3-етил-1-метокси-1-[[4-[5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл]феніл]метил]сечовину, N-[[4-[5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл]феніл]метил]пропанамід, 4,4-диметил-2-[[4-[5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл]феніл]метил]ізоксазолідин-3-он, 5,5-диметил-2-[[4-[5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл]феніл]метил]ізоксазолідин-3-он, етил-1-[[4-[5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл]феніл]метил]піразол-4-карбоксилат, N, N-диметил-1-[[4-[5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл]феніл]метил]-1,2,4-тріазол-3-амін, який може бути одержаний зі способів, описаних у WO 2017/055473, WO 2017/055469, WO 2017/093348 та WO

2017/118689, 2-[6-(4-хлорфенокси)-2-(трифторметил)-3-піридил]-1-(1,2,4-триазол-1-іл)пропан-2-ол (дану сполуку можна одержувати зі способів, описаних у WO 2017/029179), 2-[6-(4-бромфенокси)-2-(трифторметил)-3-піридил]-1-(1,2,4-триазол-1-іл)пропан-2-ол (дану сполуку можна одержувати зі способів, описаних у WO 2017/029179), 3-[2-(1-хлорциклопропіл)-3-(2-фторфеніл)-2-гідрокси-пропіл]імідазол-4-карбонітрил (дану сполуку можна одержувати зі способів, описаних у WO 2016/156290), 3-[2-(1-хлорциклопропіл)-3-(3-хлор-2-фтор-феніл)-2-гідрокси-пропіл]імідазол-4-карбонітрил (дану сполуку можна одержувати зі способів, описаних у WO 2016/156290),

(4-феноксифеніл)метил-2-аміно-6-метил-піридин-3-карбоксилат (дану сполуку можна одержувати зі способів, описаних у WO 2014/006945), 2,6-диметил-1Н, 5Н-[1,4]дитііно[2,3-с:5,6-с']дипірол-1,3,5,7(2Н, 6Н)-тетрон (дану сполуку можна одержувати зі способів, описаних у WO 2011/138281), N-метил-4-[5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл]бензолкарботіоамід,

N-метил-4-[5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл]бензамід, (Z, 2E)-5-[1-(2,4-дихлорфеніл)піразол-3-іл]окси-2-метоксиіміно-N, 3-диметил-пент-3-енамід (дану сполуку можна одержувати зі способів, описаних у WO 2018/153707), N'-(2-хлор-5-метил-4-фенокси-феніл)-N-етил-N-метил-формамідин, N'-[2-хлор-4-(2-фторфенокси)-5-метил-феніл]-N-етил-N-метил-формамідин (дану сполуку можна одержувати зі способів, описаних у WO 2016/202742), 2-(дифторметил)-N-[(3S)-3-етил-1,1-диметил-індан-4-іл]піридин-3-карбоксамід (дану сполуку можна одержувати зі способів, описаних у WO 2014/095675).

Сполуки за даним винаходом також можна застосовувати в комбінації з антигельмінтними засобами. Такі антигельмінтні засоби включають сполуки, вибрані зі сполук класу макроциклічних лактонів, таких як похідні івермектину, авермектину, абамектину, емаектину, еприномектину, дорамектину, селамектину, моксидектину, немадектину та мілбеміцину, описані в EP-357460, EP-444964 і EP-594291. Додаткові антигельмінтні засоби включають напівсинтетичні та біосинтетичні похідні авермектину/мілбеміцину, такі як описані в US-5015630, WO-9415944 і WO-9522552. Додаткові антигельмінтні засоби включають бензімідазоли, такі як албендазол, камбендазол, фенбендазол, флубендазол, мебендазол, оксфендазол, оксibenдазол, парбендазол та інші члени даного класу. Додаткові антигельмінтні засоби включають імідазотіазоли та тетрагідропримідини, такі як тетрамізол, левамизол, пірантелу памоат, оксантел або морантел. Додаткові антигельмінтні засоби включають флукіциди, такі як триклабендазол і клорсулон, а також цестодоциди, такі як празиквантел й еспипрантел.

Сполуки за даним винаходом можна застосовувати в комбінації з похідними й аналогами антигельмінтних засобів класу парагеркваміду/маркфортину, а також із протипаразитарними оксазолінами, такими як розкриті в US-5478855, US-4639771 і DE-19520936.

Сполуки за даним винаходом можна застосовувати в комбінації з похідними й аналогами загального класу діоксоморфолінових протипаразитарних засобів, описаними у WO-9615121, а також з антигельмінтними активними циклічними депсипептидами, такими як описані у WO-9611945, WO-9319053, WO-9325543, EP-626375, EP-382173, WO-9419334, EP-382173 і EP-503538.

Сполуки за даним винаходом можна застосовувати в комбінації з іншими ектопаразитацідами; наприклад, фіпронілом; піретроїдами; фосфорорганічними сполуками; регуляторами росту комах, такими як люфенурон; агоністами екдизону, такими як тебуфенозид тощо; неонікотиноїдами, такими як імідаклоприд тощо.

Сполуки за даним винаходом можна застосовувати в комбінації з терпеновими алкалоїдами, описаними, наприклад, у WO 95/19363 або WO 04/72086, зокрема сполуками, розкритими в цих документах.

Інші приклади таких біологічно активних сполук, у комбінації з якими можна застосовувати сполуки за даним винаходом, включають без обмеження наступні.

Фосфорорганічні сполуки: ацефат, азаметинос, азинфос-етил, азинфос-метил, бромифос, бромифос-етил, кадусафос, хлоретоксифос, хлорпірифос, хлорфенвінфос, хлормефос, деметон, деметон-S-метил, деметон-S-метилсульфон, діаліфос, діазинон, дихлорвос, дикротофос, диметоат, дисульфотон, етіон, етопрофос, етримфос, фамфур, фенаміфос, фенітротіон, фенсульфотіон, фентіон, флупіразофос, фонофос, формотіон, фостіазат, гептенофос, ісазофос, ізотіоат, ізоксатіон, малатіон, метакрифос, метамідофос, метидатіон, метил-паратіон, мевінфос, монокротофос, налед, ометоат, оксидеметон-метил, параоксон, паратіон, паратіон-метил, фентоат, фозалон, фосфолан, фосфокарб, фосмет, фосфамідон, форат, фоксим, піриміфос, піриміфос-метил, профенофос, пропафос, проетамфос, протіофос, піраклофос, піридапентіон, квіналфос, сульпрофос, темефос, тербуфос, тебупіримфос, тетрахлорвінфос, тиметон, тіазофос, трихлорфон, вамідотіон.

Карбамати: аланікарб, альдікарб, 2-втор-бутилфенілметилкарбамат, бенфуракарб,

карбарил, карбофуран, карбосульфат, клоетокарб, етіофенкарб, феноксикарб, фентіокарб, фураціокарб, HCN-801, ізопрокарб, індоксакарб, метіокарб, метоміл, 5-метил-м-куменілбутирил(метил)карбамат, оксаміл, піримікарб, пропоксур, тіодикарб, тіофанокс, триазамат, UC-51717.

Піретроїди: акринатин, алетрин, альфаметрин, 5-бензил-3-фурилметил-(E)-(1R)-цис-2,2-диметил-3-(2-оксотіолан-3-іліденметил)циклопропанкарбоксилат, біфентрин, бета-цифлутрин, цифлутрин, альфа-циперметрин, бета-циперметрин, біоалетрин, біоалетрин((S)-циклопентилізомер), біоресметрин, біфентрин, NCI-85193, циклопротрин, цигалотрин, цититрин, цифенотрин, дельтаметрин, емпентрин, есфенвалерат, етофенпрокс, фенфлутрин, фенпропатрин, фенвалерат, флуцитринат, флуметрин, флувалінат (D-ізомер), іміпротрин, цигалотрин, лямбда-цигалотрин, перметрин, фенотрин, пралетрин, піретрини (натуральні продукти), ресметрин, тетраметрин, трансфлутрин, тета-циперметрин, силафлуофен, тау-флювалінат, тефлутрин, тралометрин, зета-циперметрин.

Регулятори росту членистоногих: а) інгібітори синтезу хітину: бензоїлсечовини: хлорфлуазурон, дифлубензурон, флуазурон, флуциклоксурон, флуфеноксурон, гексафлумурон, люфенурон, новалурон, тефлубензурон, трифлумурон, бупрофезин, діофенолан, гекситіазокс, етоксазол, хлорфентазин; б) антагоністи екдизону: галофенозид, метоксифенозид, тебуфенозид; с) ювеноїди: пірипроксифен, метопрен (зокрема, S-метопрен), феноксикарб; d) інгібітори біосинтезу ліпідів: спіродиклофен.

Інші протипаразитарні засоби: ацеквіноцил, амітраз, AKD-1022, ANS-118, азадирахтин, *Bacillus thuringiensis*, бенсултап, біфеназат, бінапакрил, бромпропілат, BTG-504, BTG-505, камфехлор, картап, хлоробензилат, хлордимеформ, хлорфенапір, хромафенозид, клотіанідин, циромазин, діаклоден, діафентіурон, DBI-3204, динактин, дигідроксиметилдигідроксипіролідин, динобутон, динокап, ендосульфат, етипрол, етофенпрокс, феназаквін, флуміт, MTI-800, фенпіроксимат, флуакрипірим, флубензімін, флуброцитринат, флуфензин, флуфенпрокс, флупроксифен, галофенпрокс, гідраметилнон, IKI-220, канеміт, NC-196, нім гард, нідинортерфуран, нітенпірам, SD-35651, WL-108477, піридарил, пропаргіт, протрифенбут, піметрозин, піридабен, піримідифен, NC-1111, R-195, RH-0345, RH-2485, RYI-210, S-1283, S-1833, SI-8601, силафлуофен, силомадин, спіносад, тебуфенпірад, тетрадифон, тетранактин, тіаклопрід, тіоциклам, тіаметоксам, толфенпірад, триазамат, триетоксиспіносин, трінактин, вербутин, верталек, YI-5301.

Біологічні засоби: *Bacillus thuringiensis* ssp. *aizawai*, *kurstaki*, дельта-ендотоксин *Bacillus thuringiensis*, бакуловірус, ентомопатогенні бактерії, віруси та гриби.

Бактерициди: хлортетрациклін, окситетрациклін, стрептоміцин.

Інші біологічні засоби: енрофлосаксин, фебантел, пенетамат, молюксикам, цефалексин, канаміцин, пімобендан, кленбутерол, омепразол, тіамулін, беназеприл, пірипрол, цефквіном, флорфенікол, бусерелін, цефовецин, тулатроміцин, цефтіофур, карпрофен, метафлумізон, празиквантел, триклабендазол.

Інший аспект даного винаходу пов'язаний із застосуванням сполуки формули (I) або переважної окремої сполуки, визначеної вище, композиції, що містить щонайменше одну сполуку формули (I) або щонайменше одну переважну окрему сполуку, визначену вище, або фунгіцидної або інсектицидної суміші, що містить щонайменше одну сполуку формули (I) або щонайменше одну переважну окрему сполуку, визначену вище, у суміші з іншими фунгіцидами або інсектицидами, описаними вище, для контролю або попередження зараження рослин, наприклад корисних рослин, таких як культурні рослини, матеріалу для їх розмноження, наприклад насіння, зібраних сільськогосподарських культур, наприклад зібраних сільськогосподарських продовольчих культур або неживих матеріалів, комахами або фітопатогенними мікроорганізмами, переважно організмами, які являють собою гриби.

Додатковий аспект даного винаходу пов'язаний зі способом контролю або попередження зараження рослин, наприклад корисних рослин, таких як культурні рослини, матеріалу для їх розмноження, наприклад насіння, зібраних сільськогосподарських культур, наприклад зібраних сільськогосподарських продовольчих культур або неживих матеріалів, комахами, або фітопатогенними мікроорганізмами, або мікроорганізмами, що спричиняють псування, або організмами, що є потенційно шкідливими для людини, особливо організмами, які являють собою гриби, який включає застосування сполуки формули (I) або переважної окремої сполуки, визначеної вище, як активного інгредієнта щодо рослин, частин рослин або їхнього місця зростання, матеріалу для їх розмноження або щодо будь-якої частини неживих матеріалів.

Контроль або попередження означають зменшення зараження комахами, або фітопатогенними мікроорганізмами, або мікроорганізмами, що спричиняють псування, або організмами, потенційно шкідливими для людини, особливо організмами, що являють собою

гриби, до такого рівня, щоб було видно поліпшення.

Переважним способом контролю або попередження зараження культурних рослин фітопатогенними мікроорганізмами, особливо організмами, які являють собою гриби, або комахами, який включає застосування сполуки формули (I) або агрохімічної композиції, яка містить щонайменше одну з указаних сполук, є позакореневе застосування. Частота застосування і норма застосування будуть залежати від ризику зараження відповідним патогеном або комахою. Проте проникнення сполук формули (I) в рослину можна також забезпечувати через корені з ґрунту (системна дія) шляхом зрошення місця зростання рослини рідким складом або шляхом застосування сполук у твердій формі щодо ґрунту, наприклад у гранульованій формі (внесення в ґрунт). У сільськогосподарських культурах водяного рису такі грануляти можна застосовувати щодо залитого рисового поля. Сполуки формули (I) також можна застосовувати щодо насіння (нанесення покриття) шляхом просочування насіння або бульб або рідким складом фунгіциду або шляхом покривання їх твердим складом.

Склад, наприклад композицію, що містить сполуку формули (I) і, за потреби, тверду або рідку допоміжну речовину або мономери для інкапсуляції сполуки формули (I), можна одержати відомим способом, як правило шляхом ретельного перемішування і/або подрібнення сполуки з наповнювачами, наприклад розчинниками, твердими носіями і необов'язково поверхнево-активними сполуками (поверхнево-активними речовинами).

Переважні норми застосування зазвичай становлять від 5 г до 2 кг активного інгредієнта (а. і.) на гектар (га), переважно від 10 г до 1 кг а. і./га, найбільш переважно від 20 г до 600 г а. і./га. У разі застосування як засобу для просочення насіння зручні дози становлять від 10 мг до 1 г активної речовини на кг насіння.

Якщо комбінації за даним винаходом застосовують для обробки насіння, то зазвичай достатніми є норми застосування, що становлять від 0,001 до 50 г сполуки формули (I) на кг насіння, переважно від 0,01 до 10 г на кг насіння.

Композиції за даним винаходом можна використовувати в будь-якій традиційній формі, наприклад у формі здвоєної упаковки, порошку для сухої обробки насіння (DS), емульсії для обробки насіння (ES), текучого концентрату для обробки насіння (FS), розчину для обробки насіння (LS), порошку для обробки насіння, здатного до диспергування у воді (WS), капсульної суспензії для обробки насіння (CF), гелю для обробки насіння (GF), концентрату емульсії (EC), суспензійного концентрату (SC), суспоемульсії (SE), капсульної суспензії (CS), гранул, здатних до диспергування у воді (WG), гранул, здатних до емульгування (EG), емульсії типу "вода-в-маслі" (EO), емульсії типу "масло-у-воді" (EW), мікроемульсії (ME), масляної дисперсії (OD), текучої речовини, здатної до змішування з маслом (OF), рідини, здатної до змішування з маслом (OL), розчинного концентрату (SL), суспензії надмалого об'єму (SU), рідини надмалого об'єму (UL), технічного концентрату (TK), концентрату, здатного до диспергування (DC), змочуваного порошку (WP) або будь-якого технічно здійсненого складу в поєднанні з прийнятними для сільського господарства допоміжними речовинами.

Такі композиції можуть бути одержані традиційним способом, наприклад шляхом змішування активних інгредієнтів із відповідними інертними компонентами складу (розріджувачами, розчинниками, наповнювачами і необов'язково іншими інгредієнтами складу, такими як поверхнево-активні речовини, біоциди, антифризи, клейкі речовини, загусники і сполуки, які забезпечують допоміжні ефекти). Якщо необхідна тривала дія, то можна застосовувати також традиційні склади повільного вивільнення. Зокрема, склади для застосування у формах для розпилення, такі як концентрати, здатні до диспергування у воді (наприклад, EC, SC, DC, OD, SE, EW, EO тощо), змочувані порошки і гранули, можуть містити поверхнево-активні речовини, такі як змочувальні та диспергувальні засоби та інші сполуки, які забезпечують допоміжні ефекти, наприклад продукт конденсації формальдегіду з нафталінсульфонатом, алкіларилсульфонат, лігнінсульфонат, алкілсульфат жирної кислоти та етоксильований алкілфенол й етоксильований жирний спирт.

Склад для протравлювання насіння застосовують способом, відомим per se, щодо насіння із використанням комбінації за даним винаходом і розріджувача у прийнятній формі складу для протравлювання насіння, наприклад, у формі водної суспензії або у формі сухого порошку, що характеризуються гарним прилипанням до насіння. Такі склади для протравлювання насіння відомі з рівня техніки. Склади для протравлювання насіння можуть містити окремі активні інгредієнти або комбінацію активних інгредієнтів в інкапсульованій формі, наприклад, у вигляді капсул або мікрокапсул повільного вивільнення.

Загалом склади містять від 0,01 до 90 % за вагою активного засобу, від 0 до 20 % прийнятної для сільського господарства поверхнево-активної речовини та від 10 до 99,99 % твердих або рідких інертних компонентів складу та допоміжної(-их) речовини(речовин), при

цьому активний засіб складається щонайменше зі сполуки формули (I) разом із компонентом (B) і (C) та необов'язково інших активних засобів, зокрема мікробіоцидів або консервантів тощо. Концентровані форми композицій зазвичай містять від приблизно 2 до 80 %, переважно від приблизно 5 до 70 % за вагою активного засобу. Застосовувані форми складу можуть, наприклад, містити від 0,01 до 20 % за вагою, переважно від 0,01 до 5 % за вагою активного засобу. Оскільки комерційні продукти переважно будуть складені у вигляді концентратів, споживач буде зазвичай використовувати розведені складу.

