

(19)



Евразийское
патентное
ведомство

(11) 044071

(13) B1

(12) ОПИСАНИЕ ИЗОБРЕТЕНИЯ К ЕВРАЗИЙСКОМУ ПАТЕНТУ

(45) Дата публикации и выдачи патента
2023.07.20

(21) Номер заявки
202092336

(22) Дата подачи заявки
2019.03.21

(51) Int. Cl. A01N 53/00 (2006.01)
C07C 317/44 (2006.01)
C07C 323/60 (2006.01)

(54) СОЕДИНЕНИЯ, ОБЛАДАЮЩИЕ ПЕСТИЦИДНЫМ ДЕЙСТВИЕМ, КОМПОЗИЦИИ И СПОСОБ БОРЬБЫ С ВРЕДИТЕЛЯМИ, СВЯЗАННЫЕ С НИМИ

(31) 62/651,747

(32) 2018.04.03

(33) US

(43) 2020.12.09

(86) PCT/US2019/023385

(87) WO 2019/194982 2019.10.10

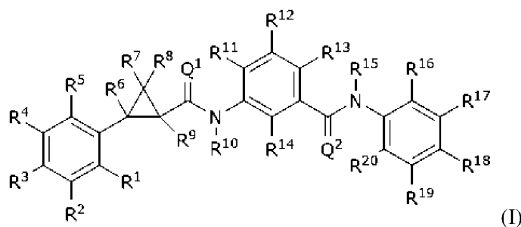
(71)(73) Заявитель и патентовладелец:
КОРТЕВА АГРИСАЙЕНС ЭлЭлСи
(US)

(56) WO-A1-2016168059
US-A1-2017208806
WO-A1-2018071327

(72) Изобретатель:
Мартин Тимоти П., Росс Рональд, мл.,
Хемстра Рональд Дж., Эккельбарджер
Джозеф Д., Траллингер Тони К.,
Хантер Рики, Уолш Мартин Дж. (US)

(74) Представитель:
Медведев В.Н. (RU)

(57) Изобретение относится к области соединений, обладающих пестицидным действием в отношении вредителей типов Arthropoda, Mollusca и Nematoda, способам получения таких соединений, промежуточным соединениям, применяемым в таких способах, пестицидным композициям, содержащим такие соединения, и способам применения таких пестицидных композиций в отношении таких вредителей. Данные пестицидные композиции можно применять, например, в качестве акарицидов, инсектицидов, майтицидов, моллюскоцидов и нематоцидов. В данном документе раскрыты соединения, характеризующиеся следующей формулой:



B1

044071

044071

B1

Перекрестная ссылка на родственные заявки

Данная заявка испрашивает преимущество и приоритет предварительной заявки на патент США с регистрационным номером 62/651747; которая была подана 3 апреля 2018 г. Полное содержание вышеуказанной заявки, таким образом, включено посредством ссылки в данную заявку.

Область техники, к которой относится изобретение

Настоящее изобретение относится к области соединений, обладающих пестицидным действием в отношении вредителей типов Arthropoda, Mollusca и Nematoda, к способам получения таких соединений, к промежуточным соединениям, применяемым в таких способах, к пестицидным композициям, содержащим такие соединения, и к способам применения таких пестицидных композиций в отношении таких вредителей. Данные пестицидные композиции можно применять, например, в качестве акарицидов, инсектицидов, майтицидов, моллюскоцидов и нематоцидов.

Предпосылки изобретения

"Многие из наиболее опасных заболеваний человека переносятся насекомыми-переносчиками" (Rivego и соавт.). "Исторически малярия, лихорадка денге, желтая лихорадка, чума, филяриатоз, эпидемический сыпной тиф, трипаносомоз, лейшманиоз и другие трансмиссивные заболевания были причиной большого количества заболеваний и смертей людей на протяжении 17-го - начала 20-го столетий, чем все другие причины в совокупности" (Gubler). Трансмиссивные заболевания являются причиной приблизительно 17% паразитарных и инфекционных заболеваний в мире. Малярия сама по себе вызывает более 800000 смертей в год, 85% из которых происходит у детей возрастом до пяти лет. Каждый год происходит от приблизительно 50 млн до приблизительно 100 млн случаев лихорадки денге. Также каждый год возникает 250000-500000 случаев геморрагической формы лихорадки денге (Matthews). Контроль переносчиков инфекции выполняет важнейшую функцию в предотвращении и контроле инфекционных заболеваний. Тем не менее стойкость в отношении инсектицидов, включая стойкость в отношении нескольких инсектицидов, появилась у всех видов насекомых, которые являются основными переносчиками заболеваний человека (Rivego и соавт.). Недавно более 550 видов членистоногих развили стойкость в отношении по меньшей мере одного пестицида (Whalon и соавт.). Кроме того, случаи стойкости насекомых продолжают значительно превышать число случаев стойкости в отношении гербицидов и фунгицидов (Sparks и соавт.).

Каждый год насекомые, патогены растений и сорняки разрушают более 40% всех произведенных пищевых продуктов. Данная потеря происходит несмотря на использование пестицидов и применение широкого спектра нехимических средств контроля, таких как чередование культур, и биологических средств контроля. Если хоть некоторую часть данных пищевых продуктов можно спасти, их можно применять для питания более трех миллиардов людей в мире, которые голодают (Pimental).

Паразитические нематоды растений находятся среди наиболее распространенных вредителей и зачастую являются одними из наиболее сложных в отношении обнаружения и дорогостоящих в отношении борьбы с ними. Было оценено, что потери, связанные с нематодами, составляют от приблизительно 9% в развитых странах до приблизительно 15% в слаборазвитых странах. Тем не менее в Соединенных Штатах Америки исследование в 35 штатах относительно различных сельскохозяйственных культур показало потери, вызванные нематодами, составляющие до 25% (Nicol и соавт.).

Отмечается, что брюхоногие (слизни и улитки) являются менее экономически важными вредителями, чем другие членистоногие или нематоды, но в некоторых зонах они могут значительно снижать урожай, сильно влиять на качество собираемых продуктов, а также переносить заболевания человека, животных и растений. Хотя только несколько десятков видов брюхоногих являются значительными региональными вредителями, небольшое количество видов являются важными вредителями на мировом уровне. В частности, брюхоногие влияют на большое разнообразие сельскохозяйственных и плодовых культур, таких как пропашные, пастбищные и волокнистые культуры; овощи; кустовые ягоды и плодовые деревья; травы и декоративные растения (Speiser).

Термиты вызывают повреждение всех типов частных и общественных строений, а также сельскохозяйственных и лесных ресурсов. В 2005 г. было оценено, что термиты вызывают ущерб на сумму более 50 млрд долларов США каждый год во всем мире (Korb).

Следовательно, по многим причинам, включая причины, указанные выше, существует постоянная необходимость в дорогостоящей (оценивается как приблизительно 256 млн долларов США на пестицид в 2010 г.), времязатратной (в среднем приблизительно 10 лет на пестицид) и сложной разработке новых пестицидов (CropLife America).

Некоторые ссылки, цитируемые в настоящем изобретении

CropLife America, The Cost of New Agrochemical Product Discovery, Development & Registration, and Research & Development predictions for the Future, 2010.

Drewes, M., Tietjen, K., Sparks, T.C., High-Throughput Screening in Agrochemical Research, *Modern Methods in Crop Protection Research*, часть I, *Methods for the Design and Optimization of New Active Ingredients*, под ред. Jeschke, P., Kramer, W., Schirmer, U., and Matthias W., с. 1-20, 2012.

Gubler, D., Resurgent Vector-Borne Diseases as a Global Health Problem, *Emerging Infectious Diseases*, том 4, № 3, с. 442-450, 1998 г.

Korb, J., Termites, *Current Biology*, том 17, № 23, 2007 г.