У таблиці 1 нижче проілюстровані приклади окремих сполук формули (I) згідно з даним винаходом.

Таблиця 1

Окремі сполуки формули (I) згідно з даним винаходом

№ сполуки	X	Y	R ²	R ¹	№ сполуки	X	Y	R ²	R ¹
1	CH	CH	Cl	H	411	N	CH	Cl	CH ₂ OCH ₃
2	CH	CH	Cl	CH ₃	412	N	CH	Cl	CH(CH ₃)OCH ₃
3	CH	CH	Cl	CH ₂ CH ₃	413	N	CH	Cl	C(CH ₃) ₂ OCH ₃
4	CH	CH	Cl	OCH ₃	414	N	CH	Cl	CH ₂ F
5	CH	CH	Cl	OCH ₂ CH ₃	415	N	CH	Cl	CH ₂ Cl
6	CH	CH	Cl	CH ₂ OCH ₃	416	N	CH	Cl	CH ₂ Br
7	CH	CH	Cl	CH(CH ₃)OCH ₃	417	N	CH	Cl	CH ₂ CF ₃
8	CH	CH	Cl	C(CH ₃) ₂ OCH ₃	418	N	CH	Cl	CH ₂ CO ₂ CH ₃
9	CH	CH	Cl	CH ₂ F	419	N	CH	Cl	CH ₂ CH ₂ CO ₂ CH ₃
10	CH	CH	Cl	CH ₂ Cl	420	N	CH	Cl	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CO ₂ CH ₃
11	CH	CH	Cl	CH ₂ Br	421	N	CH	Cl	циклопропіл
12	CH	CH	Cl	CH ₂ CF ₃	422	N	CH	Cl	CO ₂ CH ₃
13	CH	CH	Cl	CH ₂ CO ₂ CH ₃	423	N	CH	Cl	CO ₂ CH ₂ CH ₃
14	CH	CH	Cl	CH ₂ CH ₂ CO ₂ CH ₃	424	N	CH	Cl	Ph
15	CH	CH	Cl	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CO ₂ CH ₃	425	N	CH	Cl	2-фураніл
16	CH	CH	Cl	циклопропіл	426	N	CH	Cl	2-тіофеніл
17	CH	CH	Cl	CO ₂ CH ₃	427	N	CH	Cl	OPh
18	CH	CH	Cl	CO ₂ CH ₂ CH ₃	428	N	CH	Cl	OCH ₂ CCH
19	CH	CH	Cl	Ph	429	N	CH	Cl	OCH ₂ CH ₂ OCH ₃
20	CH	CH	Cl	2-фураніл	430	N	CH	Cl	SCH ₃
21	CH	CH	Cl	2-тіофеніл	431	N	CH	Cl	SCH ₂ CH ₃
22	CH	CH	Cl	OPh	432	N	CH	Cl	SCH(CH ₃) ₂
23	CH	CH	Cl	OCH ₂ CCH	433	N	CH	Br	H
24	CH	CH	Cl	OCH ₂ CH ₂ OCH ₃	434	N	CH	Br	CH ₃
25	CH	CH	Cl	SCH ₃	435	N	CH	Br	CH ₂ CH ₃
26	CH	CH	Cl	SCH ₂ CH ₃	436	N	CH	Br	OCH ₃
27	CH	CH	Cl	SCH(CH ₃) ₂	437	N	CH	Br	OCH ₂ CH ₃
28	CH	CH	Br	H	438	N	CH	Br	CH ₂ OCH ₃
29	CH	CH	Br	CH ₃	439	N	CH	Br	CH(CH ₃)OCH ₃
30	CH	CH	Br	CH ₂ CH ₃	440	N	CH	Br	C(CH ₃) ₂ OCH ₃
31	CH	CH	Br	OCH ₃	441	N	CH	Br	CH ₂ F
32	CH	CH	Br	OCH ₂ CH ₃	442	N	CH	Br	CH ₂ Cl
33	CH	CH	Br	CH ₂ OCH ₃	443	N	CH	Br	CH ₂ Br
34	CH	CH	Br	CH(CH ₃)OCH ₃	444	N	CH	Br	CH ₂ CF ₃
35	CH	CH	Br	C(CH ₃) ₂ OCH ₃	445	N	CH	Br	CH ₂ CO ₂ CH ₃
36	CH	CH	Br	CH ₂ F	446	N	CH	Br	CH ₂ CH ₂ CO ₂ CH ₃
37	CH	CH	Br	CH ₂ Cl	447	N	CH	Br	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CO ₂ CH ₃
38	CH	CH	Br	CH ₂ Br	448	N	CH	Br	циклопропіл
39	CH	CH	Br	CH ₂ CF ₃	449	N	CH	Br	CO ₂ CH ₃
40	CH	CH	Br	CH ₂ CO ₂ CH ₃	450	N	CH	Br	CO ₂ CH ₂ CH ₃
41	CH	CH	Br	CH ₂ CH ₂ CO ₂ CH ₃	451	N	CH	Br	Ph
42	CH	CH	Br	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CO ₂ CH ₃	452	N	CH	Br	2-фураніл

Окремі сполуки формули (I) згідно з даним винаходом

№ сполуки	X	Y	R ²	R ¹	№ сполуки	X	Y	R ²	R ¹
43	CH	CH	Br	циклопропіл	453	N	CH	Br	2-тіофеніл
44	CH	CH	Br	CO ₂ CH ₃	454	N	CH	Br	OPh
45	CH	CH	Br	CO ₂ CH ₂ CH ₃	455	N	CH	Br	OCH ₂ CCH
46	CH	CH	Br	Ph	456	N	CH	Br	OCH ₂ CH ₂ OCH ₃
47	CH	CH	Br	2-фураніл	457	N	CH	Br	SCH ₃
48	CH	CH	Br	2-тіофеніл	458	N	CH	Br	SCH ₂ CH ₃
49	CH	CH	Br	OPh	459	N	CH	Br	SCH(CH ₃) ₂
50	CH	CH	Br	OCH ₂ CCH	460	N	CH	CH ₃	H
51	CH	CH	Br	OCH ₂ CH ₂ OCH ₃	461	N	CH	CH ₃	CH ₃
52	CH	CH	Br	SCH ₃	462	N	CH	CH ₃	CH ₂ CH ₃
53	CH	CH	Br	SCH ₂ CH ₃	463	N	CH	CH ₃	OCH ₃
54	CH	CH	Br	SCH(CH ₃) ₂	464	N	CH	CH ₃	OCH ₂ CH ₃
55	CH	CH	CH ₃	H	465	N	CH	CH ₃	CH ₂ OCH ₃
56	CH	CH	CH ₃	CH ₃	466	N	CH	CH ₃	CH(CH ₃)OCH ₃
57	CH	CH	CH ₃	CH ₂ CH ₃	467	N	CH	CH ₃	C(CH ₃) ₂ OCH ₃
58	CH	CH	CH ₃	OCH ₃	468	N	CH	CH ₃	CH ₂ F
59	CH	CH	CH ₃	OCH ₂ CH ₃	469	N	CH	CH ₃	CH ₂ Cl
60	CH	CH	CH ₃	CH ₂ OCH ₃	470	N	CH	CH ₃	CH ₂ Br
61	CH	CH	CH ₃	CH(CH ₃)OCH ₃	471	N	CH	CH ₃	CH ₂ CF ₃
62	CH	CH	CH ₃	C(CH ₃) ₂ OCH ₃	472	N	CH	CH ₃	CH ₂ CO ₂ CH ₃
63	CH	CH	CH ₃	CH ₂ F	473	N	CH	CH ₃	CH ₂ CH ₂ CO ₂ CH ₃
64	CH	CH	CH ₃	CH ₂ Cl	474	N	CH	CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CO ₂ CH ₃
65	CH	CH	CH ₃	CH ₂ Br	475	N	CH	CH ₃	циклопропіл
66	CH	CH	CH ₃	CH ₂ CF ₃	476	N	CH	CH ₃	CO ₂ CH ₃
67	CH	CH	CH ₃	CH ₂ CO ₂ CH ₃	477	N	CH	CH ₃	CO ₂ CH ₂ CH ₃
68	CH	CH	CH ₃	CH ₂ CH ₂ CO ₂ CH ₃	478	N	CH	CH ₃	Ph
69	CH	CH	CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CO ₂ CH ₃	479	N	CH	CH ₃	2-фураніл
70	CH	CH	CH ₃	циклопропіл	480	N	CH	CH ₃	2-тіофеніл
71	CH	CH	CH ₃	CO ₂ CH ₃	481	N	CH	CH ₃	OPh
72	CH	CH	CH ₃	CO ₂ CH ₂ CH ₃	482	N	CH	CH ₃	OCH ₂ CCH
73	CH	CH	CH ₃	Ph	483	N	CH	CH ₃	OCH ₂ CH ₂ OCH ₃
74	CH	CH	CH ₃	2-фураніл	484	N	CH	CH ₃	SCH ₃
75	CH	CH	CH ₃	2-тіофеніл	485	N	CH	CH ₃	SCH ₂ CH ₃
76	CH	CH	CH ₃	OPh	486	N	CH	CH ₃	SCH(CH ₃) ₂
77	CH	CH	CH ₃	OCH ₂ CCH	487	N	CH	OCH ₃	H
78	CH	CH	CH ₃	OCH ₂ CH ₂ OCH ₃	488	N	CH	OCH ₃	CH ₃
79	CH	CH	CH ₃	SCH ₃	489	N	CH	OCH ₃	CH ₂ CH ₃
80	CH	CH	CH ₃	SCH ₂ CH ₃	490	N	CH	OCH ₃	OCH ₃
81	CH	CH	CH ₃	SCH(CH ₃) ₂	491	N	CH	OCH ₃	OCH ₂ CH ₃
82	CH	CH	OCH ₃	H	492	N	CH	OCH ₃	CH ₂ OCH ₃
83	CH	CH	OCH ₃	CH ₃	493	N	CH	OCH ₃	CH(CH ₃)OCH ₃
84	CH	CH	OCH ₃	CH ₂ CH ₃	494	N	CH	OCH ₃	C(CH ₃) ₂ OCH ₃
85	CH	CH	OCH ₃	OCH ₃	495	N	CH	OCH ₃	CH ₂ F
86	CH	CH	OCH ₃	OCH ₂ CH ₃	496	N	CH	OCH ₃	CH ₂ Cl
87	CH	CH	OCH ₃	CH ₂ OCH ₃	497	N	CH	OCH ₃	CH ₂ Br
88	CH	CH	OCH ₃	CH(CH ₃)OCH ₃	498	N	CH	OCH ₃	CH ₂ CF ₃
89	CH	CH	OCH ₃	C(CH ₃) ₂ OCH ₃	499	N	CH	OCH ₃	CH ₂ CO ₂ CH ₃
90	CH	CH	OCH ₃	CH ₂ F	500	N	CH	OCH ₃	CH ₂ CH ₂ CO ₂ CH ₃
91	CH	CH	OCH ₃	CH ₂ Cl	501	N	CH	OCH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CO ₂ CH ₃
92	CH	CH	OCH ₃	CH ₂ Br	502	N	CH	OCH ₃	циклопропіл
93	CH	CH	OCH ₃	CH ₂ CF ₃	503	N	CH	OCH ₃	CO ₂ CH ₃
94	CH	CH	OCH ₃	CH ₂ CO ₂ CH ₃	504	N	CH	OCH ₃	CO ₂ CH ₂ CH ₃

Таблиця 1

Окремі сполуки формули (I) згідно з даним винаходом

№ сполуки	X	Y	R ²	R ¹	№ сполуки	X	Y	R ²	R ¹
95	CH	CH	OCH ₃	CH ₂ CH ₂ CO ₂ CH ₃	505	N	CH	OCH ₃	Ph
96	CH	CH	OCH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CO ₂ CH ₃	506	N	CH	OCH ₃	2-фураніл
97	CH	CH	OCH ₃	циклопропіл	507	N	CH	OCH ₃	2-тіофеніл
98	CH	CH	OCH ₃	CO ₂ CH ₃	508	N	CH	OCH ₃	OPh
99	CH	CH	OCH ₃	CO ₂ CH ₂ CH ₃	509	N	CH	OCH ₃	OCH ₂ CCH
100	CH	CH	OCH ₃	Ph	510	N	CH	OCH ₃	OCH ₂ CH ₂ OCH ₃
101	CH	CH	OCH ₃	2-фураніл	511	N	CH	OCH ₃	SCH ₃
102	CH	CH	OCH ₃	2-тіофеніл	512	N	CH	OCH ₃	SCH ₂ CH ₃
103	CH	CH	OCH ₃	OPh	513	N	CH	OCH ₃	SCH(CH ₃) ₂
104	CH	CH	OCH ₃	OCH ₂ CCH	514	N	CH	NHCHO	H
105	CH	CH	OCH ₃	OCH ₂ CH ₂ OCH ₃	515	N	CH	NHCHO	CH ₃
106	CH	CH	OCH ₃	SCH ₃	516	N	CH	NHCHO	CH ₂ CH ₃
107	CH	CH	OCH ₃	SCH ₂ CH ₃	517	N	CH	NHCHO	OCH ₃
108	CH	CH	OCH ₃	SCH(CH ₃) ₂	518	N	CH	NHCHO	OCH ₂ CH ₃
109	CH	CH	NHCHO	H	519	N	CH	NHCHO	CH ₂ OCH ₃
110	CH	CH	NHCHO	CH ₃	520	N	CH	NHCHO	CH(CH ₃)OCH ₃
111	CH	CH	NHCHO	CH ₂ CH ₃	521	N	CH	NHCHO	C(CH ₃) ₂ OCH ₃
112	CH	CH	NHCHO	OCH ₃	522	N	CH	NHCHO	CH ₂ F
113	CH	CH	NHCHO	OCH ₂ CH ₃	523	N	CH	NHCHO	CH ₂ Cl
114	CH	CH	NHCHO	CH ₂ OCH ₃	524	N	CH	NHCHO	CH ₂ Br
115	CH	CH	NHCHO	CH(CH ₃)OCH ₃	525	N	CH	NHCHO	CH ₂ CF ₃
116	CH	CH	NHCHO	C(CH ₃) ₂ OCH ₃	526	N	CH	NHCHO	CH ₂ CO ₂ CH ₃
117	CH	CH	NHCHO	CH ₂ F	527	N	CH	NHCHO	CH ₂ CH ₂ CO ₂ CH ₃
118	CH	CH	NHCHO	CH ₂ Cl	528	N	CH	NHCHO	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CO ₂ CH ₃
119	CH	CH	NHCHO	CH ₂ Br	529	N	CH	NHCHO	циклопропіл
120	CH	CH	NHCHO	CH ₂ CF ₃	530	N	CH	NHCHO	CO ₂ CH ₃
121	CH	CH	NHCHO	CH ₂ CO ₂ CH ₃	531	N	CH	NHCHO	CO ₂ CH ₂ CH ₃
122	CH	CH	NHCHO	CH ₂ CH ₂ CO ₂ CH ₃	532	N	CH	NHCHO	Ph
123	CH	CH	NHCHO	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CO ₂ CH ₃	533	N	CH	NHCHO	2-фураніл
124	CH	CH	NHCHO	циклопропіл	534	N	CH	NHCHO	2-тіофеніл
125	CH	CH	NHCHO	CO ₂ CH ₃	535	N	CH	NHCHO	OPh
126	CH	CH	NHCHO	CO ₂ CH ₂ CH ₃	536	N	CH	NHCHO	OCH ₂ CCH
127	CH	CH	NHCHO	Ph	537	N	CH	NHCHO	OCH ₂ CH ₂ OCH ₃
128	CH	CH	NHCHO	2-фураніл	538	N	CH	NHCHO	SCH ₃
129	CH	CH	NHCHO	2-тіофеніл	539	N	CH	NHCHO	SCH ₂ CH ₃
130	CH	CH	NHCHO	OPh	540	N	CH	NHCHO	SCH(CH ₃) ₂
131	CH	CH	NHCHO	OCH ₂ CCH	541	N	CF	Cl	H
132	CH	CH	NHCHO	OCH ₂ CH ₂ OCH ₃	542	N	CF	Cl	CH ₃
133	CH	CH	NHCHO	SCH ₃	543	N	CF	Cl	CH ₂ CH ₃
134	CH	CH	NHCHO	SCH ₂ CH ₃	544	N	CF	Cl	OCH ₃
135	CH	CH	NHCHO	SCH(CH ₃) ₂	545	N	CF	Cl	OCH ₂ CH ₃
136	CH	CF	Cl	H	546	N	CF	Cl	CH ₂ OCH ₃
137	CH	CF	Cl	CH ₃	547	N	CF	Cl	CH(CH ₃)OCH ₃
138	CH	CF	Cl	CH ₂ CH ₃	548	N	CF	Cl	C(CH ₃) ₂ OCH ₃
139	CH	CF	Cl	OCH ₃	549	N	CF	Cl	CH ₂ F
140	CH	CF	Cl	OCH ₂ CH ₃	550	N	CF	Cl	CH ₂ Cl
141	CH	CF	Cl	CH ₂ OCH ₃	551	N	CF	Cl	CH ₂ Br
142	CH	CF	Cl	CH(CH ₃)OCH ₃	552	N	CF	Cl	CH ₂ CF ₃
143	CH	CF	Cl	C(CH ₃) ₂ OCH ₃	553	N	CF	Cl	CH ₂ CO ₂ CH ₃
144	CH	CF	Cl	CH ₂ F	554	N	CF	Cl	CH ₂ CH ₂ CO ₂ CH ₃
145	CH	CF	Cl	CH ₂ Cl	555	N	CF	Cl	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CO ₂ CH ₃
146	CH	CF	Cl	CH ₂ Br	556	N	CF	Cl	циклопропіл

Таблиця 1

Окремі сполуки формули (I) згідно з даним винаходом

№ сполуки	X	Y	R ²	R ¹	№ сполуки	X	Y	R ²	R ¹
147	CH	CF	Cl	CH ₂ CF ₃	557	N	CF	Cl	CO ₂ CH ₃
148	CH	CF	Cl	CH ₂ CO ₂ CH ₃	558	N	CF	Cl	CO ₂ CH ₂ CH ₃
149	CH	CF	Cl	CH ₂ CH ₂ CO ₂ CH ₃	559	N	CF	Cl	Ph
150	CH	CF	Cl	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CO ₂ CH ₃	560	N	CF	Cl	2-фураніл
151	CH	CF	Cl	циклопропіл	561	N	CF	Cl	2-тіофеніл
152	CH	CF	Cl	CO ₂ CH ₃	562	N	CF	Cl	OPh
153	CH	CF	Cl	CO ₂ CH ₂ CH ₃	563	N	CF	Cl	OCH ₂ CCH
154	CH	CF	Cl	Ph	564	N	CF	Cl	OCH ₂ CH ₂ OCH ₃
155	CH	CF	Cl	2-фураніл	565	N	CF	Cl	SCH ₃
156	CH	CF	Cl	2-тіофеніл	566	N	CF	Cl	SCH ₂ CH ₃
157	CH	CF	Cl	OPh	567	N	CF	Cl	SCH(CH ₃) ₂
158	CH	CF	Cl	OCH ₂ CCH	568	N	CF	Br	H
159	CH	CF	Cl	OCH ₂ CH ₂ OCH ₃	569	N	CF	Br	CH ₃
160	CH	CF	Cl	SCH ₃	570	N	CF	Br	CH ₂ CH ₃
161	CH	CF	Cl	SCH ₂ CH ₃	571	N	CF	Br	OCH ₃
162	CH	CF	Cl	SCH(CH ₃) ₂	572	N	CF	Br	OCH ₂ CH ₃
163	CH	CF	Br	H	573	N	CF	Br	CH ₂ OCH ₃
164	CH	CF	Br	CH ₃	574	N	CF	Br	CH(CH ₃)OCH ₃
165	CH	CF	Br	CH ₂ CH ₃	575	N	CF	Br	C(CH ₃) ₂ OCH ₃
166	CH	CF	Br	OCH ₃	576	N	CF	Br	CH ₂ F
167	CH	CF	Br	OCH ₂ CH ₃	577	N	CF	Br	CH ₂ Cl
168	CH	CF	Br	CH ₂ OCH ₃	578	N	CF	Br	CH ₂ Br
169	CH	CF	Br	CH(CH ₃)OCH ₃	579	N	CF	Br	CH ₂ CF ₃
170	CH	CF	Br	C(CH ₃) ₂ OCH ₃	580	N	CF	Br	CH ₂ CO ₂ CH ₃
171	CH	CF	Br	CH ₂ F	581	N	CF	Br	CH ₂ CH ₂ CO ₂ CH ₃
172	CH	CF	Br	CH ₂ Cl	582	N	CF	Br	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CO ₂ CH ₃
173	CH	CF	Br	CH ₂ Br	583	N	CF	Br	циклопропіл
174	CH	CF	Br	CH ₂ CF ₃	584	N	CF	Br	CO ₂ CH ₃
175	CH	CF	Br	CH ₂ CO ₂ CH ₃	585	N	CF	Br	CO ₂ CH ₂ CH ₃
176	CH	CF	Br	CH ₂ CH ₂ CO ₂ CH ₃	586	N	CF	Br	Ph
177	CH	CF	Br	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CO ₂ CH ₃	587	N	CF	Br	2-фураніл
178	CH	CF	Br	циклопропіл	588	N	CF	Br	2-тіофеніл
179	CH	CF	Br	CO ₂ CH ₃	589	N	CF	Br	OPh
180	CH	CF	Br	CO ₂ CH ₂ CH ₃	590	N	CF	Br	OCH ₂ CCH
181	CH	CF	Br	Ph	591	N	CF	Br	OCH ₂ CH ₂ OCH ₃
182	CH	CF	Br	2-фураніл	592	N	CF	Br	SCH ₃
183	CH	CF	Br	2-тіофеніл	593	N	CF	Br	SCH ₂ CH ₃
184	CH	CF	Br	OPh	594	N	CF	Br	SCH(CH ₃) ₂
185	CH	CF	Br	OCH ₂ CCH	595	N	CF	CH ₃	H
186	CH	CF	Br	OCH ₂ CH ₂ OCH ₃	596	N	CF	CH ₃	CH ₃
187	CH	CF	Br	SCH ₃	597	N	CF	CH ₃	CH ₂ CH ₃
188	CH	CF	Br	SCH ₂ CH ₃	598	N	CF	CH ₃	OCH ₃
189	CH	CF	Br	SCH(CH ₃) ₂	599	N	CF	CH ₃	OCH ₂ CH ₃
190	CH	CF	CH ₃	H	600	N	CF	CH ₃	CH ₂ OCH ₃
191	CH	CF	CH ₃	CH ₃	601	N	CF	CH ₃	CH(CH ₃)OCH ₃
192	CH	CF	CH ₃	CH ₂ CH ₃	602	N	CF	CH ₃	C(CH ₃) ₂ OCH ₃
193	CH	CF	CH ₃	OCH ₃	603	N	CF	CH ₃	CH ₂ F
194	CH	CF	CH ₃	OCH ₂ CH ₃	604	N	CF	CH ₃	CH ₂ Cl
195	CH	CF	CH ₃	CH ₂ OCH ₃	605	N	CF	CH ₃	CH ₂ Br
196	CH	CF	CH ₃	CH(CH ₃)OCH ₃	606	N	CF	CH ₃	CH ₂ CF ₃
197	CH	CF	CH ₃	C(CH ₃) ₂ OCH ₃	607	N	CF	CH ₃	CH ₂ CO ₂ CH ₃
198	CH	CF	CH ₃	CH ₂ F	608	N	CF	CH ₃	CH ₂ CH ₂ CO ₂ CH ₃

Таблиця 1

Окремі сполуки формули (I) згідно з даним винаходом

№ сполуки	X	Y	R ²	R ¹	№ сполуки	X	Y	R ²	R ¹
199	CH	CF	CH ₃	CH ₂ Cl	609	N	CF	CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CO ₂ CH ₃
200	CH	CF	CH ₃	CH ₂ Br	610	N	CF	CH ₃	циклопропіл
201	CH	CF	CH ₃	CH ₂ CF ₃	611	N	CF	CH ₃	CO ₂ CH ₃
202	CH	CF	CH ₃	CH ₂ CO ₂ CH ₃	612	N	CF	CH ₃	CO ₂ CH ₂ CH ₃
203	CH	CF	CH ₃	CH ₂ CH ₂ CO ₂ CH ₃	613	N	CF	CH ₃	Ph
204	CH	CF	CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CO ₂ CH ₃	614	N	CF	CH ₃	2-фураніл
205	CH	CF	CH ₃	циклопропіл	615	N	CF	CH ₃	2-тіофеніл
206	CH	CF	CH ₃	CO ₂ CH ₃	616	N	CF	CH ₃	OPh
207	CH	CF	CH ₃	CO ₂ CH ₂ CH ₃	617	N	CF	CH ₃	OCH ₂ CCH
208	CH	CF	CH ₃	Ph	618	N	CF	CH ₃	OCH ₂ CH ₂ OCH ₃
209	CH	CF	CH ₃	2-фураніл	619	N	CF	CH ₃	SCH ₃
210	CH	CF	CH ₃	2-тіофеніл	620	N	CF	CH ₃	SCH ₂ CH ₃
211	CH	CF	CH ₃	OPh	621	N	CF	CH ₃	SCH(CH ₃) ₂
212	CH	CF	CH ₃	OCH ₂ CCH	622	N	CF	OCH ₃	H
213	CH	CF	CH ₃	OCH ₂ CH ₂ OCH ₃	623	N	CF	OCH ₃	CH ₃
214	CH	CF	CH ₃	SCH ₃	624	N	CF	OCH ₃	CH ₂ CH ₃
215	CH	CF	CH ₃	SCH ₂ CH ₃	625	N	CF	OCH ₃	OCH ₃
216	CH	CF	CH ₃	SCH(CH ₃) ₂	626	N	CF	OCH ₃	OCH ₂ CH ₃
217	CH	CF	OCH ₃	H	627	N	CF	OCH ₃	CH ₂ OCH ₃
218	CH	CF	OCH ₃	CH ₃	628	N	CF	OCH ₃	CH(CH ₃)OCH ₃
219	CH	CF	OCH ₃	CH ₂ CH ₃	629	N	CF	OCH ₃	C(CH ₃) ₂ OCH ₃
220	CH	CF	OCH ₃	OCH ₃	630	N	CF	OCH ₃	CH ₂ F
221	CH	CF	OCH ₃	OCH ₂ CH ₃	631	N	CF	OCH ₃	CH ₂ Cl
222	CH	CF	OCH ₃	CH ₂ OCH ₃	632	N	CF	OCH ₃	CH ₂ Br
223	CH	CF	OCH ₃	CH(CH ₃)OCH ₃	633	N	CF	OCH ₃	CH ₂ CF ₃
224	CH	CF	OCH ₃	C(CH ₃) ₂ OCH ₃	634	N	CF	OCH ₃	CH ₂ CO ₂ CH ₃
225	CH	CF	OCH ₃	CH ₂ F	635	N	CF	OCH ₃	CH ₂ CH ₂ CO ₂ CH ₃
226	CH	CF	OCH ₃	CH ₂ Cl	636	N	CF	OCH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CO ₂ CH ₃
227	CH	CF	OCH ₃	CH ₂ Br	637	N	CF	OCH ₃	циклопропіл
228	CH	CF	OCH ₃	CH ₂ CF ₃	638	N	CF	OCH ₃	CO ₂ CH ₃
229	CH	CF	OCH ₃	CH ₂ CO ₂ CH ₃	639	N	CF	OCH ₃	CO ₂ CH ₂ CH ₃
230	CH	CF	OCH ₃	CH ₂ CH ₂ CO ₂ CH ₃	640	N	CF	OCH ₃	Ph
231	CH	CF	OCH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CO ₂ CH ₃	641	N	CF	OCH ₃	2-фураніл
232	CH	CF	OCH ₃	циклопропіл	642	N	CF	OCH ₃	2-тіофеніл
233	CH	CF	OCH ₃	CO ₂ CH ₃	643	N	CF	OCH ₃	OPh
234	CH	CF	OCH ₃	CO ₂ CH ₂ CH ₃	644	N	CF	OCH ₃	OCH ₂ CCH
235	CH	CF	OCH ₃	Ph	645	N	CF	OCH ₃	OCH ₂ CH ₂ OCH ₃
236	CH	CF	OCH ₃	2-фураніл	646	N	CF	OCH ₃	SCH ₃
237	CH	CF	OCH ₃	2-тіофеніл	647	N	CF	OCH ₃	SCH ₂ CH ₃
238	CH	CF	OCH ₃	OPh	648	N	CF	OCH ₃	SCH(CH ₃) ₂
239	CH	CF	OCH ₃	OCH ₂ CCH	649	N	CF	NHCHO	H
240	CH	CF	OCH ₃	OCH ₂ CH ₂ OCH ₃	650	N	CF	NHCHO	CH ₃
241	CH	CF	OCH ₃	SCH ₃	651	N	CF	NHCHO	CH ₂ CH ₃
242	CH	CF	OCH ₃	SCH ₂ CH ₃	652	N	CF	NHCHO	OCH ₃
243	CH	CF	OCH ₃	SCH(CH ₃) ₂	653	N	CF	NHCHO	OCH ₂ CH ₃
244	CH	CF	NHCHO	H	654	N	CF	NHCHO	CH ₂ OCH ₃
245	CH	CF	NHCHO	CH ₃	655	N	CF	NHCHO	CH(CH ₃)OCH ₃
246	CH	CF	NHCHO	CH ₂ CH ₃	656	N	CF	NHCHO	C(CH ₃) ₂ OCH ₃
247	CH	CF	NHCHO	OCH ₃	657	N	CF	NHCHO	CH ₂ F
248	CH	CF	NHCHO	OCH ₂ CH ₃	658	N	CF	NHCHO	CH ₂ Cl
249	CH	CF	NHCHO	CH ₂ OCH ₃	659	N	CF	NHCHO	CH ₂ Br
250	CH	CF	NHCHO	CH(CH ₃)OCH ₃	660	N	CF	NHCHO	CH ₂ CF ₃

Таблиця 1

Окремі сполуки формули (I) згідно з даним винаходом

№ сполуки	X	Y	R ²	R ¹	№ сполуки	X	Y	R ²	R ¹
251	CH	CF	NHCHO	C(CH ₃) ₂ OCH ₃	661	N	CF	NHCHO	CH ₂ CO ₂ CH ₃
252	CH	CF	NHCHO	CH ₂ F	662	N	CF	NHCHO	CH ₂ CH ₂ CO ₂ CH ₃
253	CH	CF	NHCHO	CH ₂ Cl	663	N	CF	NHCHO	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CO ₂ CH ₃
254	CH	CF	NHCHO	CH ₂ Br	664	N	CF	NHCHO	циклопропіл
255	CH	CF	NHCHO	CH ₂ CF ₃	665	N	CF	NHCHO	CO ₂ CH ₃
256	CH	CF	NHCHO	CH ₂ CO ₂ CH ₃	666	N	CF	NHCHO	CO ₂ CH ₂ CH ₃
257	CH	CF	NHCHO	CH ₂ CH ₂ CO ₂ CH ₃	667	N	CF	NHCHO	Ph
258	CH	CF	NHCHO	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CO ₂ CH ₃	668	N	CF	NHCHO	2-фураніл
259	CH	CF	NHCHO	циклопропіл	669	N	CF	NHCHO	2-тіофеніл
260	CH	CF	NHCHO	CO ₂ CH ₃	670	N	CF	NHCHO	OPh
261	CH	CF	NHCHO	CO ₂ CH ₂ CH ₃	671	N	CF	NHCHO	OCH ₂ CCH
262	CH	CF	NHCHO	Ph	672	N	CF	NHCHO	OCH ₂ CH ₂ OCH ₃
263	CH	CF	NHCHO	2-фураніл	673	N	CF	NHCHO	SCH ₃
264	CH	CF	NHCHO	2-тіофеніл	674	N	CF	NHCHO	SCH ₂ CH ₃
265	CH	CF	NHCHO	OPh	675	N	CF	NHCHO	SCH(CH ₃) ₂
266	CH	CF	NHCHO	OCH ₂ CCH	676	N	N	Cl	H
267	CH	CF	NHCHO	OCH ₂ CH ₂ OCH ₃	677	N	N	Cl	CH ₃
268	CH	CF	NHCHO	SCH ₃	678	N	N	Cl	CH ₂ CH ₃
269	CH	CF	NHCHO	SCH ₂ CH ₃	679	N	N	Cl	OCH ₃
270	CH	CF	NHCHO	SCH(CH ₃) ₂	680	N	N	Cl	OCH ₂ CH ₃
271	CH	N	Cl	H	681	N	N	Cl	CH ₂ OCH ₃
272	CH	N	Cl	CH ₃	682	N	N	Cl	CH(CH ₃)OCH ₃
273	CH	N	Cl	CH ₂ CH ₃	683	N	N	Cl	C(CH ₃) ₂ OCH ₃
274	CH	N	Cl	OCH ₃	684	N	N	Cl	CH ₂ F
275	CH	N	Cl	OCH ₂ CH ₃	685	N	N	Cl	CH ₂ Cl
276	CH	N	Cl	CH ₂ OCH ₃	686	N	N	Cl	CH ₂ Br
277	CH	N	Cl	CH(CH ₃)OCH ₃	687	N	N	Cl	CH ₂ CF ₃
278	CH	N	Cl	C(CH ₃) ₂ OCH ₃	688	N	N	Cl	CH ₂ CO ₂ CH ₃
279	CH	N	Cl	CH ₂ F	689	N	N	Cl	CH ₂ CH ₂ CO ₂ CH ₃
280	CH	N	Cl	CH ₂ Cl	690	N	N	Cl	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CO ₂ CH ₃
281	CH	N	Cl	CH ₂ Br	691	N	N	Cl	циклопропіл
282	CH	N	Cl	CH ₂ CF ₃	692	N	N	Cl	CO ₂ CH ₃
283	CH	N	Cl	CH ₂ CO ₂ CH ₃	693	N	N	Cl	CO ₂ CH ₂ CH ₃
284	CH	N	Cl	CH ₂ CH ₂ CO ₂ CH ₃	694	N	N	Cl	Ph
285	CH	N	Cl	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CO ₂ CH ₃	695	N	N	Cl	2-фураніл
286	CH	N	Cl	циклопропіл	696	N	N	Cl	2-тіофеніл
287	CH	N	Cl	CO ₂ CH ₃	697	N	N	Cl	OPh
288	CH	N	Cl	CO ₂ CH ₂ CH ₃	698	N	N	Cl	OCH ₂ CCH
289	CH	N	Cl	Ph	699	N	N	Cl	OCH ₂ CH ₂ OCH ₃
290	CH	N	Cl	2-фураніл	700	N	N	Cl	SCH ₃
291	CH	N	Cl	2-тіофеніл	701	N	N	Cl	SCH ₂ CH ₃
292	CH	N	Cl	OPh	702	N	N	Cl	SCH(CH ₃) ₂
293	CH	N	Cl	OCH ₂ CCH	703	N	N	Br	H
294	CH	N	Cl	OCH ₂ CH ₂ OCH ₃	704	N	N	Br	CH ₃
295	CH	N	Cl	SCH ₃	705	N	N	Br	CH ₂ CH ₃
296	CH	N	Cl	SCH ₂ CH ₃	706	N	N	Br	OCH ₃
297	CH	N	Cl	SCH(CH ₃) ₂	707	N	N	Br	OCH ₂ CH ₃
298	CH	N	Br	H	708	N	N	Br	CH ₂ OCH ₃
299	CH	N	Br	CH ₃	709	N	N	Br	CH(CH ₃)OCH ₃
300	CH	N	Br	CH ₂ CH ₃	710	N	N	Br	C(CH ₃) ₂ OCH ₃
301	CH	N	Br	OCH ₃	711	N	N	Br	CH ₂ F
302	CH	N	Br	OCH ₂ CH ₃	712	N	N	Br	CH ₂ Cl