Matthews, G., Integrated Vector Management: Controlling Vectors of Malaria and Other Insect Vector Borne Diseases, Гл. 1, с. 1, 2011 г.

Nicol, J., Turner S., Coyne, L., den Nijs, L., Hockslan, L., Tahna-Maafi, Z., Current Nematode Threats to World Agriculture, *Genomic and Molecular Genetics of Plant - Nematode Interactions*, с. 21-43, 2011 г.

Pimental, D., Pest Control in World Agriculture, *Agricultural Sciences* - том II, 2009 г.

Rivero, A., Vezilier, J., Weill, M., Read, A., Gandon, S., Insect Control of Vector-Borne Diseases: When is Insect Resistance a Problem? *Public Library of Science Pathogens*, том 6, № 8, с. 1-9, 2010 г.

Sparks T.C., Nauen R., IRAC: Mode of action classification and insecticide resistance management, *Pesticide Biochemistry and Physiology* (2014), доступный онлайн, 4 декабря 2014 г.

Speiser, B., Molluscicides, *Encyclopedia of Pest Management*, Гл. 219, с. 506-508, 2002 г.

Whalon, M., Mota-Sanchez, D., Hollingworth, R., Analysis of Global Pesticide Resistance in Arthropods, *Global Pesticide Resistance in Arthropods*, Гл. 1, с. 5-33, 2008 г.

Определения, используемые в настоящем изобретении

Примеры, приведенные в данных определениях, как правило, являются неисключительными и не должны рассматриваться как ограничивающие настоящее изобретение. Подразумевается, что заместитель должен соответствовать правилам химического связывания и ограничениям стерической совместимости в отношении конкретного соединения, к которому он присоединен. Данные определения следует использовать только для целей настоящего изобретения.

Выражение "активный ингредиент" означает вещество, обладающее активностью, пригодное для борьбы с вредителями и/или которое пригодное для способствования проявлению лучшей активности других веществ для борьбы с вредителями, примеры таких веществ включают без ограничения акарициды, альгициды, антифиданты, авициды, бактерициды, отпугивающие птиц вещества, хемотренизаторы, фунгициды, антитоксины гербицидов, гербициды, приманки для насекомых, отпугивающие насекомых вещества, инсектициды, отпугивающие млекопитающих вещества, средства для дезориентации самцов, моллюскоциды, нематоциды, активаторы роста растений, регуляторы роста растений, родентициды, синергисты и вируциды (см. alanwood.net). Конкретные примеры таких веществ включают без ограничения вещества, перечисленные в группе альфа активных ингредиентов.

Выражение "группа альфа активных ингредиентов" (далее "AIGA") означает в совокупности следующие вещества:

(1) (3-этоксипропил)бромид ртути, 1,2-дибромэтан, 1,2-дихлорэтан, 1,2-дихлорпропан, 1,3-дихлорпропен, 1-MCP, 1-метилциклопропен, 1-нафтол, 2-(октилтио)этанол, 2,3,3-ТРА, 2,3,5-триодбензойную кислоту, 2,3,6-ТВА, 2,4,5-Т, 2,4,5-ТВ, 2,4,5-ТР, 2,4-D, 2,4-DB, 2,4-DEB, 2,4-DEP, 2,4-DES, 2,4-DP, 2,4-MCPA, 2,4-MCPB, 2iP, хлорид 2-метоксиэтилртути, 2-фенилфенол, 3,4-ДА, 3,4-DB, 3,4-DP, 3,6-дихлорпиколиновую кислоту, 4-аминопиридин, 4-CPA, 4-CPB, 4-CPD, 4-гидроксибензиловый спирт, 8-гидроксихинолинсульфат, 8-оксихинолилат фенилртути, абамектин, абамектин-аминометил, абсцизовую кислоту, АСС, ацефат, ацеквиноцил, ацетамиприд, ацетион, ацетохлор, ацетофенат, ацетофос, ацетопрол, ацибензолат, ацифлуорфен, аклонифен, ACN, акреп, акринатрин, акролеин, акрилонитрил, ацинонапир, аципетакс, афидопиропен, афоксоланер, алахлор, аланап, аланикарб, албендазол, альдикарб, альдикарб-сульфон, альдиморф, альдоксикарб, альдрин, аллетрин, алицин, аллидохлор, аллозамидин, аллоксидин, аллиловый спирт, алликсикарб, алорак, альфа-циперметрин, альфа-эндосульфат, альфаметрин, алтретамин, фосфид алюминия, фосфид алюминия, аметоктрадин, аметридион, аметрин, аметрин, амбузин, амикарбазон, амикартиазол, амидитион, амидофлумет, амидосульфурон, аминокарб, аминоциклопиррахлор, аминопиралид, аминопирифен, аминотриазол, амипрофос-метил, амипрофос, амипрофос-метил, амисулбром, амитон, амитраз, амитрол, сульфамат аммония, амобам, аморфный силикагель, аморфный диоксид кремния, ампропилфос, AMS, анабазин, анцимидол, анилазин, анилофос, анизу-

рон, антрахинон, анту, афолат, арамит, арпрокарб, оксид мышьяка, асомат, аспирин, асулам, атидатион, атратон, атразин, ауреофунгин, авермектин В1, AVG, авиглицин, азаконазол, азадирахтин, азафенидин, азаметифос, азидитион, азимсульфурон, азинфосетил, азинфос-этил, азинфосметил, азинфос-метил, ази-протрин, азипротрин, азитирам, азобензол, азоциклотин, азотоат, азоксистробин, бахмедеш, барбан, барбанат, гексафторсиликат бария, полисульфид бария, фторсиликат бария, бартрин, основной карбонат меди, основной хлорид меди, основной сульфат меди, ВРСР, бефлубутамид, бефлубутамид-М, беналаксил, беналаксил-М, беназолин, бенкарбазон, бенклотиаз, бэньдациньбинчжи, бендиокарб, бендиоксид, бенефин, бенфлуралин, бенфуракарб, бенфуресат, бэньмихуанцаоань, беноданил, беномил, беноксакор, беноксафос, бенквинокс, бенсульфурон, бенсулид, бенсултап, бенталурон, бентазон, бентазон, бентиаваликарб, бентиазол, бентиокарб, бентранил, бензадокс, хлорид бензалкония, бензамакрил, бензамизол, бензаморф, гексахлорбензол, бензфендизон, бензимин, бензипрам, бензобициклон, эндосульфат, бензофенап, бензофлуор, бензогидроксамовую кислоту, бензомат, бензофосфат, бензотиадиазол, бензовиндифлупир, бензоксимат, бензоилпроп, бензпиримоксан, бензтиазурон, бэньцзоцаотун, бензилбензоат, бензиладенин, берберин, бета-цифлутрин, бета-циперметрин, бетоксазин, ВНС, биалафос, бициклопирин, бифеназат, бифенокс, бифентрин, пифуцзюньчжи, биланафос, бинапакрил, бинцинсяо, биоаллетрин, биоэтанометрин, биоперметрин, биоресметрин, бифенил, бисазир, бисмертиазол, бисмертиазол-медь, бисметилнди-(х-нафталин-у-сульфонат) фенилртути, биспирибак, бистрифлурон, бисултап, битертанол, битионол, биксафен, бикслозон, бластицидин-S, буру, Бордосскую смесь, борную кислоту, боскалид, ВРРР, брасинолид, брасинолид-этил, бревиколин, бродифакум, брофенпрокс, брофенвалерат, брофланилид, брофлутринат, бромацил, бромадиолон, бромхлофос, брометалин, брометрин, бромфенвинфос, бромацетамид, бромобонил, бромобутид, бромоциклен, бромоциклен, бром-DDT, бромофеноксим, бромфос, бромметан, бромфос, бромфос-этил, бромпропилат, бромоталонил, бромоксинил, бромпиразон, бромуконазол, бронопол, BRP, ВТН, букарполат, буфенкарб, буминафос, бупиримат, бупрофезин, Бургундскую смесь, бусульфат, бусульфат, бутаккарб, бутахлор, бутафенацил, бутам, бутамифос, бутанфипрониол, бутатиофос, бутенахлор, бутен-фипрониол, бутетрин, бутидазол, бутиобат, бутиурон, бутифос, бутоккарбоксим, бутонат, бутопириноксил, бутоксикарбоксим, бутралин, бутризол, бутроксидам, бутурон, бутиламин, бутилат, бутилхлорфос, бутилен-фипрониол, какодиловую кислоту, кадусафос, кафенстрол, кальциферол, арсенат кальция, хлорат кальция, цианамид кальция, цианид кальция, полисульфид кальция, калвинфос, камбендихлор, камфехлор, камфору, каптафол, каптан, карбам, карбаморф, карбанолат, карбарил, карбарил, карбасулам, карбатион, карбендазим, карбендазол, карбетамида, карбофенотион, карбофуран, сероуглерод, тетрахлорметан, карбонилсульфид, карбофенотион, карбофос, карбосульфат, карбоксазол, карбоксид, карбоксин, карфентразон, карпропамид, картап, карвакрол, карвон, CAVP, CDAA, CDEA, CDEC, целлоцидин, СЕРС, цералюр, церенокс, сабадиллу, смесь Cheshunt, хиналфос, хиналфос-метил, хинометионат, хинометионат, хиралаксил, хитозан, хлорбентиазон, хлоретоксифен, хлоралозу, хлорамбен, хлорамин фосфора, хлорамфеникол, хлораниформетан, хлоранил, хлоранокрил, хлорантранилипрол, хлоразифоп, хлоразин, хлорбензид, хлорбензулон, хлорбициклен, хлорбромурон, хлорбуфам, хлордан, хлордекон, хлордимеформ, хлоремпентрин, хлоретазат, хлорэтефон, хлорэтоксифос, хлоретулон, хлорфенак, хлорфенапир, хлорфеназол, хлорфенетол, хлорфенидам, хлорфенпроп, хлорфенсон, хлорфенсульфид, хлорфенвинфос, хлорфенвинфос-метил, хлорфлуазурон, хлорфлуразол, хлорфлурекол, хлорфлурен, хлорфлуренол, хлоридазон, хлоримурон, хлоринат, хлор-IPC, хлормефос, хлормекват, сулькотрион, хлорметоксинил, хлорнидин, хлорнитрофен, хлоруксусную кислоту, хлоробензилат, хлординитронафталины, хлорфенизон, хлороформ, хлоромебуформ, хлорометиурон, хлоронеб, хлорофацинон, хлорофос, хлорпикрин, хлоропон, хлоропраллетрин, хлорпропилат, хлороталонил, хлоротолурон, хлорксифенидам, хлороксурон, хлороксинил, хлорфониум, хлорфоксим, хлорпразофос, хлорпрокарб, хлорпрофам, хлорпирифос, хлорпирифос-метил, хлорквинокс, хлорсульфурон, хлортал, хлортиамид, хлортиофос, хлортолулон, хлостолинат, хитозан, холекальциферол, хлорид холина, кромафенозид, циклогексимид, цимектакарб, циметакарб, цинерин I, цинерин II, цинерины, цинидон-этил, цинметилин, циносульфурон, цинтофен, циобутид, цисанилид, цисметрин, клацифос, клефоксидим, кленпирин, кленпирин, клетодим, климбазол, клиодинат, клодинафоп, клоетокарб, клофенцет, клофенотан, клофентезин, клофенвинфос, клофибровую кислоту, клофоп, кломазон, кломепроп, клонитралид, клопроп, клопроксидим, клопиралид, клоквиносет, клорансулам, клозантел, клотианидин, клотримазол, клоксифонак, клоксилакон, клозилаккон, СМА, СММР, СМР, СМУ, кодлеулур, колекальциферол, колофонат, 8-хинолинолат меди, ацетат меди, ацетоарсенит меди, арсенат меди, основной карбонат меди, гидроксид меди, нафтенат меди, олеат меди, оксихлорид меди, силикат меди, сульфат меди, основной сульфат меди, хромат меди и цинка, кумахлор, варфарин, кумафос, кумафурил, кумафос, куматетралил, куметоксистробин, кумитоат, кумоксистробин, СРМС, СРМФ, СРРС, кредазин, крезол, крезоловую кислоту, кримидин, кротамитон, кротоксифос, кротоксифос, круфомат, криолит, куелур, куфранеб, кумилерон, кумилурон, купробам, оксид одновалентной меди, куркуменол, CVMP, цианамид, цианатрин, цианазин, цианофенфос, цианоген, цианофос, циантоат, циантранилипрол, циануровую кислоту, циазофамид, цибутрин, циклафураамид, цикланилид, цикланилипрол, циклетрин, циклоат, циклогексимид, циклопрат, циклопротрин, циклопиранил, циклопириморат, циклосульфамурон, циклоксаприд, циклоксидим, циклулон, циенопирафен, цифлуфенамид, цифлуметофен, цифлутрин, цигалодиамид, цигалофоп, цигалотрин, цигексатин, цимиа-