Таблиця 1

Окремі сполуки формули (I) згідно з даним винаходом

№ сполуки	X	Y	R ²	R ¹	№ сполуки	X	Y	R ²	R ¹
303	CH	N	Br	CH ₂ OCH ₃	713	N	N	Br	CH ₂ Br
304	CH	N	Br	CH(CH ₃)OCH ₃	714	N	N	Br	CH ₂ CF ₃
305	CH	N	Br	C(CH ₃) ₂ OCH ₃	715	N	N	Br	CH ₂ CO ₂ CH ₃
306	CH	N	Br	CH ₂ F	716	N	N	Br	CH ₂ CH ₂ CO ₂ CH ₃
307	CH	N	Br	CH ₂ Cl	717	N	N	Br	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CO ₂ CH ₃
308	CH	N	Br	CH ₂ Br	718	N	N	Br	циклопропіл
309	CH	N	Br	CH ₂ CF ₃	719	N	N	Br	CO ₂ CH ₃
310	CH	N	Br	CH ₂ CO ₂ CH ₃	720	N	N	Br	CO ₂ CH ₂ CH ₃
311	CH	N	Br	CH ₂ CH ₂ CO ₂ CH ₃	721	N	N	Br	Ph
312	CH	N	Br	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CO ₂ CH ₃	722	N	N	Br	2-фураніл
313	CH	N	Br	циклопропіл	723	N	N	Br	2-тіофеніл
314	CH	N	Br	CO ₂ CH ₃	724	N	N	Br	OPh
315	CH	N	Br	CO ₂ CH ₂ CH ₃	725	N	N	Br	OCH ₂ CCH
316	CH	N	Br	Ph	726	N	N	Br	OCH ₂ CH ₂ OCH ₃
317	CH	N	Br	2-фураніл	727	N	N	Br	SCH ₃
318	CH	N	Br	2-тіофеніл	728	N	N	Br	SCH ₂ CH ₃
319	CH	N	Br	OPh	729	N	N	Br	SCH(CH ₃) ₂
320	CH	N	Br	OCH ₂ CCH	730	N	N	CH ₃	H
321	CH	N	Br	OCH ₂ CH ₂ OCH ₃	731	N	N	CH ₃	CH ₃
322	CH	N	Br	SCH ₃	732	N	N	CH ₃	CH ₂ CH ₃
323	CH	N	Br	SCH ₂ CH ₃	733	N	N	CH ₃	OCH ₃
324	CH	N	Br	SCH(CH ₃) ₂	734	N	N	CH ₃	OCH ₂ CH ₃
325	CH	N	CH ₃	H	735	N	N	CH ₃	CH ₂ OCH ₃
326	CH	N	CH ₃	CH ₃	736	N	N	CH ₃	CH(CH ₃)OCH ₃
327	CH	N	CH ₃	CH ₂ CH ₃	737	N	N	CH ₃	C(CH ₃) ₂ OCH ₃
328	CH	N	CH ₃	OCH ₃	738	N	N	CH ₃	CH ₂ F
329	CH	N	CH ₃	OCH ₂ CH ₃	739	N	N	CH ₃	CH ₂ Cl
330	CH	N	CH ₃	CH ₂ OCH ₃	740	N	N	CH ₃	CH ₂ Br
331	CH	N	CH ₃	CH(CH ₃)OCH ₃	741	N	N	CH ₃	CH ₂ CF ₃
332	CH	N	CH ₃	C(CH ₃) ₂ OCH ₃	742	N	N	CH ₃	CH ₂ CO ₂ CH ₃
333	CH	N	CH ₃	CH ₂ F	743	N	N	CH ₃	CH ₂ CH ₂ CO ₂ CH ₃
334	CH	N	CH ₃	CH ₂ Cl	744	N	N	CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CO ₂ CH ₃
335	CH	N	CH ₃	CH ₂ Br	745	N	N	CH ₃	циклопропіл
336	CH	N	CH ₃	CH ₂ CF ₃	746	N	N	CH ₃	CO ₂ CH ₃
337	CH	N	CH ₃	CH ₂ CO ₂ CH ₃	747	N	N	CH ₃	CO ₂ CH ₂ CH ₃
338	CH	N	CH ₃	CH ₂ CH ₂ CO ₂ CH ₃	748	N	N	CH ₃	Ph
339	CH	N	CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CO ₂ CH ₃	749	N	N	CH ₃	2-фураніл
340	CH	N	CH ₃	циклопропіл	750	N	N	CH ₃	2-тіофеніл
341	CH	N	CH ₃	CO ₂ CH ₃	751	N	N	CH ₃	OPh
342	CH	N	CH ₃	CO ₂ CH ₂ CH ₃	752	N	N	CH ₃	OCH ₂ CCH
343	CH	N	CH ₃	Ph	753	N	N	CH ₃	OCH ₂ CH ₂ OCH ₃
344	CH	N	CH ₃	2-фураніл	754	N	N	CH ₃	SCH ₃
345	CH	N	CH ₃	2-тіофеніл	755	N	N	CH ₃	SCH ₂ CH ₃
346	CH	N	CH ₃	OPh	756	N	N	CH ₃	SCH(CH ₃) ₂
347	CH	N	CH ₃	OCH ₂ CCH	757	N	N	OCH ₃	H
348	CH	N	CH ₃	OCH ₂ CH ₂ OCH ₃	758	N	N	OCH ₃	CH ₃
349	CH	N	CH ₃	SCH ₃	759	N	N	OCH ₃	CH ₂ CH ₃
350	CH	N	CH ₃	SCH ₂ CH ₃	760	N	N	OCH ₃	OCH ₃
351	CH	N	CH ₃	SCH(CH ₃) ₂	761	N	N	OCH ₃	OCH ₂ CH ₃
352	CH	N	OCH ₃	H	762	N	N	OCH ₃	CH ₂ OCH ₃
353	CH	N	OCH ₃	CH ₃	763	N	N	OCH ₃	CH(CH ₃)OCH ₃
354	CH	N	OCH ₃	CH ₂ CH ₃	764	N	N	OCH ₃	C(CH ₃) ₂ OCH ₃

Окремі сполуки формули (I) згідно з даним винаходом

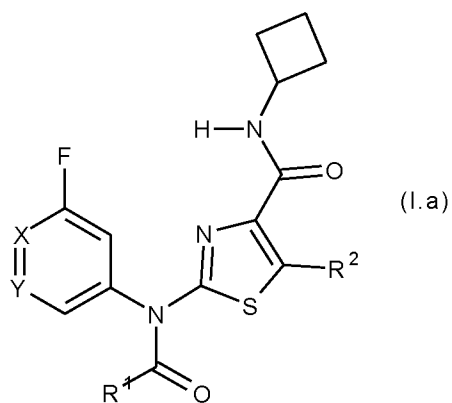
№ сполуки	X	Y	R ²	R ¹	№ сполуки	X	Y	R ²	R ¹
355	CH	N	OCH ₃	OCH ₃	765	N	N	OCH ₃	CH ₂ F
356	CH	N	OCH ₃	OCH ₂ CH ₃	766	N	N	OCH ₃	CH ₂ Cl
357	CH	N	OCH ₃	CH ₂ OCH ₃	767	N	N	OCH ₃	CH ₂ Br
358	CH	N	OCH ₃	CH(CH ₃)OCH ₃	768	N	N	OCH ₃	CH ₂ CF ₃
359	CH	N	OCH ₃	C(CH ₃) ₂ OCH ₃	769	N	N	OCH ₃	CH ₂ CO ₂ CH ₃
360	CH	N	OCH ₃	CH ₂ F	770	N	N	OCH ₃	CH ₂ CH ₂ CO ₂ CH ₃
361	CH	N	OCH ₃	CH ₂ Cl	771	N	N	OCH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CO ₂ CH ₃
362	CH	N	OCH ₃	CH ₂ Br	772	N	N	OCH ₃	циклопропіл
363	CH	N	OCH ₃	CH ₂ CF ₃	773	N	N	OCH ₃	CO ₂ CH ₃
364	CH	N	OCH ₃	CH ₂ CO ₂ CH ₃	774	N	N	OCH ₃	CO ₂ CH ₂ CH ₃
365	CH	N	OCH ₃	CH ₂ CH ₂ CO ₂ CH ₃	775	N	N	OCH ₃	Ph
366	CH	N	OCH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CO ₂ CH ₃	776	N	N	OCH ₃	2-фураніл
367	CH	N	OCH ₃	циклопропіл	777	N	N	OCH ₃	2-тіофеніл
368	CH	N	OCH ₃	CO ₂ CH ₃	778	N	N	OCH ₃	OPh
369	CH	N	OCH ₃	CO ₂ CH ₂ CH ₃	779	N	N	OCH ₃	OCH ₂ CCH
370	CH	N	OCH ₃	Ph	780	N	N	OCH ₃	OCH ₂ CH ₂ OCH ₃
371	CH	N	OCH ₃	2-фураніл	781	N	N	OCH ₃	SCH ₃
372	CH	N	OCH ₃	2-тіофеніл	782	N	N	OCH ₃	SCH ₂ CH ₃
373	CH	N	OCH ₃	OPh	783	N	N	OCH ₃	SCH(CH ₃) ₂
374	CH	N	OCH ₃	OCH ₂ CCH	784	N	N	NHCHO	H
375	CH	N	OCH ₃	OCH ₂ CH ₂ OCH ₃	785	N	N	NHCHO	CH ₃
376	CH	N	OCH ₃	SCH ₃	786	N	N	NHCHO	CH ₂ CH ₃
377	CH	N	OCH ₃	SCH ₂ CH ₃	787	N	N	NHCHO	OCH ₃
378	CH	N	OCH ₃	SCH(CH ₃) ₂	788	N	N	NHCHO	OCH ₂ CH ₃
379	CH	N	NHCHO	H	789	N	N	NHCHO	CH ₂ OCH ₃
380	CH	N	NHCHO	CH ₃	790	N	N	NHCHO	CH(CH ₃)OCH ₃
381	CH	N	NHCHO	CH ₂ CH ₃	791	N	N	NHCHO	C(CH ₃) ₂ OCH ₃
382	CH	N	NHCHO	OCH ₃	792	N	N	NHCHO	CH ₂ F
383	CH	N	NHCHO	OCH ₂ CH ₃	793	N	N	NHCHO	CH ₂ Cl
384	CH	N	NHCHO	CH ₂ OCH ₃	794	N	N	NHCHO	CH ₂ Br
385	CH	N	NHCHO	CH(CH ₃)OCH ₃	795	N	N	NHCHO	CH ₂ CF ₃
386	CH	N	NHCHO	C(CH ₃) ₂ OCH ₃	796	N	N	NHCHO	CH ₂ CO ₂ CH ₃
387	CH	N	NHCHO	CH ₂ F	797	N	N	NHCHO	CH ₂ CH ₂ CO ₂ CH ₃
388	CH	N	NHCHO	CH ₂ Cl	798	N	N	NHCHO	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CO ₂ CH ₃
389	CH	N	NHCHO	CH ₂ Br	799	N	N	NHCHO	циклопропіл
390	CH	N	NHCHO	CH ₂ CF ₃	800	N	N	NHCHO	CO ₂ CH ₃
391	CH	N	NHCHO	CH ₂ CO ₂ CH ₃	801	N	N	NHCHO	CO ₂ CH ₂ CH ₃
392	CH	N	NHCHO	CH ₂ CH ₂ CO ₂ CH ₃	802	N	N	NHCHO	Ph
393	CH	N	NHCHO	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CO ₂ CH ₃	803	N	N	NHCHO	2-фураніл
394	CH	N	NHCHO	циклопропіл	804	N	N	NHCHO	2-тіофеніл
395	CH	N	NHCHO	CO ₂ CH ₃	805	N	N	NHCHO	OPh
396	CH	N	NHCHO	CO ₂ CH ₂ CH ₃	806	N	N	NHCHO	OCH ₂ CCH
397	CH	N	NHCHO	Ph	807	N	N	NHCHO	OCH ₂ CH ₂ OCH ₃
398	CH	N	NHCHO	2-фураніл	808	N	N	NHCHO	SCH ₃
399	CH	N	NHCHO	2-тіофеніл	809	N	N	NHCHO	SCH ₂ CH ₃
400	CH	N	NHCHO	OPh	810	N	N	NHCHO	SCH(CH ₃) ₂
401	CH	N	NHCHO	OCH ₂ CCH	811	N	CF	CH ₃	CH(CH ₃)OCO ₂ CH ₃
402	CH	N	NHCHO	OCH ₂ CH ₂ OCH ₃	812	N	CF	CH ₃	CH(CH ₃)OCO ₂ CH ₂ CH ₃
403	CH	N	NHCHO	SCH ₃	813	N	CF	CH ₃	CH(CH ₃)OC(O)CH ₃
404	CH	N	NHCHO	SCH ₂ CH ₃	814	N	CF	CH ₃	CH(CH ₃)OH
405	CH	N	NHCHO	SCH(CH ₃) ₂	815	N	CF	CH ₃	CH ₂ OCH ₂ CH ₃
406	N	CH	Cl	H	816	N	CF	CH ₃	CH ₂ -C(O)CH ₃

Окремі сполуки формули (I) згідно з даним винаходом

№ сполуки	X	Y	R ²	R ¹	№ сполуки	X	Y	R ²	R ¹
407	N	CH	Cl	CH ₃	817	N	CF	CH ₃	CH ₂ (C ₆ H ₅)
408	N	CH	Cl	CH ₂ CH ₃	818	N	CF	CH ₃	CH ₂ OCH ₂ (C ₆ H ₅)
409	N	CH	Cl	OCH ₃	819	N	CF	CH ₃	CH(CH ₃)OCH ₂ (C ₆ H ₅)
410	N	CH	Cl	OCH ₂ CH ₃	820	N	CF	CH ₃	N(CH ₂ CH ₃) ₂

де

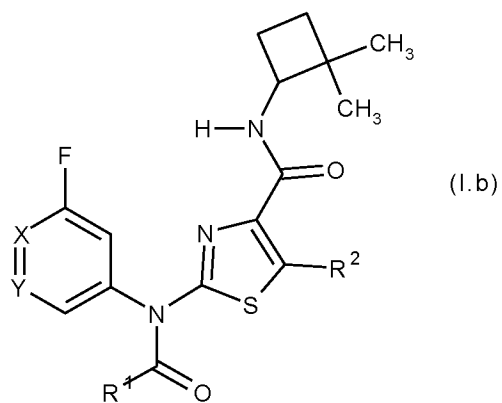
а) 820 сполук формули (I.a),



5

де R¹, R², X та Y є такими, як визначено в таблиці 1.

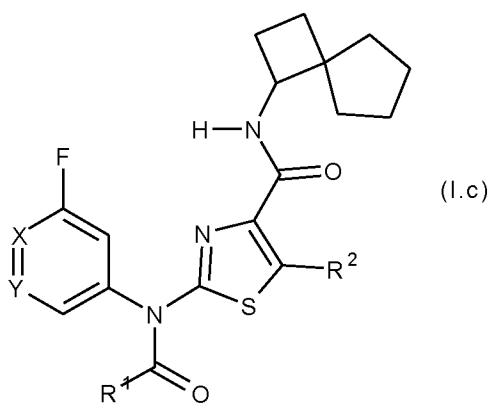
б) 820 сполук формули (I.b),



10

де R¹, R², X та Y є такими, як визначено в таблиці 1.

с) 820 сполуки формули (I.c),



де R¹, R², X та Y є такими, як визначено в таблиці 1.

Приклади складів

5

Змочувані порошки	a)	b)	c)
Активний інгредієнт [сполука формули (I)]	25 %	50 %	75 %
Лігносульфонат натрію	5 %	5 %	-
Лаурилсульфат натрію	3 %	-	5 %
Діізобутилнафталінсульфонат натрію	-	6 %	10 %
Феноловий етер поліетиленгліколю (7-8 моль етиленоксиду)	-	2 %	-
Високодисперсна кремнієва кислота	5 %	10 %	10 %
Каолін	62 %	27 %	-

Активний інгредієнт ретельно перемішують із допоміжними речовинами та суміш ретельно подрібнюють у придатному млині з одержанням змочуваних порошоків, які можна розвести водою з одержанням суспензій необхідної концентрації.

10

Порошки для сухої обробки насіння	a)	b)	c)
Активний інгредієнт [сполука формули (I)]	25 %	50 %	75 %
Легке мінеральне масло	5 %	5 %	5 %
Високодисперсна кремнієва кислота	5 %	5 %	-
Каолін	65 %	40 %	-
Тальк	-	-	20 %

Активний інгредієнт ретельно перемішують із допоміжними речовинами та суміш ретельно подрібнюють у придатному млині з одержанням порошоків, які можна застосовувати безпосередньо для обробки насіння.