зол, цимоксанил, циометринил, ципендазол, циперметрин, циперкват, цифенотрин, ципразин, ципразол, ципроконазол, ципродинил, ципрофурам, ципромид, ципросульфамид, циромазин, цитиоат, цитрекс, даимурон, далапон, даминозид, даютун, дазомет, DBCP, d-камфору, DCB, DCIP, DCPA (Япония), DCPA (США), DCPTA, DCU, DDD, DDPP, DDT, DDVP, дебакарб, декафентин, декаметрин, декарбофуран, диэтилтолуамид, дегидроуксусную кислоту, дикват, делахлор, диоксатион, дельтаметрин, демефион, демефион-О, демефион-S, деметон, деметон-метил, деметон-О, деметон-О-метил, деметон-S, деметон-S-метил, деметон-S-метилсульфон, деметон-S-метилсульфон, DEP, биоаллетрин, ротенон, десмедифам, десметрин, десметрин, д-фаньшилюцюэбинцзюйчжи, диафентиурон, диалифор, диалифос, диаллат, диаллат, диамидафос, дианат, диатомовую землю, диатомит, диазинон, дибром, дибутилфталат, дибутилсукцинат, дикамбу, дикаптон, дихлобенил, дихлобентиазокс, дихлофентион, дихлофлуанид, дихлон, дихлоральмочевину, дихлорбензурон, дихлорфенидим, дихлорфлурекол, дихлорфлуренол, дихлормат, дихлормид, дихлорметан, дихлорофен, дихлорпроп, дихлорпроп-Р, дихлорвос, дихлозолин, дихлозолин, диклбутразол, диклоцимет, диклофоп, дикломезин, диклоран, дихлоромезотиаз, диклосулам, дикофол, дикофан, дикумарол, дикрезил, дикротофос, дикрил, дикумарол, дицикланил, дициклонон, диелдрин, диенохлор, диетамкват, диетатил, диэтион, диэтион, диэтионкарб, диетолат, диэтон, диэтилпирокарбонат, диэтилтолуамид, дифенакум, дифенокназол, дифенонпентен, дифеноксурон, дифензокват, дифетиалон, дифловидазин, дифлубензурон, дифлуфеникан, дифлуфениканил, дифлуфензопир, дифлуметорим, дикегулак, дилор, диматиф, димефлутрин, димефокс, димефурун, тиосултап-динатрий, димепиперат, диметахлон, диметан, диметакарб, диметахлон, диметахлор, диметаметрин, диметенамид, диметенамид-Р, диметипин, диметиримол, диметоат, диметоморф, диметрин, диметилкарбат, диметилдисульфид, диметилфталат, диметилвинфос, диметилан, димексано, димидазон, димоксистеробин, димпропиридаз, димпилат, димурон, динекс, динцзюньэцзо, диниконазол, диниконазол-М, динитрамин, динитрофенолы, динобутон, динокап, динокап-4, динокап-6, диноктон, динофенат, динопентон, динопроп, диносам, диносеб, диносальфон, динотефуран, динотерб, динотербон, диофенолан, диоксабензофос, диоксакарб, диоксатион, диокатион, дифацин, дифацинон, дифенандион, дифенамид, дифенамид, дифенилсульфон, дифениламин, дифенилсульфид, дикегулак, дипропалин, дипропетрин, диптерекс, дипиметитрон, дипиритион, дикват, тетраборат динатрия, тиосултап-динатрий, диспарлюр, дикамбу, дизул, дисульфирам, дисульфотон, диталимфос, дитианон, дитикрофос, дитиоэфир, дитиометон, дитиопир, диурон, диксантоген, д-лимонен, DMDS, DMPA, DNOC, додеморф, додидин, додин, дофенапин, догуадин, доминиалюр, дорамектин, DPC, дразоксолон, DSMA, д-транс-аллетрин, д-транс-ресметрин, дуфулин, димрон, EBER, EBP, кадусафос, экдистерон, этридиазол, EDB, EDC, EDDP, эдифенфос, эглиназин, эмаметин, ЕМРС, эмпентрин, энаденин, эндосульфат, эндотал, эндотал, эндотион, эндрин, энестробурун, энилконазол, эноксастробин, хлорфенсон, EPN, эпоколеон, эпофенонон, эпоксиконазол, эприномектин, эпроназ, эпсилон-метофлутрин, эпсилон-момфлуоротрин, EPTC, эрбон, эргокальциферол, эрлюоцзияньцаоань, эсдепаллетрин, эсфенвалерат, ESP, эспрокарб, этаселасил, этаконазол, этафос, этем, этабоксам, этахлор, эталфлуралин, этаметсульфурун, этапрохлор, этефон, этидимурон, этиофенкарб, этиолат, этион, этиозин, этипрол, этиримол, этоат-метил, этобензанид, этофумезат, этогексадиол, этопроп, этопрофос, этоксифен, этоксикин, этоксисульфурон, этихлозат, этилформиат, этилпирофосфат, этилан, этил-DDD, этилен, этилендибромид, этилендихлорид, этиленоксид, этилицин, 2,3-дигидроксипропилмеркаптит этилртути, этилмеркурацетат, этилмеркурбромид, этилмеркурхлорид, этилмеркурфосфат, этинофен, ЕТМ, этнипромид, этобензанид, этофенпрокс, этоксазол, этридиазол, этримфос, этримфос, эвгенол, EXD, фамоксадон, фамфур, фенак, фенамидон, фенаминосульф, фенаминстробин, фенамифос, фенапанил, фенаримол, феназулам, феназафлор, феназаквин, фенбуконазол, оксид фенбутатина, фенхлоразол, фенхлофос, фенхлорфос, фенклорим, фенетакарб, фенфлутрин, фенфурам, фенгексамид, фенидин, фенитропан, фенитропион, фенизон, фэньцзюньтун, фенобукарб, фенолово, фенопроп, фенотиокарб, феноксакрим, феноксанил, феноксапроп, феноксапроп-Р, феноксасульфат, феноксикарб, фенпиклонил, фенпикоксамид, фенпиритрин, фенпропатрин, фенпропидин, фенпропиморф, фенпиразамин, фенпироксимат, фенквинотрион, фенридазон, фензон, фенсульфотион, фентеракол, фентиапроп, фентион, фентион-этил, фентиапроп, фенолово, фентразамид, фентрифанил, фенурон, фенурон-ТСА, фенвалерат, фербам, феримзон, фосфат трехвалентного железа, сульфат двухвалентного железа, фипронил, флампроп, флампроп-М, флазасульфурон, флокумафен, флометоквин, флониамид, флорасулам, флорпираульфен, флорилпикоксамид, флауакрипирим, флаузаиндолизин, флауазифоп, флауазифоп-Р, флауазинам, флауазолат, флауазурон, флубендиамид, флубензимин, брофлутринат, флукарбазон, флусетосульфурон, флухлоралин, флукофурун, флуциклоксурон, флуцитринат, флудиоксонил, флуенетил, флуенетил, флуенсульфон, флуфенацет, флуфенерим, флуфеникан, флуфеноксурон, флуфеноксистеробин, флуфенпрокс, флуфенпир, флуфензин, флуфипрол, флугексафон, флуиндапир, флуметрин, флуметовер, флуметралин, флуметсулам, флумезин, флумиклорак, флумиоксазин, флумипропин, флуморф, флуометурон, флуопиколид, флуопимомид, флуопирам, флуорбензид, флуоридамид, флуороацетамид, фторуксусную кислоту, фторхлоридон, флуородифен, флуорогликофен, фтороимид, фторомид, флуоромидин, флуоронитрофен, флуороксипир, флуотиурон, флуотримазол, флуоксапипролин, флуоксастробин, флупоксам, флупропацил, флупропадин, флупропанат, флупиррадифурун, флупиримин, флупирсульфурун, флуоквинконазол, флураланер, флуразол, флурекол, флуренол, флуридон, флуорохлоридон, флуоромидин, флуороксипир, флуорпримидол, флуор-

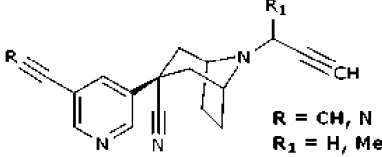
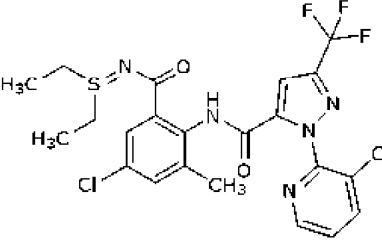
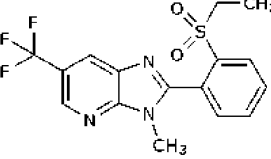
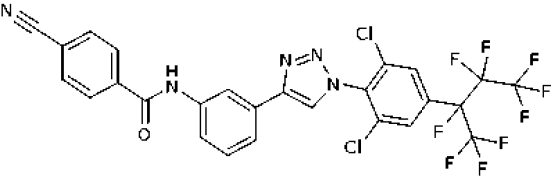
суламид, флуртамон, флузилазол, флусульфамид, флутензин, флутиацет, флутиамид, флутианил, флуто- ланил, флутриафол, флювалинат, флуksamетамид, флуksапироксад, флуksофеним, фолпел, фолпет, фоме- сафен, фонофос, форамсульфурон, форхлорфенурон, формальдегид, форметанат, формотион, формпара- нат, фосамин, фосетил, фосметилан, фоспират, фосиазат, фосигэтан, фронталин, фталид, фуберидазол, фуцаоцин, фуцаоми, фуцзюньманьчжи, фужуми, кумафурин, фунайхэцаолин, фуфентиомочевини, фу- ралан, фуралаксил, фураметрин, фураметпир, фурантебуфенозид, фуратиокарб, фуркарбанил, фуркона- зол, фурконазол-цис, фуретрин, фурфурол, фурилазол, фурмециклокс, фуорофанат, фурилоксифен, гамма- ВНС, гамма-цигалотрин, гамма-НСН, генит, гиббереллиновую кислоту, гиббериллин АЗ, гиббереллины, глифтор, глифтор, глюкохлоралозу, глюофозинат, глюофозинат-Р, глиодин, глиоксим, глифосат, глифосин, госсиплур, грандлур, гризеофулвин, гуаноктин, гуазатин, галакринат, галауксифен, галфенпрокс, гало- фенозид, галосафен, галосульфурон, галоксидин, галоксифоп, галоксифоп-Р, галоксифоп-В, НСА, НСВ, НСН, алтретамин, хемпу, НЕОД, гептахлор, гептафлутрин, гептеносфос, гептопаргил, гербимицин, гер- бимицин А, гетерофос, гексахлор, гексахлорам, гексахлорацетон, гексахлорбензол, гексахлорбутадиеи, гексахлорофен, гексаконазол, гексафлумурон, гексафторамин, гексафлуурат, гексалур, гексами, гексази- он, гексилтиофос, гекситазокс, ННДН, голосулф, гомобрассинолид, хуаньцаово, хуаньчунцин, хуан- цаолин, хуаньцзюньцзо, гидраметилнон, гидраргафен, гашеную известь, цианамид, цианистый водород, гидропрен, гидроксиизоксазол, гимексазол, хиквинкарб, IAA, IBA, IVP, икаридин, имазалил, имазамета- бенз, имазамокс, имазапик, имазапир, имазакин, имазетапир, имазосульфурон, имибенконазол, имициа- фос, имидаклоприд, имидаклотиз, иминоктадин, имипротрин, инабенфид, инданофан, индазифлам, ин- доксакарб, инезин, диатомовую землю, инпирфлуksаm, йодобонил, йодокарб, йодфенфос, йодметан, йо- досульфурон, иофенсульфурон, иоксинил, ипазин, IРС, ипконазол, ипфенкарбазон, ипфентрифлуконазол, ипфлуфенквин, ипробенфос, ипродион, ипроваликарб, ипримидам, ипсдиенол, ипсенол, IPSP, IPX, иза- мидофос, изазофос, изобензан, изокарбамид, изокарбамид, изокарбофос, изоцил, изоциклосорам, изо- дрин, изофенфос, изофенфос-метил, изофетамид, изофлуципрам, изолан, изометиозин, изонорурон, изо- памфос, изополинат, изопрокарб, изопроцил, изопропалин, изопропазол, изопропиолан, изопротурон, изопиразам, изопиримол, изотиоат, изотианил, изоурон, изоваледион, изоксабен, изоксахлортол, изокса- дифен, изоксафлутол, изоксапирифоп, изокатион, изурон, ивермектин, изоксабен, изопамфос, изопам- фос, жапонилур, жапотрины, жасмолин I, жасмолин II, жасмоновую кислоту, цзяхуанчунцзун, цзяцзи- зэнсяолин, цзясянцзюньчжи, цзецаовань, цзецаоси, валидамицин А, йодофенфос, ювенильный гормон I, ювенильный гормон II, ювенильный гормон III, кадетрин, каппа-бифентрин, каппа-тефлутрин, карбути- лат, каретазан, касугамицин, кэцзюньлин, келеван, кетоспирадокс, кизельгур, кинетин, кинопрен, кирала- ксил, крезоксим-метил, куйцаоси, лактофен, лямбда-цигалотрин, ланкотрион, латилур, арсенат свинца, ленацил, лепимектин, лептофос, лянбэньцинчжи, полисульфид кальция, линдан, линеатин, линурон, лиримфос, литлур, луплур, лотиланер, люфенурон, люфуцинчунсяньань, люсяньцаолин, людинцзюнь- чжи, люфумицзюйчжи, люсяньцаолин, литидатион, М-74, М-81, МАА, фосфид магния, малатон, мал- дисон, малеиновый гидразид, малонобен, мальтодекстрин, МАМА, манкоппер, манкозоб, мандестробин, мандипропамид, манеб, матрин, мазидокс, МСС, МСР, МСРА, МСРА-тиоэтил, МСРВ, МСРР, мебенил, мекарбам, мекарбинзид, мекарфон, мекопроп, мекопроп-Р, медемформ, мединотерб, медлур, мефен- ацет, мефеноксам, мефенпир, мефентрифлуконазол, мефлуидид, мегатомоевую кислоту, мирициловый спирт, мелитоксин, МЕМС, меназон, МЕР, мепанипирим, меперфлутрин, мефенат, мефосфолан, мепик- ват, мепронил, мептилдинокап, меркаптодиметур, меркаптофос, меркаптофостиол, меркаптотион, хлор- ную ртуть, оксид ртути, хлорид одновалентной ртути, мерфос, мерфос-оксид, мезопразин, мезосульфу- рон, мезотрион, месульфен, месульфенфос, месульфен, метакрезол, метафлумизон, металаксил, металак- сил-М, метальдегид, метам, метамифоп, метамитрон, метафос, метаксон, метазахлор, метазосульфурон, метазоксолон, меткамифен, метконазол, метепу, метфлуразон, метабензтиазурон, метакрифос, металпро- палин, метам, метамидофос, метасульфоккарб, метазол, метфуроксам, метибензулон, метидатион, метио- бенкарб, метиокарб, метиопирисульфурон, метиотепу, метиозолин, метиурон, метокротофос, метолкарб, метометон, метомил, метопрен, метопротрин, метопротрин, метоквин-бутил, метотрин, метоксиклор, метоксифенозид, метоксифенон, метилафолат, метилбромид, метилэвгенол, метилйодид, метилизотио- цианат, метилпаратион, метилацетофос, метилхлороформ, метилдитиокарбаминовою кислоту, метил- димрон, метиленхлорид, метил-изофенфос, метилмеркаптофос, метилмеркаптофос-оксид, метилмеркап- тофос-тиол, бензоат метилртути, дициандиамида метилртути, пентахлорфеноксид метилртути, метилнео- деканамид, метилнитрофос, метилтриазотион, метиозолин, метирам, метирам-цинк, метобензулон, ме- тобромурон, метофлутрин, метолахлор, метолкарб, метометурон, метоминостробин, метосулам, меток- садиазон, метоксурон, метрафенон, метриам, метрибузин, метрифонат, метрифонат, метсульфовакс, мет- сульфурон, метилтетрапрол, мевинфос, мексакарбат, мечувэй, мешуань, пентметрин, милбебектин, мил- бемицин-оксим, мильнеб, миманьань, мипафокс, МIPС, мирекс, MNAF, могучунь, молинат, молосултап, момфлуоротрин, моналид, монисоурон, семиамитраз, монохлоруксусную кислоту, монокротофос, моно- линурон, мономегино, сульфирам, моносульфурон, моносултап, монурон, монурон-ТСА, морфамкват, мороксидин, морфотион, морзид, моксидектин, МРМС, MSMA, МТМС, мускалор, миклобутанил, мик- лозолин, мирициловый спирт, N-(этилртуть)-п-толуолсульфонанилид, NAA, NAAm, набаи, нафталофос, налед, нафталин, нафталинацетамид, нафталиновый ангидрид, нафталофос, нафтоксиуксусные кислоты,