15

Здатний до емульгування концентрат

Активний інгредієнт [сполука формули (I)] 10 %

Октилфеноловий етер поліетиленгліколю (4-5 моль етиленоксиду) 3 %

Додецилбензолсульфонат кальцію 3 %

Полігліколевий етер рицинової олії (35 моль етиленоксиду) 4 %

Циклогексанон 30 %

Суміш ксилолів 50 %

Із цього концентрату шляхом розбавлення водою можна одержати емульсії будь-якого необхідного розведення, які можна застосовувати для захисту рослин.

Пилоподібні препарати	a)	b)	c)
Активний інгредієнт [сполука формули (I)]	5 %	6 %	4 %
Тальк	95 %	-	-
Каолін	-	94 %	-
Мінеральний наповнювач	-	-	96 %

Готові до застосування пилоподібні препарати одержують шляхом змішування активного інгредієнта з носієм і подрібнення суміші у придатному млині. Такі порошки також можна застосовувати для сухого протравлювання насіння.

5 Екструдовані гранули

Активний інгредієнт [сполука формули (I)]	15 %
Лігносульфонат натрію	2 %
Карбоксиметилцелюлоза	1 %
Каолін	82 %

Активний інгредієнт змішують і подрібнюють із допоміжними речовинами та суміш зволожують водою. Суміш екструдують і потім висушують у потоці повітря.

Покриті гранули

Активний інгредієнт [сполука формули (I)]	8 %
Поліетиленгліколь (молекулярна маса 200)	3 %
Каолін	89 %

10 Тонкоподрібнений активний інгредієнт у змішувальному пристрої рівномірно наносять на каолін, зволожений поліетиленгліколем. Таким чином одержують покриті гранули, що не належать до пилоподібних препаратів.

Суспензійний концентрат

Активний інгредієнт [сполука формули (I)]	40 %
Пропіленгліколь	10 %
Поліетиленгліколевий етер нонілфенолу (15 моль етиленоксиду)	6 %
Лігносульфонат натрію	10 %
Карбоксиметилцелюлоза	1 %
Силіконове масло (у формі емульсії у воді)	1 %
Вода	32 %

15 Тонкоподрібнений активний інгредієнт ретельно змішують із допоміжними речовинами з одержанням суспензійного концентрату, з якого можна одержати суспензії будь-якого необхідного розведення шляхом розведення водою. Шляхом застосування таких розведень живі рослини, а також матеріал для розмноження рослин можна обробити та захистити від зараження мікроорганізмами шляхом розпилення, поливу або занурення.

Текучий концентрат для обробки насіння

Активний інгредієнт [сполука формули (I)]	40 %
Пропіленгліколь	5 %
Співполімер бутанолу та PO/EO	2 %
Тристиролфенол із 10-20 моль	

EO

1,2-Бензізотіазолін-3-он (у формі 20 % розчину у воді)	0,5 %
Кальцієва сіль моноазопігменту	5 %
Силіконове масло (у формі 75 % емульсії у воді)	0,2 %
Вода	45,3 %

20 Тонкоподрібнений активний інгредієнт ретельно змішують із допоміжними речовинами з одержанням суспензійного концентрату, з якого можна одержати суспензії будь-якого необхідного розведення шляхом розведення водою. Шляхом застосування таких розведень живі рослини, а також матеріал для розмноження рослин можна обробити та захистити від зараження мікроорганізмами шляхом розпилення, поливу або занурення.

Капсульна суспензія повільного вивільнення

25 28 частин комбінації сполуки формули (I) змішують із 2 частинами ароматичного розчинника та 7 частинами суміші толуолдізоціанат/поліметиленполіфенілізоціанат (8:1). Цю суміш емульгують у суміші із 1,2 частини полівінілового спирту, 0,05 частини піногасника і 51,6 частини

води до одержання частинок необхідного розміру. У цю емульсію додають суміш із 2,8 частини 1,6-діаміногексану в 5,3 частини води. Суміш перемішують до завершення реакції полімеризації.

Одержану капсульну суспензію стабілізують шляхом додавання 0,25 частини загусника та 3 частин диспергувального засобу. Склад капсульної суспензії містить 28 % активних інгредієнтів.

5 Середній діаметр капсул становить 8-15 мікронів.

Одержаний склад застосовують щодо насіння у вигляді водної суспензії в пристрої, придатному для даної мети.

Приклади

10 Наступні приклади слугують для ілюстрації даного винаходу. Сполуки за даним винаходом можуть відрізнятися від відомих сполук їхньою більш високою ефективністю за низьких норм застосування, що здатний перевірити фахівець у даній галузі з використанням експериментальних методик, зазначених у прикладах, із використанням за необхідності більш низьких норм застосування, наприклад 50 ppm, 12,5 ppm, 6 ppm, 3 ppm, 1,5 ppm, 0,8 ppm або 0,2 ppm.

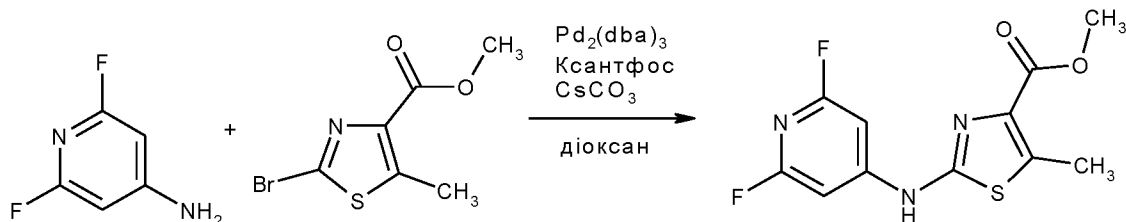
15 Сполуки формули (I) можуть характеризуватися цілою низкою переваг, у тому числі, *inter alia*, переважними рівнями біологічної активності для захисту рослин від захворювань, спричинених грибами, або пречудовими властивостями для застосування як агрохімічно активних інгредієнтів (наприклад, більш високою біологічною активністю, переважним спектром активності, підвищеним профілем безпеки (у тому числі поліпшеною толерантністю сільськогосподарських культур), поліпшеними фізико-хімічними властивостями або підвищеною здатністю до біорозкладання).

Перелік скорочень

°C	= градуси Цельсія
CDCl ₃	= хлороформ-d
d	= дублет
Pd ₂ (dba) ₃	= трис(добензиліденацетон)дипаладій(0)
DIPEA	= N,N-діізопропілетиламін
DMF	= диметилформамід
HATU	= 1-[бис(диметиламіно)метилен]-1H-1,2,3-триазоло[4,5-b]піридин-3-оксид-гексафторфосфат
m	= мультиплет
МГц	= мегагерц
mp	= температура плавлення
n.	= нормальний
ppm	= частин на мільйон
q	= кuartет
s	= синглет
t	= триплет
THF	= тетрагідрофуран
Ксантафос	= 4,5-бис(дифенілфосфіно)-9,9-диметилксантен

Приклад 1. У даному прикладі проілюстроване одержання 2-[ацетил-(2,6-дифтор-4-піридил)аміно]-N-(2,2-диметилциклобутил)-5-метил-тіазол-4-карбоксаміду (сполуки I.b.596):

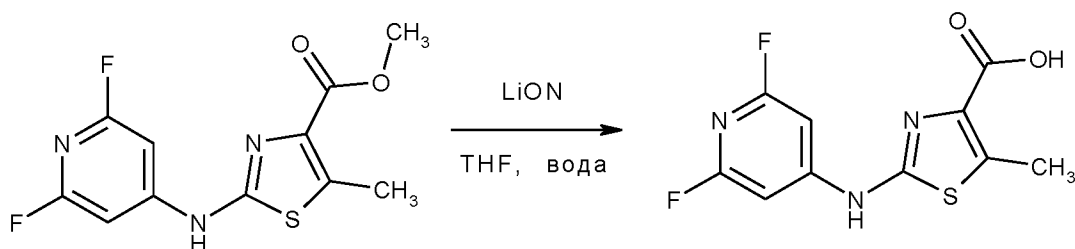
25 а) Одержання метил-2-[(2,6-дифтор-4-піридил)аміно]-5-метил-тіазол-4-карбоксилату



30 В атмосфері аргону до дегазованої перемішуваної суміші метил-2-бром-5-метил-тіазол-4-карбоксилату (4,6 г, 18,5 ммоль, 1 екв.) та 2,6-дифторпіридин-4-аміну (1 екв.) в 1,4-діоксані (660 мл) додавали ксантафос (0,2 екв.), Pd₂(dba)₃ (0,1 екв.) та карбонат цезію (2 екв.). Реакційну суміш нагрівали зі зворотним холодильником та перемішували протягом 4 год., потім забезпечували охолодження температури до кімнатної температури. Суміш розводили за допомогою етилацетату та фільтрували через целіт й одержаний фільтрат концентрували з використанням роторного випарника. За допомогою очищення із використанням колонкової хроматографії на силікагелі (суміші для елювання циклогексан/етилацетат) одержували необхідний метил-2-

[(2,6-дифтор-4-піридил)аміно]-5-метил-тіазол-4-карбоксилат (1,8 г, 6,31 ммоль). ^1H -ЯМР (400 МГц, CDCl_3): δ = 2,73 (s, 3H), 3,94 (s, 3H), 6,75 (s, 1H).

б) Одержання 2-[(2,6-дифтор-4-піридил)аміно]-5-метилтіазол-4-карбонової кислоти



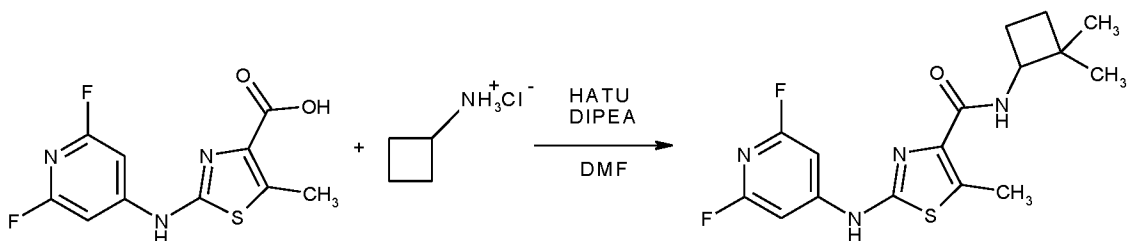
5

Додавали моногідрат гідроксиду літію (4 екв.) до розчину 2-[(2,6-дифтор-4-піридил)аміно]-5-метил-тіазол-4-карбонової кислоти (1,8 г, 6,31 ммоль) у суміші тетрагідрофурану (35 мл) та води (12 мл). Реакційну суміш перемішували 16 год. за кімнатної температури, потім розчинники видаляли *in vacuo*. Залишок розводили за допомогою етилацетату та води, потім повільно додавали 2 н. хлористоводневу кислоту до досягнення pH 3-4. Осад, що утворився, виділяли шляхом фільтрації та двічі промивали за допомогою води, одержуючи необхідний продукт, 2-[(2,6-дифтор-4-піридил)аміно]-5-метил-тіазол-4-карбонову кислоту (1,55 г, 5,71 ммоль). ^1H -ЯМР (400 МГц, $(\text{CD}_3)_2\text{SO}$): δ = 2,69 (s, 3H), 7,30 (s, 2H), 11,35 (bs, 1H), 12,90 (bs, 1H).

10

15

с) Одержання 2-[(2,6-дифтор-4-піридил)аміно]-N-(2,2-диметилциклобутил)-5-метил-тіазол-4-карбоксаміду



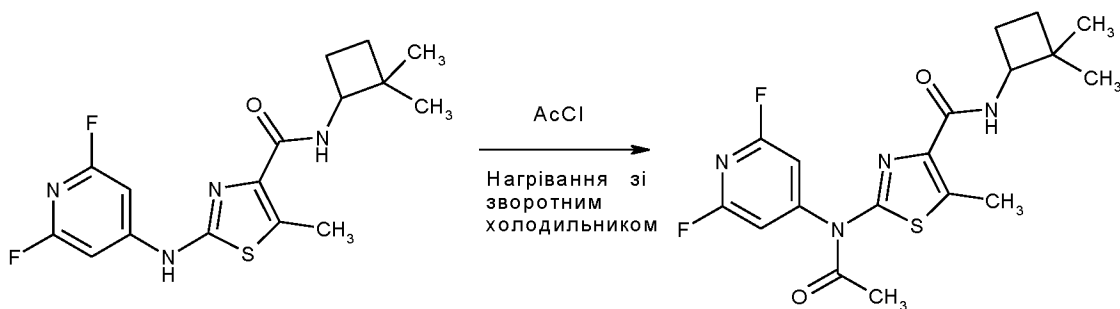
20

Хлорид (2,2-диметилциклобутил)амонію (1,1 екв.), HATU (1,1 екв.) та DIPEA (2,6 екв.) послідовно додавали до розчину 2-[(2,6-дифтор-4-піридил)аміно]-5-метил-тіазол-4-карбонової кислоти (250 мг, 0,92 ммоль, 1 екв.) у DMF (9,2 мл). Одержаний розчин перемішували за кімнатної температури протягом 1 год. до вичерпання вихідного матеріалу (контроль із використанням LCMS). Потім до суміші додавали насичений розчин NaHCO_3 та розчин тричі екстрагували за допомогою етилацетату. Органічні фази об'єднували, висушували над сульфатом натрію та видаляли леткі речовини за допомогою роторного випарника. За допомогою очищення із використанням колонкової хроматографії на силікагелі (елюент: суміші циклогексан/етилацетат) одержували необхідний продукт, 2-[(2,6-дифтор-4-піридил)аміно]-N-(2,2-диметилциклобутил)-5-метил-тіазол-4-карбоксамід (280 мг, вихід 86 %). ^1H -ЯМР (400 МГц, CDCl_3): δ = 1,17 (s, 3H), 1,20 (s, 3H), 1,50 – 1,75 (m, 2H), 1,86 – 1,92 (m, 1H), 2,29 – 2,36 (m, 1H), 2,79 (s, 3H), 4,25 – 4,31 (m, 1H), 6,87 (s, 2H), 7,32 (d, 1H), 7,67 (s, 1H).

25

30

д) 2-[Ацетил-(2,6-дифтор-4-піридил)аміно]-N-(2,2-диметилциклобутил)-5-метил-тіазол-4-карбоксамід (сполука I.b.596)



35

Суміш 2-[(2,6-дифтор-4-піридил)аміно]-N-(2,2-диметилциклобутил)-5-метил-тіазол-4-карбоксаміду (1,9 г, 5,4 ммоль) в ацетилхлориді (20 мл) перемішували зі зворотним холодильником протягом 3 днів. Потім забезпечували охолодження реакційної суміші до кімнатної температури та леткі речовини видаляли за допомогою роторного випарника. За допомогою очищення неочищеного матеріалу, одержаного за допомогою колонкової хроматографії на силікагелі (елюент: суміші циклогексан/етилацетат), одержували необхідний продукт, 2-[ацетил-(2,6-дифтор-4-піридил)аміно]-N-(2,2-диметилциклобутил)-5-метил-тіазол-4-карбоксамід (1,57 г, 3,98 ммоль, вихід 74 %). ¹H-ЯМР (400 МГц, CDCl₃): δ=0,92 (s, 3H), 1,12 (s, 3H), 1,48 – 1,75 (m, 3H), 2,10-2,30 (m, 1H), 2,17 (s, 3H), 2,79 (s, 3H), 4,25 – 4,31 (m, 1H), 6,87 (s, 2H), 7,32 (d, 1H).

У всьому даному описі значення температури наведені в градусах Цельсія (°C), а "m.p." означає температуру плавлення. LC/MS означає рідинну хроматографію з мас-спектрометрією, а опис пристрою і способу є наступним:

Спосіб А. ACQUITY UPLC від Waters, Waters UPLC HSS T3, розмір частинок 1,8 мкм, колонка 30×2,1 мм, 0,85 мл/хв., 60 °C, H₂O/MeOH 95:5+0,05 % HCOOH (90 %) / CH₃CN+0,05 % HCOOH (10 %) – 1,2 хв. – CH₃CN+0,05 % HCOOH (100 %) – 0,30 хв., мас-спектрометр ACQUITY SQD від Waters, спосіб іонізації: електророзпилення (ESI), полярність: позитивні іони, напруга на капілярі (кВ) 3,00, напруга на конусі (В) 30,00, напруга на екстракторі (В) 2,00, початкова температура (°C) 150, температура десольватації (°C) 350, газовий потік у конусі (л/год.) 0, газовий потік десольватації (л/год.) 650.

Спосіб В. ACQUITY UPLC від Waters, Waters UPLC HSS T3, розмір частинок 1,8 мкм, колонка 30×2,1 мм, 0,85 мл/хв., 60 °C, H₂O/MeOH 95:5+0,05 % HCOOH (90 %) / CH₃CN+0,05 % HCOOH (10 %) – 2,7 хв. – CH₃CN+0,05 % HCOOH (100 %) – 0,30 хв., мас-спектрометр ACQUITY SQD від Waters, спосіб іонізації: електророзпилення (ESI), полярність: позитивні іони, напруга на капілярі (кВ) 3,00, напруга на конусі (В) 30,00, напруга на екстракторі (В) 2,00, початкова температура (°C) 150, температура десольватації (°C) 350, газовий потік у конусі (л/год.) 0, газовий потік десольватації (л/год.) 650.

Спосіб С. MS: мас-спектрометр ZQ від Waters (одноквадрупольний мас-спектрометр)

Параметри приладу: спосіб іонізації: електророзпилення, полярність: позитивні (негативні) іони, напруга на капілярі (кВ) 3,00, напруга на конусі (В) 30,00, напруга на екстракторі (В) 2,00, температура газу (°C) 350, газовий потік висушування (мл/хв.) 9,8, тиск у носіку 45 фт/кв. дюйм надл., діапазон мас: від 90 до 1000 Да.