нафтилуксусные кислоты, нафтилиндан-1,3-дионы, нафтилоксиуксусные кислоты, напроанилид, напропамид, напропамид-М, напталам, натамицин, NBPOS, небмочевину, небурон, эндрин, неоникотин, нилхлорфос, никлофен, никлосамид, никобифен, никосульфурон, никотин, сульфат никотина, нифлуридил, никомицины, NIP, нипираклофен, нипиралофен, нитенпирам, нитиазин, нитралин, нитрапирин, нитрилакарб, нитрофен, нитрофлуорфен, нитростирен, нитротал-изопропил, нобормид, нонанол, норбормид, норурон, норфлуразон, норникотин, норурон, новалурон, новифлумурон, NPA, нуаримол, нуранон, ОСН, октахлордипропиловый эфир, октилинон, о-дихлорбензол, офурас, ометоат, о-фенилфенол, орбенкарб, орфралюр, ортобенкарб, ортодихлорбензол, ортосульфамурон, орикталюр, оризастробин, оризалин, остол, остол, острамон, оватрон, овекс, оксабетринил, оксадиаргил, оксадиазон, оксациксил, оксамат, оксамил, оксапиразон, оксапиразон, оксасульфурон, оксатиапипролин, оксазикломефон, оксасосульфил, оксиную медь, оксин-Сс, оксолиновую кислоту, окспоконазол, оксикарбоксин, оксидеметон-метил, оксидефос, оксидисульфотон, оксиенаденин, оксифлуорфен, оксиматрин, окситетрациклин, окситиоквинокс, РАС, паклобутразол, пайчундин, паллетрин, РАР, пара-дихлорбензол, парафлуорон, паракват, паратион, паратион-метил, паринол, Парижскую зелень, РСНВ, РСР, РСР-Na, п-дихлорбензол, PDJ, пебулат, пединекс, пефуразоат, пеларгоновую кислоту, пенконазол, пенцикурон, пендиметалин, пенфенат, пенфлуфен, пенфлуорон, пеноксалин, пеноксулам, пентахлорфенол, пентахлорфениллаурат, пентанохлор, пентиопирад, пентметрин, пентоксазон, перхлордекон, перфлуидон, перметрин, петоксамид, РНС, фенамакрил, фенамакрил-этил, фенаминосульф, оксид феназина, фенетакарб, фенизофам, фенкаптон, фенмедифам, фенмедифам-этил, фенобензулон, фентиол, фенотрин, фенпроксид, фентоат, фенилмеркуромочевина, фенилмеркурацетат, фенилмеркурхлорид, производное пирокатехина и фенилртути, фенилмеркурнитрат, фенилмеркурсалицилат, форат, фосацетим, фозалон, фосаметин, фосазетим, фосазетин, фосциклотин, фосдифен, фосэтил, фосфолан, фосфолан-метил, фосглицин, фосмет, фоснихлор, фосфамид, фосфамидон, фосфин, фосфинотрицин, фосфокарб, фосфор, фостин, фоксим, фоксим-метил, фталид, фталофос, фталтрин, пикарбутразокс, икаридин, пихлорам, пиколинафен, пикоксистробин, пимарицин, пиндон, пиноксаден, пипералин, пиперазин, пиперонилбутоксид, пиперонилциклонен, пиперофос, пипроктавил, пипроктавил, пипротал, пириметафос, пиримикарб, пириминил, пиримиоксифос, пиримифос-этил, пиримифос-метил, пиндон, пивалдион, плифенат, РМА, РМР, полибутены, поликарбамат, полихлоркамфен, полиэтоксихинолин, полиоксин D, полиоксины, полиоксорим, политиалан, арсенит калия, азид калия, цианат калия, этилксантат калия, нафтенат калия, полисульфид калия, тиоцианат калия, рр'-DDT, праллетрин, прекоцен I, прекоцен II, прекоцен III, претилахлор, примидофос, примисульфурон, пробеназол, прохлораз, проклонол, проциазин, процимидон, продиамин, профенофос, профлуазол, профлуралин, профлутрин, профоксидим, профурит-аминий, проглиназин, прогексадион, прогидрожасмон, промацил, промекарб, прометон, прометрин, прометрин, промурит, пронамид, пронитридин, пропахлор, пропафос, пропамидин, пропамокарб, пропанил, пропафос, пропаквизафоп, пропаргит, пропартрин, пропазин, пропетамфос, профам, пропиконазол, пропидин, пропиенеб, пропиэохлор, пропоксур, пропоксикарбазон, пропилизом, пропиписульфурон, пропизамид, проквиназид, просулер, просульфалин, просульфоккарб, просульфурон, протидатион, протиокарб, протиоконазол, протифос, протоат, протрифенбут, проксан, примидофос, принахлор, псорален, псорален, пиданон, пидифлуметофен, пифллубумид, пиметрозин, пиракарболид, пираклофос, пираклонил, пиракlostробин, пирафлуфен, пирафлупрол, пирамат, пираметостробин, пираоксистробин, пирапропон, пирасульфотол, пиразифлумид, пиразолат, пиразолинат, пиразон, пиразофос, пиразосульфурон, пиразотион, пиразоксифен, пиресметрин, пиретрин I, пиретрин II, пиретрины, пирибамбенз-изопропил, пирибамбенз-пропил, пирибенкарб, пирибензоксим, пирибутикарб, пирихлор, пиридабен, пиридахлометил, пиридафол, пиридалил, пиридафентион, пиридафентион, пиридат, пиридинитрил, пирифенокс, пирифлуквиназон, пирифталид, пириметафос, пириметанил, пиримикарб, пиримидифен, пириминобак, пириминостробин, пиримифос-этил, пиримифос-метил, пиримисульфам, пиримитат, пиринурон, пириофенон, пирипрол, пирипропанол, пирипроксифен, пирозоксазол, пиритиобак, пиролан, пироквилон, пироксасульфон, пироксулам, пироксихлор, пироксифур, циньцаосуань, сайцзюньмао, квасию, квиначетол, квиналфос, квиналфос-метил, квиназамид, квинклолак, квинконазол, квинмерак, квинокламин, квинофумелин, квинометионат, квинонамид, квинотион, квиноксифен, квинтиофос, квинтозен, квизалофоп, квизалофоп-Р, цюйвэньчжи, цюйиндин, рабензазол, рафоксанид, R-диниконазол, ребемид, реглон, ренридулон, рескалур, ресметрин, родетанил, родожапонин-III, рибавирин, римсульфурон, ризазол, R-металаксил, родетанил, фенхлорфос, ротенон, рианию, сабадиллу, сафлуфенацил, сайцзюньмао, сайсэнтьун, салициланилид, салифлуофен, сангвинарин, сантонин, сароланер, S-биоаллетрин, шрадан, скиллирозид, себутилазин, секбуметон, седаксан, селамектин, семиамитраз, сезамекс, сезамалин, дизул, сетоксидим, карбарил, шуанцзяньцаолин, шуанцзяньцаолин, S-гидропрен, сидурон, сыфумицзюйчжи, сиглур, силафлуофен, силатран, силикатный аэрогель, силикагель, силтиофам, силтиофам, силтиофан, силвекс, симазин, симеконазол, симетон, симетрин, симетрин, синтофен, S-кинопрен, гашеную известь, SMA, S-метопрен, S-метолахлор, арсенит натрия, азид натрия, хлорат натрия, цианид натрия, фторид натрия, фторацетат натрия, гексафторсиликат натрия, нафтенат натрия, о-фенилфеноксид натрия, ортофенилфеноксид натрия, пентахлорфенолят натрия, пентахлорфеноксид натрия, полисульфид натрия, фторосиликат натрия, тетраиокарбонат натрия, тиоцианат натрия, пентанохлор, софамид, спинеторам, спиносад, спиридикло-