HPLC: HP 1100 HPLC від Agilent: дегазатор для розчинника, насос для чотириккомпонентних сумішей (ZCQ)/насос для двокомпонентних сумішей (ZDQ), нагрітий відсік для колонки та детектор на діодній матриці. Колонка: porpshell 120 C18, розмір частинок 2,7 мкм, 120 ангстрем, 4,6×50 мм, температура: 30 °C; діапазон довжин хвиль DAD (нм): від 190 до 400, градієнт розчинника: А = вода + 0,1 % HCOOH. В = ацетонітрил + 0,08 % HCOOH. Рухома фаза:

Час (хв.)	A%	B%	Потік (мл/хв.)
0	85	15	0,6
4	5	95	0,6
10	5	95	0,6

Спосіб D. Мас-спектрометр, як у способі С.

HPLC: Shimadzu LC-20A. Колонка: Dikma, DiamonsilC18(2) (5 мкм, 150 * 4,6 мм).

Рухома фаза А: H₂O (із додаванням 0,1 % TFA); рухома фаза В: ACN (із додаванням 0,1 % TFA). Потік: 1,0 мл/хв.

Виявлення: УФ-випромінювання за 254 нм. Температура печі: 40 °C. Рухома фаза:

Час (хв.)	A%	B%
0	90	10
15	0	100
25	0	100
27	90	10
35	90	10

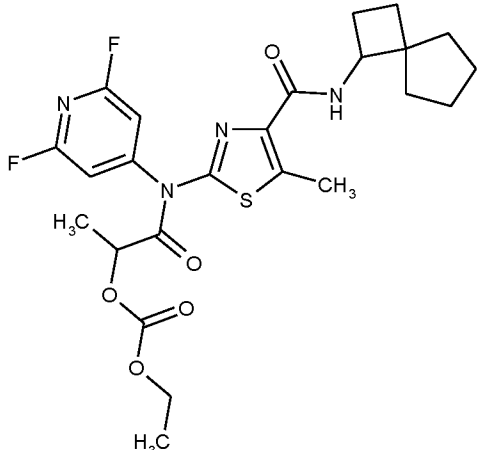
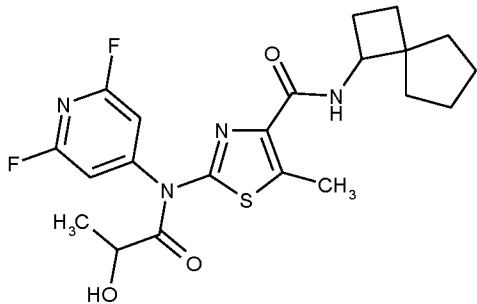
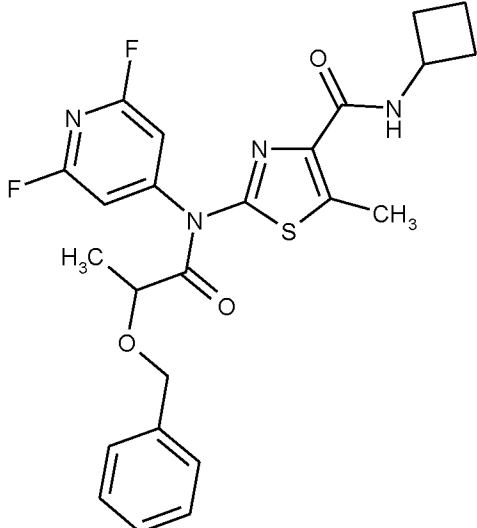
Таблиця 2

Температура плавлення та дані LC/MS (R_t = час утримування) для вибраних сполук із таблиці 1

№	Назва сполуки	Структура	Мр (°C)	LC/MS
I.c.813	[2-[(2,6-Дифтор-4-піридил)-[5-метил-4-(спіро[3.4]октан-3-ілкарбамоїл)тіазол-2-іл]аміно]-1-метил-2-оксо-етил]ацетат			$R_t=5,10$ хв. (C); MS: маса/заряд = 493 (M+1)
I.a.812	[2-[[4-(Циклобутилкарбамоїл)-5-метил-тіазол-2-іл]-(2,6-дифтор-4-піридил)аміно]-1-метил-2-оксо-етил]етилкарбонат		105-106	$R_t=15,33$ хв. (D); MS: маса/заряд = 469 (M+1)
I.c.811	[2-[(2,6-Дифтор-4-піридил)-[5-метил-4-(спіро[3.4]октан-3-ілкарбамоїл)тіазол-2-іл]аміно]-1-метил-2-оксо-етил]метилкарбонат			$R_t=5,18$ хв. (C); MS: маса/заряд = 509 (M+1)

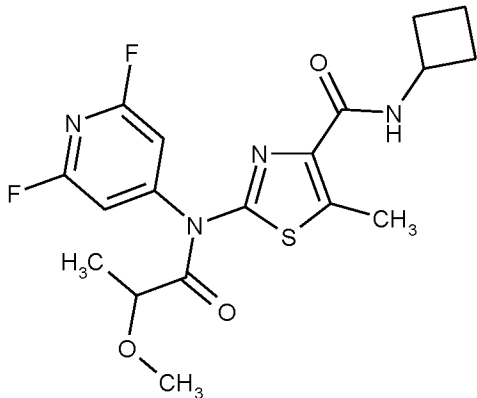
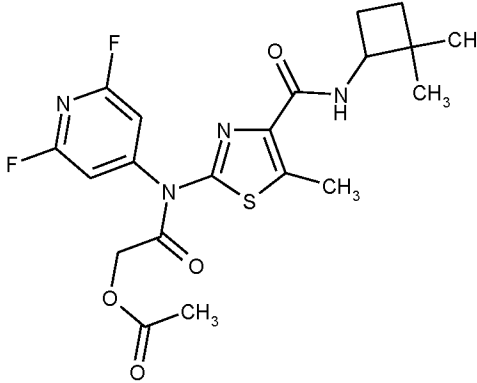
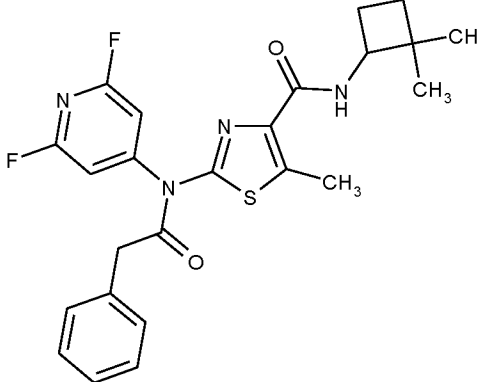
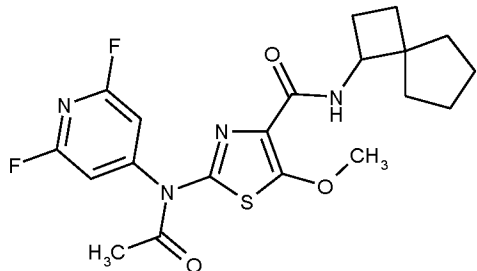
Таблиця 2

Температура плавлення та дані LC/MS (R_t = час утримування) для вибраних сполук із таблиці 1

№	Назва сполуки	Структура	Мр (°C)	LC/MS
I.c.812	[2-[(2,6-Дифтор-4-піридил)-[5-метил-4-(спіро[3.4]октан-3-ілкарбамоїл)тіазол-2-іл]аміно]-1-метил-2-оксо-етил]етилкарбонат		106-108	$R_t=5,41$ хв. (C); MS: маса/заряд = 523 (M+1)
I.c.814	2-[(2,6-Дифтор-4-піридил)-(2-гідроксипропаноїл)аміно]-5-метил-N-спіро[3.4]октан-3-іл-тіазол-4-карбоксамід		101-103	$R_t=5,15$ хв. (C); MS: маса/заряд = 451 (M+1)
I.a.819	2-[2-Бензилоксипропаноїл-(2,6-дифтор-4-піридил)аміно]-N-циклобутил-5-метил-тіазол-4-карбоксамід		98-100	$R_t=5,10$ хв. (C); MS: маса/заряд = 497 (M+1)

Таблиця 2

Температура плавлення та дані LC/MS (R_t = час утримування) для вибраних сполук із таблиці 1

№	Назва сполуки	Структура	Мр (°C)	LC/MS
I.a.601	N-Циклобутил-2-[(2,6-дифтор-4-піридил)-(2-метоксипропаноїл)аміно]-5-метил-тіазол-4-карбоксамід		128-130	$R_t=13,80$ хв. (D); MS: маса/заряд = 411 (M+1)
I.b.816	[2-[(2,6-Дифтор-4-піридил)-[4-[(2,2-диметилциклобутил)карбамоїл]-5-метил-тіазол-2-іл]аміно]-2-оксо-етил]ацетат		65,5 – 67,2	$R_t=1,10$ хв. (A); MS: маса/заряд = 453 (M+1)
I.b.817	2-[(2,6-Дифтор-4-піридил)-(2-фенілацетил)аміно]-N-(2,2-диметилциклобутил)-5-метил-тіазол-4-карбоксамід			$R_t=1,23$ хв. (A); MS: маса/заряд = 471 (M+1)
I.c.596	2-[Ацетил-(2,6-дифтор-4-піридил)аміно]-5-метокси-N-спіро[3.4]октан-3-іл-тіазол-4-карбоксамід		199-200	$R_t=1,06$ хв. (A); MS: маса/заряд = 437 (M+1)

Таблиця 2

Температура плавлення та дані LC/MS (R_t = час утримування) для вибраних сполук із таблиці 1

№	Назва сполуки	Структура	Мр (°C)	LC/MS
I.c.600	2-[(2,6-Дифтор-4-піридил)-(2-метоксиацетил)аміно]-5-метил-N-спіро[3.4]октан-3-іл-тіазол-4-карбоксамід			$R_t=15,94$ хв. (D); MS: маса/заряд = 451 (M+1)
I.a.600	N-Циклобутил-2-[(2,6-дифтор-4-піридил)-(2-метоксиацетил)аміно]-5-метил-тіазол-4-карбоксамід			$R_t=13,64$ хв. (D); MS: маса/заряд = 398 (M+1)
I.a.596	2-[Ацетил-(2,6-дифтор-4-піридил)аміно]-N-циклобутил-5-метил-тіазол-4-карбоксамід		174-175	$R_t=13,92$ хв. (D); MS: маса/заряд = 367 (M+1)
I.b.818	2-[(2-Бензилоксиацетил)-(2,6-дифтор-4-піридил)аміно]-N-(2,2-диметилциклобутил)-5-метил-тіазол-4-карбоксамід		182,9 – 187,1	$R_t=1,22$ хв. (A); MS: маса/заряд = 501 (M+1)

Таблиця 2

Температура плавлення та дані LC/MS (R_t = час утримування) для вибраних сполук із таблиці 1

№	Назва сполуки	Структура	Мр (°C)	LC/MS
I.b.815	2-[(2,6-Дифтор-4-піридил)-(2-етоксиацетил)аміно]-N-(2,2-диметилциклобутил)-5-метил-тіазол-4-карбоксамід		146,1 – 147,6	$R_t=1,14$ хв. (A); MS: маса/заряд = 439 (M+1)
I.b.820	2-[Діетилкарбамоїл-(2,6-дифтор-4-піридил)аміно]-N-(2,2-диметилциклобутил)-5-метил-тіазол-4-карбоксамід			$R_t=1,19$ хв. (A); MS: маса/заряд = 452 (M+1)
I.b.604	2-[(2-Хлорацетил)-(2,6-дифтор-4-піридил)аміно]-N-(2,2-диметилциклобутил)-5-метил-тіазол-4-карбоксамід		155,6 – 157,1	$R_t=1,11$ хв. (A); MS: маса/заряд = 429/431 (M+1)
I.b.607	Метил-3-[(2,6-дифтор-4-піридил)-[4-[(2,2-диметилциклобутил)карбамоїл]-5-метил-тіазол-2-іл]аміно]-3-оксо-пропаноат			$R_t=1,09$ хв. (A); MS: маса/заряд = 453 (M+1)

Таблиця 2

Температура плавлення та дані LC/MS (R_t = час утримування) для вибраних сполук із таблиці 1

№	Назва сполуки	Структура	Мр (°C)	LC/MS
I.b.614	2-[(2,6-Дифтор-4-піридил)-(фуран-2-карбоніл)аміно]-N-(2,2-диметилциклобутил)-5-метил-тіазол-4-карбоксамід		166-172	$R_t=1,15$ хв. (A); MS: маса/заряд = 447 (M+1)
I.b.609	Метил-5-[(2,6-дифтор-4-піридил)-[4-[(2,2-диметилциклобутил)карбамоїл]-5-метил-тіазол-2-іл]аміно]-5-оксо-пентаноат		175-178	$R_t=1,12$ хв. (A); MS: маса/заряд = 481 (M+1)
I.b.606	2-[(2,6-Дифтор-4-піридил)-(3,3,3-трифторпропаноїл)аміно]-N-(2,2-диметилциклобутил)-5-метил-тіазол-4-карбоксамід		157-163	$R_t=1,15$ хв. (A); MS: маса/заряд = 463 (M+1)
I.b.621	S-Ізопропіл-N-(2,6-дифтор-4-піридил)-N-[4-[(2,2-диметилциклобутил)карбамоїл]-5-метил-тіазол-2-іл]карбамотіоат		155-158	$R_t=1,28$ хв. (A); MS: маса/заряд = 455 (M+1)

Таблиця 2

Температура плавлення та дані LC/MS (R_t = час утримування) для вибраних сполук із таблиці 1

№	Назва сполуки	Структура	Мр (°C)	LC/MS
I.b.608	Метил-4-[(2,6-дифтор-4-піридил)-[4-[(2,2-диметилциклобутил)карбамоїл]-5-метил-тіазол-2-іл]аміно]-4-оксо-бутаноат		160-163	$R_t=1,11$ хв. (A); MS: маса/заряд = 467 (M+1)
I.b.610	2-[Циклопропанкарбоніл-(2,6-дифтор-4-піридил)аміно]-N-(2,2-диметилциклобутил)-5-метил-тіазол-4-карбоксамід		165-170	$R_t=1,16$ хв. (A); MS: маса/заряд = 421 (M+1)
I.b.617	Проп-2-ініл-N-(2,6-дифтор-4-піридил)-N-[4-[(2,2-диметилциклобутил)карбамоїл]-5-метил-тіазол-2-іл]карбамат		129-131	$R_t=1,14$ хв. (A); MS: маса/заряд = 435 (M+1)
I.b.616	Феніл-N-(2,6-дифтор-4-піридил)-N-[4-[(2,2-диметилциклобутил)карбамоїл]-5-метил-тіазол-2-іл]карбамат		138-140	$R_t=1,23$ хв. (A); MS: маса/заряд = 473 (M+1)

Таблиця 2

Температура плавлення та дані LC/MS (R_t = час утримування) для вибраних сполук із таблиці 1

№	Назва сполуки	Структура	Мр (°C)	LC/MS
I.b.603	2-[(2,6-Дифтор-4-піридил)-(2-фторацетил)аміно]-N-(2,2-диметилциклобутил)-5-метил-тіазол-4-карбоксамід		158-162	$R_t=1,09$ хв. (A); MS: маса/заряд = 413 (M+1)
I.b.618	2-Метоксиетил-N-(2,6-дифтор-4-піридил)-N-[4-[(2,2-диметилциклобутил)карбамоїл]-5-метил-тіазол-2-іл]карбамат			$R_t=1,14$ хв. (A); MS: маса/заряд = 455 (M+1)
I.b.600	2-[(2,6-Дифтор-4-піридил)-(2-метоксиацетил)аміно]-N-(2,2-диметилциклобутил)-5-метил-тіазол-4-карбоксамід		102-108	$R_t=1,08$ хв. (A); MS: маса/заряд = 425 (M+1)
I.b.599	Етил-N-(2,6-дифтор-4-піридил)-N-[4-[(2,2-диметилциклобутил)карбамоїл]-5-метил-тіазол-2-іл]карбамат			$R_t=1,16$ хв. (A); MS: маса/заряд = 425 (M+1)

Таблиця 2

Температура плавлення та дані LC/MS (R_t = час утримування) для вибраних сполук із таблиці 1

№	Назва сполуки	Структура	Мр (°C)	LC/MS
I.b.615	2-[(2,6-Дифтор-4-піридил)-(тіофен-2-карбоніл)аміно]-N-(2,2-диметилциклобутил)-5-метил-тіазол-4-карбоксамід		178-185	$R_t=1,19$ хв. (A); MS: маса/заряд = 463 (M+1)
I.b.598	Метил-N-(2,6-дифтор-4-піридил)-N-[4-[(2,2-диметилциклобутил)карбамоїл]-5-метил-тіазол-2-іл]карбамат			$R_t=1,14$ хв. (A); MS: маса/заряд = 411 (M+1)
I.b.595	2-[(2,6-Дифтор-4-піридил)-форміл-аміно]-N-(2,2-диметилциклобутил)-5-метил-тіазол-4-карбоксамід		132-135	$R_t=1,09$ хв. (A); MS: маса/заряд = 381 (M+1)
I.b.612	Етил-2-[(2,6-дифтор-4-піридил)-[4-[(2,2-диметилциклобутил)карбамоїл]-5-метил-тіазол-2-іл]аміно]-2-оксо-ацетат		159-161	$R_t=1,17$ хв. (A); MS: маса/заряд = 453 (M+1)

Таблиця 2

Температура плавлення та дані LC/MS (R_t = час утримування) для вибраних сполук із таблиці 1

№	Назва сполуки	Структура	Мр (°C)	LC/MS
I.b.613	2-[Бензоїл-(2,6-дифтор-4-піридил)аміно]-N-(2,2-диметилциклобутил)-5-метилтіазол-4-карбоксамід		142-151	$R_t=1,19$ хв. (A); MS: маса/заряд = 457 (M+1)
I.b.596	2-[Ацетил-(2,6-дифтор-4-піридил)аміно]-N-(2,2-диметилциклобутил)-5-метилтіазол-4-карбоксамід		141-145	$R_t=1,09$ хв. (A); MS: маса/заряд = 395 (M+1)
I.c.596	2-[Ацетил-(2,6-дифтор-4-піридил)аміно]-5-метил-N-спіро[3.4]октан-3-іл-тіазол-4-карбоксамід			$R_t=1,15$ хв. (A); MS: маса/заряд = 421 (M+1)

Несподівано було виявлено, що нові сполуки формули (I), тобто де R^1 являє собою водень, C_1 - C_6 алкіл, C_1 - C_6 алкокси, C_1 - C_6 галогеналкіл, C_1 - C_6 алкокси C_1 - C_6 алкіл, C_3 - C_6 циклоалкіл, C_1 - C_6 алкокси C_1 - C_3 алкокси, C_1 - C_6 алкоксикарбоніл, C_1 - C_6 алкоксикарбоніл C_1 - C_4 алкіл, C_2 - C_6 алкенілокси, C_2 - C_6 алкінілокси, C_1 - C_6 алкілсульфаніл, феніл, фенокси або гетероарил, де гетероарил являє собою 5- або 6-членне ароматичне моноциклічне кільце, що містить 1 або 2 гетероатоми, окремо вибрані з азоту, кисню та сірки, можуть демонструвати поліпшені властивості розчинності (зокрема, у неполярних розчинниках) та/або світлостабільності порівняно з їхнім відповідним вільним аміном, які відомі з WO 2017/207362.

У всьому наступному описі LogP означає логарифм коефіцієнта розподілу, ppm означає частини на мільйон та T_{50} являє собою період напіврозпаду сполуки за умов опромінення.

Способи, застосовувані для таких вимірів, представлені нижче.

Коефіцієнт розподілу

Коефіцієнти розподілу в суміші октанол-вода (представлені як LogP) вимірювали за допомогою способу HPLC із використанням мініколонок з оберненою фазою, покритих октанолом. Коефіцієнт розподілу R прямо пропорційний показнику утримування за HPLC. Загальні принципи даного способу були описані, наприклад, у J. Pharm. Sci., 67 (1978) 1364-7.

Застосовували HPLC-систему Waters (насос для двокомпонентних сумішей моделі 1525;

автоматичний пробовідбирач із термостатом 2707 та детектор на фотодіодній матриці моделі 2298) із мініколонками Hichrom та водною рухомою фазою, що містила 20 мМ фосфатних буферів, відрегульованих до pH 7, насиченою 1-октанолом (Aldrich, ступінь чистоти для HPLC). Застосовували мініколонки являли собою HiRPB з нерухомою фазою або із внутрішнім діаметром 4,6 мм на довжину 4 мм, або із внутрішнім діаметром 2 мм x довжина 10 мм. Анізол (Aldrich, чистота 99 %+, LogP 2,11) застосовували як основний еталон для калібрування системи.

Світлостабільність

Тести щодо світлостабільності здійснювали шляхом опромінення осадів сполук та складів у вигляді тонких плівок на скляних поверхнях із використанням системи ксенонової лампи зі світлофільтром (Atlas Suntest), яка відтворює спектр та інтенсивність сонячного світла. Потужність спектрального виходу Suntest встановлювали на 750 Вт/м², що являє собою типовий денний максимальний рівень випромінювання опівдні (Велика Британія, середина літа).

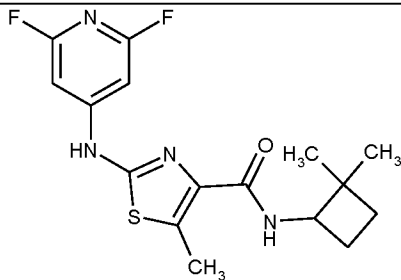
Досліджувані сполуки зазвичай розчиняли у метанолі зі ступенем чистоти для HPLC з одержанням 1 г/л вихідних розчинів. Альтернативно препарати сполук суспендували в воді за тієї самої концентрації. Краплини досліджуваних розчинів об'ємом 2 мкл наносили на покривні скельця для мікроскопії на підставці, надрукованій на 3D-принтері, забезпечували висушування, потім опромінювали Suntest протягом різних проміжків часу. Потім покривні скельця виймали з-під впливу Suntest та поміщали у флакон об'ємом 4 драхми; додавали 1 мл розчинника для промивання (зазвичай ацетонітрил: 0,2 % водна мурашина кислота 30:70) та флакони струшували з екстрагуванням сполук у розчин. Розчини аналізували за допомогою HPLC з оберненою фазою зазвичай з використанням UPLC-системи Waters із фотодіодною матрицею (PDA) та колонок Waters (BEH C18, 100 × 2,1 мм x 1,7 мкм) із використанням змішаної рухомої фази вода:ацетонітрил, підкисленої за допомогою 0,2 % мурашиної кислоти. Піки реєстрували за оптимальної довжини хвилі для кожної сполуки-кандидата і площі піків PDA застосовували для кількісного визначення. Графіки втрати у % від часу застосовували для оцінки значень T₅₀, при цьому використовували час втрати перших 50 % досліджуваної сполуки.

Розчинність

Насичені розчини досліджуваних сполук одержували або у водних буферних розчинах (10 мМ суміш фосфатів, pH 7,20), або в гептані. Зазвичай 1 мг досліджуваної сполуки у флаконі об'ємом 2 драхми з 1 мл буферу або гептану залишали протягом ночі (20 годин) на роликівому шейкері після того, як попередньо поміщали в ультразвукову баню на 20 хвилин. Потім насичені зразки фільтрували через фільтри на 0,45 мікрона на шприці Millex-HV (водну або неводну версію, залежно від розчинника). Потім водні зразки аналізували шляхом прямого введення в LCMS та площі піків, одержані з використанням PDA-детектування, порівнювали зі стандартами відомої концентрації; зразки у гептані спочатку висушували та повторно розчиняли в розчиннику, сумісному з LC, зазвичай ацетонітрил: 0,2 % мурашина кислота 30:70. Варіанти протоколу включали попереднє насичення фільтрів для сполук, які, передбачалося, характеризуються дуже низькою розчинністю, та центрифугування насичених зразків для масел.

У таблиці 3 нижче проілюстровані несподівані щодо сполук, відомих раніше в даній галузі техніки з WO2017/207362, фізико-хімічні властивості (коефіцієнт розподілу LogP, розчинність у гептані та/або світлостабільність).

Таблиця 3

№	Назва сполуки	Структура	LogP	Розчинність у воді (ppm)	Розчинність у гептані (ppm)	Світлостабільність T ₅₀ (год.)
E-0	2-[(2,6-Дифтор-4-піридил)аміно]-N-(2,2-диметилциклобутил)-5-метил-тіазол-4-карбоксамід		5,08	0,70	4,1	3,5

Таблиця 3

№	Назва сполуки	Структура	LogP	Розчин- ність у воді (ppm)	Розчин- ність у гептані (ppm)	Світло- стабіль- ність T ₅₀ (год.)
I.b.607	Метил-3-[(2,6-дифтор-4-піридил)-[4-[(2,2-диметилциклобутил)карбамоїл]-5-метил-тіазол-2-іл]аміно]-3-оксопропаноат		3,59	12	224	4,4
I.b.614	2-[(2,6-Дифтор-4-піридил)-(фуран-2-карбоніл)аміно]-N-(2,2-диметилциклобутил)-5-метил-тіазол-4-карбоксамід		4,61	0,054	98	14
I.b.616	Феніл-N-(2,6-дифтор-4-піридил)-N-[4-[(2,2-диметилциклобутил)карбамоїл]-5-метил-тіазол-2-іл]карбамат		5,34	0,10	673	18
I.b.600	2-[(2,6-Дифтор-4-піридил)-(2-метоксиацетил)аміно]-N-(2,2-диметилциклобутил)-5-метил-тіазол-4-карбоксамід		3,35	18	859	2,8
I.b.599	Етил-N-(2,6-дифтор-4-піридил)-N-[4-[(2,2-диметилциклобутил)карбамоїл]-5-метил-тіазол-2-іл]карбамат		4,58	1,0	>1300	11

Таблиця 3

№	Назва сполуки	Структура	LogP	Розчинність у воді (ppm)	Розчинність у гептані (ppm)	Світло-стабільність T ₅₀ (год.)
I.b.598	Метил-N-(2,6-дифтор-4-піридил)-N-[4-[(2,2-диметилциклобутил)карбамоїл]-5-метил-тіазол-2-іл]карбамат		4,21	1,4	1155	6,2
I.b.595	2-[(2,6-Дифтор-4-піридил)-форміл-аміно]-N-(2,2-диметилциклобутил)-5-метил-тіазол-4-карбоксамід		3,61	2,5	193	2,8
I.b.612	Етил-2-[(2,6-дифтор-4-піридил)-[4-[(2,2-диметилциклобутил)карбамоїл]-5-метил-тіазол-2-іл]аміно]-2-оксоацетат		4,34	Н. в.	379	5,5
I.b.596	2-[Ацетил-(2,6-дифтор-4-піридил)аміно]-N-(2,2-диметилциклобутил)-5-метил-тіазол-4-карбоксамід		3,80	3,7	619	5,5

Біологічні приклади

Приклад В1. *Alternaria solani* / томат / листовий диск (альтернаріоз)

- Листові диски томату сорту Baby поміщали на агар у багатолункові планшети (24-лунковий формат) й обприскували препаратом досліджуваної сполуки, розведеної у воді. Листові диски інокулювали суспензією спор гриба через 2 дні після застосування. Інокульовані листові диски інкубували за 23 °C/21 °C (день/ніч) і відносної вологості 80 % за світлового режиму 12/12 год. (світла/темряви) у кліматичній камері й активність сполуки оцінювали як показник контролю захворювання, виражений у відсотках, порівняно з необробленим матеріалом під час виявлення відповідного ступеня пошкодження внаслідок захворювання на необроблених листових дисках, які являють собою контрольні диски (5-7 днів після застосування).

- Наступні сполуки за концентрації 200 ppm забезпечували щонайменше 80 % контролю *Alternaria solani* порівняно з необробленими контрольними зразками, які за тих самих умов демонстрували значний розвиток захворювання: I.b.595, I.b.596, I.b.600, I.b.603, I.b.604, I.b.606, I.b.607, I.b.608, I.b.612, I.b.613, I.b.617, I.b.815, I.b.816, I.b.817, I.b.818, I.c.812, I.c.813.

Приклад В2. *Botryotinia fuckeliana* (*Botrytis cinerea*) / рідка культура (сіра гниль)

Конідії грибів із криогенного сховища безпосередньо змішували з поживним бульйоном (бульйон Фогеля). Після внесення розчину (DMSO) досліджуваної сполуки в планшет для мікротитрування (96-лунковий формат) додавали поживний бульйон, що містить спори грибів. Досліджувані планшети інкубували за 24 °C і пригнічення росту визначали фотометрично через 3-4 дні після застосування.

Наступні сполуки за концентрації 20 ppm забезпечували щонайменше 80 % контролю *Botryotinia fuckeliana* порівняно з необробленими контрольними зразками, які за тих самих умов демонстрували значний розвиток захворювання: I.b.595, I.b.596, I.b.600, I.b.612, I.b.613, I.b.815, I.b.818.

Приклад В3. *Glomerella lagenarium* (*Colletotrichum lagenarium*) / підка культура (антракноз)

Конідії грибів із криогенного сховища безпосередньо змішували з поживним бульйоном (картопляно-декстрозним бульйоном, PDB). Після внесення розчину (DMSO) досліджуваної сполуки в планшет для мікротитрування (96-лунковий формат) додавали поживний бульйон, що містить спори грибів. Досліджувані планшети інкубували за 24 °C і пригнічення росту вимірювали фотометрично через 3-4 дні після застосування.

Наступні сполуки за концентрації 20 ppm забезпечували щонайменше 80 % контролю *Glomerella lagenarium* порівняно з необробленими контрольними зразками, які за тих самих умов демонстрували значний розвиток захворювання: I.b.595, I.b.596, I.b.600, I.b.603, I.b.604, I.b.606, I.b.607, I.b.608, I.b.612, I.b.613, I.b.815, I.b.816, I.b.817, I.b.818, I.b.820, I.c.600, I.c.811, I.c.812, I.c.813, I.c.814.

Приклад В4. *Blumeria graminis* f. sp. *tritici* (*Erysiphe graminis* f. sp. *tritici*) / пшениця / попередження зараження листового диска (борошниста роса на пшениці)

Сегменти листків пшениці сорту Kanzler поміщали на агар у багатолунковий планшет (24-лунковий формат) й обприскували препаратом досліджуваної сполуки, розведеної у воді. Листові диски інокулювали шляхом струшування заражених борошнистою росю рослин над досліджуваними планшетами через 1 день після застосування. Інокульовані листові диски інкубували за 20 °C і відносної вологості 60 % за світлового режиму 24 год. темряви з наступними 12 год. світла/12 год. темряви у кліматичній камері й активність сполуки оцінювали як показник контролю захворювання, виражений у відсотках, порівняно з необробленим матеріалом після появи відповідного ступеня пошкодження внаслідок захворювання на необроблених контрольних сегментах листків (6-8 днів після застосування).

Наступні сполуки за концентрації 200 ppm забезпечували щонайменше 80 % контролю *Blumeria graminis* f. sp. *tritici* порівняно з необробленими контрольними зразками, які за тих самих умов демонстрували значний розвиток захворювання: I.a.596, I.a.600, I.a.601, I.a.812, I.b.595, I.b.596, I.b.598, I.b.599, I.b.600, I.b.603, I.b.604, I.b.606, I.b.607, I.b.608, I.b.610, I.b.612, I.b.613, I.b.614, I.b.615, I.b.616, I.b.617, I.b.618, I.b.815, I.b.816, I.b.817, I.b.818, I.b.820, I.c.596, I.c.600, I.c.811, I.c.812, I.c.813, I.c.814.

Приклад В5. *Fusarium culmorum* / пшениця / попередження зараження колосків (фузаріоз)

Колоски пшениці сорту Monsun поміщали на агар у багатолункові планшети (24-лунковий формат) й обприскували препаратом досліджуваної сполуки, розведеної у воді. Колоски інокулювали суспензією спор гриба через 1 день після застосування. Інокульовані колоски інкубували за 20 °C і відносної вологості 60 % за світлового режиму 72 год. напівтемряви з наступними 12 год. світла/12 год. темряви в кліматичній камері й активність сполуки оцінювали як показник контролю захворювання, виражений у відсотках, порівняно з необробленим матеріалом після появи відповідного ступеня пошкодження внаслідок захворювання на необроблених контрольних колосках (6-8 днів після застосування).

Наступні сполуки за концентрації 200 ppm забезпечували щонайменше 80 % контролю *Fusarium culmorum* порівняно з необробленими контрольними зразками, які за тих самих умов демонстрували значний розвиток захворювання: I.b.600.

Приклад В6. *Gibberella zeae* (*Fusarium graminearum*) / пшениця / попередження зараження колосків (фузаріоз)

Колоски пшениці сорту Monsun поміщали на агар у багатолункові планшети (24-лунковий формат) й обприскували препаратом досліджуваної сполуки, розведеної у воді. Через день після застосування колоски інокулювали за допомогою суспензії спор гриба. Інокульовані досліджувані листові диски інкубували за 20 °C і відносної вологості 60 % за світлового режиму 72 год. напівтемряви з наступними 12 год. світла/12 год. темряви в кліматичній камері, активність сполуки оцінювали як показник контролю захворювання, виражений у відсотках, порівняно з необробленим матеріалом після появи відповідного ступеня пошкодження внаслідок захворювання на необроблених контрольних колосках (6-8 днів після застосування).

Наступні сполуки за концентрації 200 ppm забезпечували щонайменше 80 % контролю

Gibberella zeae порівняно з необробленими контрольними зразками, які за тих самих умов демонстрували значний розвиток захворювання: I.b.607.

Приклад В7. *Phaeosphaeria nodorum* (*Septoria nodorum*) / пшениця / попередження зараження листового диска (септоріоз колоскової луски)

5 Сегменти листків пшениці сорту Kanzler поміщали на агар у багатолунковий планшет (24-лунковий формат) й обприскували препаратом досліджуваної сполуки, розведеної у воді. Листові диски інокулювали суспензією спор гриба через 2 дні після застосування. Інокульовані досліджувані листові диски інкубували за 20 °C і відносної вологості 75 % за світлового режиму 12 год. світла/12 год. темряви у кліматичній камері й активність сполуки оцінювали як показник контролю захворювання, виражений у відсотках, порівняно з необробленим матеріалом після появи відповідного ступеня пошкодження внаслідок захворювання на необроблених контрольних листових дисках (5-7 днів після застосування).

10 Наступні сполуки за концентрації 200 ppm забезпечували щонайменше 80 % контролю *Phaeosphaeria nodorum* порівняно з необробленими контрольними зразками, які за тих самих умов демонстрували значний розвиток захворювання: I.b.603, I.b.604, I.b.607, I.a.812.

15 Приклад В8. *Monographella nivalis* (*Microdochium nivale*) / рідка культура (коренева гниль злакових)

Конідії грибів із криогенного сховища безпосередньо змішували з поживним бульйоном (картопляно-декстрозним бульйоном, PDB). Після внесення розчину (DMSO) досліджуваної сполуки в планшет для мікротитрування (96-лунковий формат) додавали поживний бульйон, що містить спори грибів. Досліджувані планшети інкубували за 24 °C і пригнічення росту визначали фотометрично через 4-5 днів після застосування.