фен, спиромезифен, спиропидион, спиротетрамат, спироксамин, стирофос, стрептомицин, стрихнин, сулкатол, сулкофурун, сулькотрион, сульфаллат, сульфентразон, сульфирам, сульфлурамид, сульфодиазол, сульфометурон, сульфосат, сульфосульфурон, сульфотеп, сульфотеп, сульфоксафлор, сульфоксид, сульфоксим, серу, серную кислоту, сульфурилфторид, сулгликапин, сульфосат, сульпрофос, сультропен, свел, тау-флювалинат, таврон, тазимкарб, ТВТО, ТВЗ, ТСА, ТСВА, ТСМТВ, ТСНВ, ТДЕ, тебуконазол, тебуфенозид, тебуфенпирад, тебуфлоквин, тебупиримфос, тебутам, тебутиурон, теклофталам, текназен, текорам, тедион, тефлубензурун, тефлутрин, тефурилтрион, темботрион, темефос, темефос, тепу, ТЕРР, тепралоксидим, тепролоксидим, тераллетрин, тербацил, тербукарб, тербухлор, тербуфос, тербуметон, тербутилазин, тербутол, тербутрин, тербутрин, квинтозен, окситетрациклин, окситетрациклин, тетсиклассис, тетфлупиролимет, тетрахлорантранилипрол, тетрахлорэтан, тетрахлорвинфос, тетраконазол, тетрадифон, тетрасул, тетрафлурун, тетраметрин, тетраметилфлутрин, тетрамин, тетранактин, тетранилипрол, тетрапион, тетрасул, сульфат таллия, сульфат таллия, тенилхлор, тета-циперметрин, тиабендазол, тиаклоприд, тиадиазин, тиадифлуор, тиаметоксам, тиаметурон, тиапронил, тиазафлурун, тиазафлурун, тиазон, тиазопир, тикрофос, тициофен, тидиазимин, тидиазурун, тиенкарбазон, тифенсульфурун, тифлузамид, тимеросал, форат, тиобенкарб, тиокарбоксам, тиохлорфенфим, тиохлорфенфим, динитрототиоцианатобензолы, тиоциклам, тиодан, тиодиазол-медь, тиодикарб, тиофаноккарб, тиофанокс, тиофлуоксимат, тиохемпу, тиомерсал, тиометон, тионазин, тиофанат, тиофанат-этил, тиофанат-метил, тиофос, тиоквинокс, тиосемикарбазид, тиосултап, тиотепу, тиоксамил, тирам, тиурам, турингиенсин, тиабендазол, тиадинил, тиафенацил, дяоцзеань, ТВА, тифатол, тиокарбазил, тиоклорим, тиоксазафен, тиоксимид, тирпат, ТМТД, толклофос-метил, толфенпирад, толпрокарб, толпиралат, толифлуанид, толилфлуанид, толилмеркурацетат, томарин, топрамезон, токсафен, ТРН, тралкоксидим, тралоцитрин, тралометрин, тралопирил, трансфлутрин, трансперметрин, третамин, триаконтанол, триадимефон, триадименол, триафамон, триаллат, триаллат, триамифос, триапентенол, триаратен, триаримол, триасульфурон, триазамат, триазбутил, триазилам, триазофос, триазотион, триазоксид, трехосновный хлорид меди, трехосновный сульфат меди, трибенурун, трибуфос, оксид трибутилолова, трикамбу, трихламид, трихлопир, трихлорфон, трихлорметафос-3, трихлоронат, трихлорнат, трихлортринитробензолы, трихлорфон, трихлопир, трихлопирикарб, трикрезол, трициклазол, гидроксид трициклогексиллолова, тридеморф, тридифан, триэтазин, трифенморф, трифенофос, трифлуксистробин, трифлуксисульфурон, трифлудимоксазин, трифлумезопирим, трифлумизол, трифлумурон, трифлуралин, трифлусульфурон, трифоп, трифопсим, трифорин, тригидрокситриазин, тримедлур, триметакарб, триметурон, тринексапак, трифенилолово, трипрен, трипропиндан, триптолид, тритак, тритиалан, тритиконазол, тритосульфурон, транк-колл, тоелинь, тиклопирозофлор, униканозол, униканозол-Р, урбацид, уредепу, валерат, валидамицин, валидамицин А, валифеналат, валон, ванидотион, вангард, ванилипрол, вернолат, винклозолин, витамин D3, варфарин, сяочунлюлинь, синьцзюньань, сивоцзюньань, сивоцзюньчжи, ХМС, ксилахлор, ксиленолы, ксиллилкарб, ксимиазол, ишицин, зариламид, зеатин, цзэнсяоань, цзэнсяолинь, зета-циперметрин, нафтенат цинка, фосфид цинка, тиазол цинка, тиазол цинка, трихлорфенат цинка, трихлорфеноксид цинка, цинеб, цирам, золапрофос, зоокумарин, зоксамид, цзоаньцзюньчжи, цзоаоань, цзоцзюньчжи, цзомихуанлун, α -хлоргидрин, α -экдизон, α -мултистриатин, α -нафталинуксусные кислоты и β -экдизон;

(2) следующие соединения в табл. А.

Структура № М - активные ингредиенты

№ М	Структура
M1	 <p>R = CH, N R₁ = H, Me</p>
M2	
M3	
M4	

В контексте данного описания, каждое из вышеуказанного является активным ингредиентом. Для более подробной информации следует обратиться к источнику "Полный перечень общих названий пестицидов", находящийся на Alanwood.net, и к различным изданиям "Справочника пестицидов", включая онлайн-издание, представленные на bcpdata.com.

Особенно предпочтительный выбор активных ингредиентов представляет собой 1,3-дихлорпропен, хлорантранилипрол, хлорпирифос, гексафлумурон, метомил, метоксифенозид, новифлумурон, оксамил, спинеторам, спиносид, сульфоксафлор и трифлумезопирим (далее в данном документе "AIGA-2").

Кроме того, другой особенно предпочтительный выбор активных ингредиентов представляет собой ацеквиноцил, ацетамиприд, ацетопрол, авермектин, азинфос-метил, бифеназат, бифентрин, карбарил, карбофуран, хлорфенапир, хлорфлуазурон, хромафенозид, клотианидин, цифлутрин, циперметрин, дельтаметрин, диафентиурон, эмаектина бензоат, эндосульфат, эсфенвалерат, этипрол, этоксазол, фипронил, флониамид, флуакирипирим, гамма-цигалотрин, галофенозид, индоксакарб, лямбда-цигалотрин, луфенурон, малатион, метомил, новалурон, перметрин, пиридалил, пиримидифен, спироциклофен, тебуфенозид, тиаклоприд, тиаметоксам, тиодикарб, толфенпирад и зета-циперметрин (далее "AIGA-3").

Термин "алкенил" означает ациклический, ненасыщенный (по меньшей мере с одной углерод-углеродной двойной связью), разветвленный или неразветвленный заместитель, состоящий из углерода и водорода, например, винил, аллил, бутенил, пентенил и гексенил.

Термин "алкенилокси" означает алкенил, дополнительно содержащий углерод-кислородную одинарную связь, например, аллилокси, бутенилокси, пентенилокси, гексенилокси.

Термин "алкокси" означает алкил, дополнительно содержащий углерод-кислородную одинарную связь, например, метокси, этокси, пропокси, изопропокси, бутокси, изобутокси и трет-бутокси.

Термин "алкил" означает ациклический, насыщенный, разветвленный или неразветвленный заместитель, состоящий из углерода и водорода, например, метил, этил, пропил, изопропил, бутил и трет-бутил.

Термин "алкинил" означает ациклический, ненасыщенный (по меньшей мере с одной углерод-углеродной тройной связью), разветвленный или неразветвленный заместитель, состоящий из углерода и водорода, например, этинил, пропаргил, бутинил и пентинил.

Термин "алкинилокси" означает алкинил, дополнительно содержащий углерод-кислородную одинарную связь, например, пентинилокси, гексинилокси, гептинилокси и октинилокси.

Термин "арил" означает циклический, ароматический заместитель, состоящий из водорода и углерода, например, фенил, нафтил и бифенил.

Термин "биопестицид" означает микробное биологическое средство для борьбы с вредителями, которое, как правило, применяют аналогичным образом, что и химические пестициды. Обычно они являются бактериальными, но также существуют примеры грибковых средств контроля, включая *Trichoderma* spp. и *Ampelomyces quisqualis*. Одним широко известным примером биопестицида является вид *Bacillus*, бактериальное заболевание *Lepidoptera*, *Coleoptera* и *Diptera*. Биопестициды включают продукты на основе энтомопатогенных грибов (например, *Metarhizium anisopliae*), энтомопатогенных нематод (например, *Steinernema feltiae*) и энтомопатогенных вирусов (например, грануловируса *Cydia pomonella*). Другие примеры энтомопатогенных организмов включают без ограничения бакуловирусы, простейшие и микроспоридии. Во избежание сомнений, биопестициды являются активными ингредиентами.

Термин "циклоалкенил" означает моноциклический или полициклический, ненасыщенный (по меньшей мере с одной углерод-углеродной двойной связью) заместитель, состоящий из углерода и водорода, например, циклобутенил, циклопентенил, циклогексенил, норборненил, бицикло[2.2.2]октенил, тетрагидронафтил, гексагидронафтил и октагидронафтил.