20 Наступні сполуки за концентрації 20 ppm забезпечували щонайменше 80 % контролю *Monographella nivalis* порівняно з необробленими контрольними зразками, які за тих самих умов демонстрували значний розвиток захворювання: I.a.600, I.b.595, I.b.596, I.b.600, I.b.603, I.b.604, I.b.606, I.b.607, I.b.608, I.b.612, I.b.613, I.b.615, I.b.616, I.b.817, I.b.618, I.b.815, I.b.816, I.b.818, I.b.820, I.c.600, I.c.811, I.c.812, I.c.813, I.c.814.

25 Приклад В9. *Mycosphaerella arachidis* (*Cercospora arachidicola*) / рідка культура (ранній церкоспороз листя)

30 Конідії грибів із криогенного сховища безпосередньо змішували з поживним бульйоном (картопляно-декстрозним бульйоном, PDB). Після внесення розчину (DMSO) досліджуваної сполуки в планшет для мікротитрування (96-лунковий формат) додавали поживний бульйон, що містить спори грибів. Досліджувані планшети інкубували за 24 °C і пригнічення росту визначали фотометрично через 4-5 днів після застосування.

35 Наступні сполуки за концентрації 20 ppm забезпечували щонайменше 80 % контролю *Mycosphaerella arachidis* порівняно з необробленими контрольними зразками, які за тих самих умов демонстрували значний розвиток захворювання: I.b.595, I.b.600, I.b.603, I.b.604, I.b.606, I.b.607, I.b.612, I.b.816, I.c.812.

Приклад В10. *Phakopsora pachyrhizi* / соя / попередження (іржа сої)

40 Листові диски сої поміщали на водний агар у багатолункові планшети (24-лунковий формат) й обприскували препаратом досліджуваної сполуки, розведеної у воді. Через день після застосування листові диски інокулювали шляхом розприскування суспензії спор на нижню поверхню листка. Після періоду інкубації у кліматичній камері, що становив 24-36 год., в темряві за 20 °C та відносної вологості 75 % листові диски витримували за 20 °C із 12 год. світла/дня та відносною вологістю 75 %. Активність сполуки оцінювали як показник контролю захворювання, виражений у відсотках, порівняно з необробленим матеріалом після появи відповідного ступеня пошкодження внаслідок захворювання на необроблених контрольних листових дисках (12-14 днів після застосування).

50 Наступні сполуки за концентрації 200 ppm забезпечували щонайменше 80 % контролю *Phakopsora pachyrhizi* порівняно з необробленими контрольними зразками, які за тих самих умов демонстрували значний розвиток захворювання: I.a.601, I.b.595, I.b.600, I.b.603, I.b.604, I.b.612, I.b.613, I.b.815, I.b.816, I.b.818.

Приклад В11. *Plasmopara viticola* / виноград / попередження зараження листового диска (фітофтороз)

55 Листові диски культурного винограду поміщали на водний агар у багатолункові планшети (24-лунковий формат) та обприскували препаратом досліджуваної сполуки, розведеної у воді. Листові диски інокулювали суспензією спор гриба через 1 день після застосування. Інокульовані листові диски інкубували за 19 °C і відносної вологості 80 % за світлового режиму 12 год. світла/12 год. темряви у кліматичній камері й активність сполуки оцінювали як показник контролю захворювання, виражений у відсотках, порівняно з необробленим матеріалом після

появи відповідного ступеня пошкодження внаслідок захворювання на необроблених контрольних листових дисках (6-8 днів після застосування).

Наступні сполуки за концентрації 200 ppm забезпечували щонайменше 80 % контролю *Plasmopara viticola* порівняно з необробленими контрольними зразками, які за тих самих умов демонстрували значний розвиток захворювання: I.b.603, I.b.607.

Приклад В12. *Puccinia recondita* f. sp. *tritici* / пшениця / лікування зараження листового диска (бура іржа)

Сегменти листків пшениці сорту Kanzler поміщали на агар у багатолункові планшети (24-лунковий формат). Сегменти листків інокулювали суспензією спор гриба. Планшети зберігали в темряві за 19 °C і відносної вологості 75 %. Препарат досліджуваної сполуки, розведеної у воді, застосовували через 1 день після інокуляції. Сегменти листків інкубували за 19 °C та відносної вологості 75 % за світлового режиму 12 год. світла/12 год. темряви в кліматичній камері й активність сполуки оцінювали як показник контролю захворювання, виражений у відсотках, порівняно з необробленим матеріалом після появи відповідного ступеня пошкодження внаслідок захворювання на необроблених контрольних сегментах листків (6-8 днів після застосування).

Наступні сполуки за концентрації 200 ppm забезпечували щонайменше 80 % контролю *Puccinia recondita* f. sp. *tritici* порівняно з необробленими контрольними зразками, які за тих самих умов демонстрували значний розвиток захворювання: I.b.595, I.b.600, I.b.603, I.b.604, I.b.606, I.b.607, I.b.608, I.b.612, I.b.618, I.b.815, I.b.816, I.b.818.

Приклад В13. *Puccinia recondita* f. sp. *tritici* / пшениця / попередження зараження листового диска (бура іржа)

Сегменти листків пшениці сорту Kanzler поміщали на агар у багатолункові планшети (24-лунковий формат) й обприскували препаратом досліджуваної сполуки, розведеної у воді. Листкові диски інокулювали суспензією спор гриба через 1 день після застосування. Інокульовані сегменти листків інкубували за 19 °C та відносної вологості 75 % за світлового режиму 12 год. світла/12 год. темряви в кліматичній камері й активність сполуки оцінювали як показник контролю захворювання, виражений у відсотках, порівняно з необробленим матеріалом після появи відповідного ступеня пошкодження внаслідок захворювання на необроблених контрольних сегментах листків (7-9 днів після застосування).

Наступні сполуки за концентрації 200 ppm забезпечували щонайменше 80 % контролю *Puccinia recondita* f. sp. *tritici* порівняно з необробленими контрольними зразками, які за тих самих умов демонстрували значний розвиток захворювання: I.a.596, I.a.600, I.a.601, I.a.812, I.b.595, I.b.596, I.b.600, I.b.603, I.b.604, I.b.606, I.b.607, I.b.608, I.b.612, I.b.613, I.b.614, I.b.618, I.b.815, I.b.816, I.b.817, I.b.818, I.c.600, I.c.811, I.c.812, I.c.813, I.c.814.

Приклад В14. *Magnaporthe grisea* (*Pyricularia oryzae*) / рис / попередження зараження листового диска (пірикуляріоз рису)

Сегменти листків рису сорту Ballila поміщали на агар у багатолунковий планшет (24-лунковий формат) й обприскували препаратом досліджуваної сполуки, розведеної у воді. Сегменти листків інокулювали суспензією спор гриба через 2 дні після застосування. Інокульовані сегменти листків інкубували за 22 °C і відносної вологості 80 % за світлового режиму 24 год. темряви з наступними 12 год. світла/12 год. темряви у кліматичній камері й активність сполуки оцінювали як показник контролю захворювання, виражений у відсотках, порівняно з необробленим матеріалом після появи відповідного ступеня пошкодження внаслідок захворювання на необроблених контрольних сегментах листків (5-7 днів після застосування).

Наступні сполуки за концентрації 200 ppm забезпечували щонайменше 80 % контролю *Magnaporthe grisea* порівняно з необробленими контрольними зразками, які за тих самих умов демонстрували значний розвиток захворювання: I.a.596, I.a.600, I.a.601, I.a.812, I.b.595, I.b.596, I.b.598, I.b.600, I.b.603, I.b.604, I.b.606, I.b.607, I.b.608, I.b.612, I.b.613, I.b.614, I.b.615, I.b.616, I.b.617, I.b.618, I.b.815, I.b.816, I.b.817, I.b.818, I.b.820, I.c.596, I.c.596, I.c.600, I.c.811, I.c.812, I.c.813, I.c.814.

Приклад В15. *Pyrenophora teres* / ячмінь / попередження зараження листового диска (сітчаста плямистість)

Сегменти листків ячменю сорту Hasso поміщали на агар у багатолунковий планшет (24-лунковий формат) й обприскували препаратом досліджуваної сполуки, розведеної у воді. Сегменти листків інокулювали суспензією спор гриба через 2 дні після застосування. Інокульовані сегменти листків інкубували за 20 °C та відносної вологості 65 % за світлового режиму 12 год. світла/12 год. темряви в кліматичній камері й активність сполуки оцінювали як показник контролю захворювання порівняно з необробленим матеріалом після появи

відповідного ступеня пошкодження внаслідок захворювання на необроблених контрольних сегментах листків (5-7 днів після застосування).

Наступні сполуки за концентрації 200 ppm забезпечували щонайменше 80 % контролю *Ryzenphora teres* порівняно з необробленими контрольними зразками, які за тих самих умов демонстрували значний розвиток захворювання: I.a.600, I.b.595, I.b.596, I.b.600, I.b.603, I.b.604, I.b.607, I.b.608, I.b.612, I.b.613, I.b.617, I.b.815, I.b.816, I.b.818, I.c.596, I.c.600, I.c.811, I.c.812, I.c.813.

Приклад B16. *Sclerotinia sclerotiorum* / рідка культура (біла гниль)

Фрагменти міцелію нещодавно вирощеної рідкої культури гриба безпосередньо змішували з поживним бульйоном (картопляно-декстрозним бульйоном, PDB). Після внесення розчину (DMSO) досліджуваної сполуки в планшет для мікротитрування (96-лунковий формат) додавали поживний бульйон, що містить грибний матеріал. Досліджувані планшети інкубували за 24 °C і пригнічення росту визначали фотометрично через 3-4 дні після застосування.

Наступні сполуки за концентрації 20 ppm забезпечували щонайменше 80 % контролю *Sclerotinia sclerotiorum* порівняно з необробленими контрольними зразками, які за тих самих умов демонстрували значний розвиток захворювання: I.b.607, I.b.612.

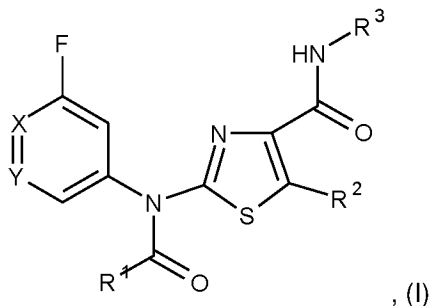
Приклад B17. *Mycosphaerella graminicola* (*Septoria tritici*) / рідка культура (септоріоз)

Конідії грибів із криогенного сховища безпосередньо змішували з поживним бульйоном (картопляно-декстрозним бульйоном, PDB). Після внесення розчину (DMSO) досліджуваної сполуки в планшет для мікротитрування (96-лунковий формат) додавали поживний бульйон, що містить спори грибів. Досліджувані планшети інкубували за 24 °C і пригнічення росту визначали фотометрично через 4-5 днів після застосування.

Наступні сполуки за концентрації 20 ppm забезпечували щонайменше 80 % контролю *Mycosphaerella graminicola* порівняно з необробленими контрольними зразками, які за тих самих умов демонстрували значний розвиток захворювання: I.b.595, I.b.596, I.b.600, I.b.603, I.b.604, I.b.606, I.b.607, I.b.612, I.b.815, I.b.816, I.b.817, I.b.818, I.c.811, I.c.812, I.c.813, I.c.814.

ФОРМУЛА ВИНАХОДУ

1. Сполука формули (I):



де

Y являє собою C-F;

R¹ являє собою водень, C₁-C₆алкіл, C₁-C₆алкокси, C₁-C₆галогеналкіл, C₁-C₆гідроксіалкіл, C₁-C₆алкоксіC₁-C₆алкіл, C₃-C₆циклоалкіл, C₁-C₆алкоксіC₁-C₃алкокси, C₁-C₆алкоксикарбоніл, C₁-C₆алкоксикарбонілC₁-C₄алкіл, C₁-C₆алкоксикарбонілоксіC₁-C₄алкіл, C₁-C₆алкілкарбонілоксіC₁-C₄алкіл, C₂-C₆алкенілокси, C₂-C₆алкінілокси, C₁-C₆алкілсульфаніл, ді(C₁-C₆алкіл)аміно, феніл, фенілC₁-C₃алкіл, фенілC₁-C₃алкоксіC₁-C₃алкіл, фенокси або гетероарил, де гетероарил являє собою 5- або 6-членне ароматичне моноциклічне кільце, що містить 1 або 2 гетероатоми, окремо вибрані з азоту, кисню та сірки;

R² являє собою водень, галоген, ціано, C₁-C₄алкіл, C₁-C₄алкокси, C₁-C₄галогеналкіл або HC(O)NH-;

R³ являє собою C₃-C₆циклоалкіл, де зазначені циклоалкільні групи необов'язково заміщені 1 або 2 групами, представленими R⁴, або

R³ являє собою 6-8-членну неароматичну спіроциклічну карбобіциклічну кільцеву систему;

R⁴ являє собою галоген, C₁-C₄алкіл, C₁-C₄алкокси або C₁-C₄галогеналкіл;

X являє собою N або C-H;

або її сіль або N-оксид.

2. Сполука за п. 1, де R¹ являє собою водень, C₁-C₄алкіл, C₁-C₄алкокси, C₁-C₄галогеналкіл, C₁-C₄гідроксіалкіл, C₁-C₃алкоксіC₁-C₄алкіл, C₃-C₆циклоалкіл, C₁-C₄алкоксіC₁-C₃алкокси, C₁-

- С₃алкоксикарбоніл, С₁-С₃алкоксикарбонілС₁-С₄алкіл, С₁-С₄алкоксикарбонілоксиС₁-С₃алкіл, С₁-С₄алкілкарбонілоксиС₁-С₃алкіл, С₃-С₅алкінілокси, С₁-С₄алкілсульфаніл, ді(С₁-С₄алкіл)аміно, феніл, фенілС₁-С₃алкіл, фенілС₁-С₃алкоксиС₁-С₃алкіл, фенокси або гетероарил, де гетероарил являє собою 5- або 6-членне ароматичне моноциклічне кільце, що містить 1 або 2 гетероатоми, окремо вибрані з азоту, кисню та сірки.
3. Сполука за п. 1 або 2, де R¹ являє собою водень, С₁-С₃алкіл, С₁-С₃алкокси, С₁-С₃галогеналкіл, С₁-С₃гідроксіалкіл, метоксіС₁-С₄алкіл, С₃-С₄циклоалкіл, С₁-С₂алкоксиС₁-С₂алкокси, С₁-С₃алкоксикарбоніл, метоксикарбонілС₁-С₃алкіл, С₁-С₂алкоксикарбонілоксиС₁-С₂алкіл, С₁-С₂алкілкарбонілоксиС₁-С₂алкіл, С₃-С₄алкінілокси, С₁-С₃алкілсульфаніл, діетиламіно, феніл, бензил, фенокси, бензилоксиС₁-С₂алкіл або гетероарил, де гетероарил являє собою 5- або 6-членне ароматичне моноциклічне кільце, що містить один гетероатом, вибраний із кисню та сірки.
4. Сполука за будь-яким із пп. 1-3, де R¹ являє собою водень, метил, етил, метокси, етокси, фторметил, хлорметил, бромметил, 2,2,2-трифторетил, 1-гідроксіетил, метоксиметил, 1-метоксіетил, 1-етоксиметил, 1-метокси-1-метилетил, циклопропіл, метоксіетокси, етоксикарбоніл, 2-метоксі-2-оксоетил, 2-метоксіоксоетил, 2-метоксіоксопропіл, пропаргілокси, 1-метоксикарбонілоксиетил, 1-етоксикарбонілоксиетил, 1-метилкарбонілоксиетил, метилкарбонілоксиметил, метилсульфаніл, етилсульфаніл, ізопропілсульфаніл, діетиламіно, феніл, бензил, фенокси, бензилоксиметил, 1-бензилоксиетил, 2-фураніл або 2-тіофеніл.
5. Сполука за будь-яким із пп. 1-4, де R¹ являє собою водень, метил, етил, метокси, етокси, фторметил, 2,2,2-трифторетил, циклопропіл, метоксіетокси, 2-метоксі-2-оксоетил, 2-метоксіоксоетил, 2-метоксіоксопропіл, пропаргілокси, ізопропілсульфаніл, феніл, фенокси, 2-фураніл або 2-тіофеніл.
6. Сполука за будь-яким із пп. 1-5, де R² являє собою галоген, С₁-С₂алкіл, С₁-С₂алкокси або HC(O)NH-.
7. Сполука за будь-яким із пп. 1-6, де R² являє собою метил.
8. Сполука за будь-яким із пп. 1-7, де R³ являє собою С₃-С₄циклоалкіл, де циклоалкільні групи необов'язково заміщені 1 або 2 групами, представленими R⁴, або R³ являє собою 6-8-членну неароматичну спіроциклічну карбобіциклічну кільцеву систему.
9. Сполука за будь-яким із пп. 1-8, де X являє собою N.
10. Сполука за будь-яким із пп. 1-9, де R³ являє собою циклобутил, 2,2-диметилциклобутил або спіро[3.4]октаніл.
11. Агрохімічна композиція, що містить фунгіцидно ефективну кількість сполуки формули (I) за будь-яким із пп. 1-10.
12. Композиція за п. 11, що додатково містить щонайменше один додатковий активний інгредієнт та/або агрохімічно прийнятний розріджувач або носій.
13. Спосіб контролю або попередження зараження корисних рослин фітопатогенними мікроорганізмами, де фунгіцидно ефективну кількість сполуки формули (I) за будь-яким із пп. 1-10 або композиції, що містить дану сполуку як активний інгредієнт, застосовують щодо рослин, їхніх частин або їхнього місця зростання.
14. Застосування сполуки формули (I) за будь-яким із пп. 1-10 як фунгіциду.