Термин "циклоалкенилокси" означает циклоалкенил, дополнительно содержащий углерод-кислородную одинарную связь, например циклобутенилокси, циклопентенилокси, норборненилокси и бицикло[2.2.2]октенилокси.

Термин "циклоалкил" означает моноциклический или полициклический, насыщенный заместитель, состоящий из углерода и водорода, например, циклопропил, циклобутил, циклопентил, норборнил, бицикло[2.2.2]октил и декагидронафтил.

Термин "циклоалкокси" означает циклоалкил, дополнительно содержащий углерод-кислородную одинарную связь, например, циклопропилокси, циклобутилокси, циклопентилокси, норборнилокси и бицикло[2.2.2]октилокси.

Термин "галоген" означает фтор, хлор, бром и йод.

Термин "галогеналкокси" означает алкокси, дополнительно содержащий от одного до максимально возможного числа идентичных или различных атомов галогена, например, фторметокси, трифторметокси, 2,2-дифторпропокси, хлорметокси, трихлорметокси, 1,1,2,2-тетрафторэтокси и пентафторэтокси.

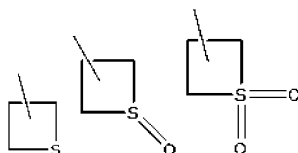
Термин "галогеналкил" означает алкил, дополнительно содержащий от одного до максимально возможного числа идентичных или различных атомов галогена, например, фторметил, трифторметил, 2,2-дифторпропил, хлорметил, трихлорметил и 1,1,2,2-тетрафторэтил.

Термин "гетероциклил" означает циклический заместитель, который может быть ароматическим, полностью насыщенным или частично либо полностью ненасыщенным, причем циклическая структура содержит по меньшей мере один атом углерода и по меньшей мере один гетероатом, при этом указанный гетероатом представляет собой азот, серу или кислород. Примеры представляют собой

(1) ароматические гетероциклильные заместители включают без ограничения бензофуранил, бензоизотиазолил, бензоизоксазол, бензотиенил, бензотиазол, бензоксазол, циннолинил, фуранил, имидазолил, индазолил, индолил, изоиндолил, изохинолинил, изотиазолил, изоксазол, оксадиазолил, оксазолинил, оксазолил, фталазинил, пиразинил, пиразолинил, пиразолил, пиридазинил, пиридил, пиримидинил, пирролил, хиназолинил, хинолинил, хиноксалинил, тетразолил, тиазолинил, тиазолил, тиенил, триазилил и триазолил;

(2) полностью насыщенные гетероциклильные заместители включают без ограничения пиперазинил, пиперидинил, морфолинил, пирролидинил, тетрагидрофуранил и тетрагидропиранил;

(3) частично или полностью ненасыщенные гетероциклильные заместители включают без ограничения 4,5-дигидроизоксазол, 4,5-дигидрооксазол, 4,5-дигидро-1Н-пиразол, 2,3-дигидро-[1,3,4]-оксадиазолил и 1,2,3,4-тетрагидрохинолинил; и (4) дополнительные примеры гетероциклилов включают следующие:



тиетанил тиетанил-оксид и тиетанил-диоксид.

Термин "место обитания" означает среду обитания, место размножения, растение, семя, почву, материал или среду, в которой вредитель растет, может расти или может присутствовать. Например, место обитания может представлять собой

зону, где растут сельскохозяйственные культуры, деревья, плодовые деревья, злаковые культуры, виды кормовых растений, вьющиеся растения, травяные растения и/или декоративные растения;

зону, где постоянно находятся одомашненные животные;

внутренние и внешние поверхности зданий (таких как места, где хранят зерно); материалы для строительства, используемые для зданий (такие как пропитанная древесина); и почва вокруг зданий.

Выражение "MoA-материал" означает активный ингредиент с механизмом действия ("MoA"), указанным в Классификации MoA версии 8.3 от IRAC, находящейся на сайте irac-online.org, где описаны следующие группы.

(1) Ингибиторы ацетилхолинэстеразы (AChE) включают следующие активные ингредиенты: аланикарб, альдикарб, бендиокарб, бенфуракарб, бутокарбоксим, бутоксикарбоксим, карбарил, карбофуран, карбосульфат, этиофенкарб, фенобукарб, форметанат, фуратиокарб, изопрокарб, метиокарб, метомил, метолкарб, оксамил, пиримикарб, пропоксур, тиодикарб, тиофанокс, триазамат, триметакарб, ХМС, ксилкарб, ацефат, азаметифос, азинфос-этил, азинфос-метил, кадусафос, хлорэтоксифос, хлорфенвинфос, хлормефос, хлорпирифос, хлорпирифос-метил, кумафос, цианофос, деметон-S-метил, диазион, дихлорвос/DDVP, дикротофос, диметоат, диметилвинфос, дисульфотон, EPN, этион, этопрофос, фамфур, фенамифос, фенитрион, фентион, фостиазат, гептенофос, изофенфос, изоксатион, малатион, мекарбам, метамидофос, метидатион, мевинфос, монокротофос, налед, ометоат, оксидеметон-метил, паратион, паратион-метил, фентоат, фозалон, форат, фосмет, фосфамидон, фоксим, профенофос, пропетафос, протиофос, пираклофос, пиридафентион, квиналфос, сульфотеп, тебупиримфос, темефос, тербуфос, тетрахлорвинфос, тиометон, триазофос, трихлорфон, вимидотион, пиримифос-метил, имициафос и изопропил-о-(метоксиаминотио-фосфорил)салцилат.

(2) Антагонисты GABA-зависимых хлоридных каналов включают следующие активные ингредиенты: хлордан, эндосульфат, этипрол и фипрониол.

(3) Модуляторы натриевых каналов включают следующие активные ингредиенты: акринатрин, аллетрин, d-цис-транс-аллетрин, d-транс-аллетрин, бифентрин, биоаллетрин, биоаллетрин-S-циклопентенил, биоресметрин, циклопротрин, цифлутрин, бета-цифлутрин, цигалотрин, лямбда-цигалотрин, гамма-цигалотрин, циперметрин, альфа-циперметрин, бета-циперметрин, тета-циперметрин, зета-циперметрин, цифенотрин [(1R)-транс-изомеры], дельтаметрин, эмпентрин [(EZ)-(1R)-изомеры], эсфенвалерат, этофенпрокс, фенпропатрин, фенвалерат, флуцитринат, флуметрин, тау-флювалинат, кадетрин, пиретрины (ромашник), галфенпрокс, фенотрин [(1R)-транс-изомер], праллетрин, ресметрин, силафлуофен, тефлутрин, тетраметрин, тетраметрин [(1R)-изомеры], тралометрин, трансфлутрин, перметрин, DDT и метоксиклор.

(4) Агонисты никотинового ацетилхолинового рецептора (nAChR) включают следующие активные ингредиенты: (4A) ацетамиприд, клотианидин, динотефуран, имидаклоприд, нитенпирам, тиаклоприд, тиаметоксам, (4B) никотин, (4C) сульфоксафлор, (4D) флупирадифуран и (4E) трифлумезопирим.

(5) Аллостерические активаторы никотинового ацетилхолинового рецептора (nAChR) включают следующие активные ингредиенты: спинеторам и спиносат.

(6) Активаторы хлоридных каналов включают следующие активные ингредиенты: абамектин, эмабектин-бензоат, лепимектин и милбемектин.

(7) Миметики ювенильного гормона включают следующие активные ингредиенты: гидропрен, кинопрен, метопрен, феноксикарб и пирипроксифен.

(8) Различные неспецифические ингибиторы (относящиеся к нескольким сайтам) включают следующие активные ингредиенты: метилбромид, хлорпикрин, криолит, сульфурилфторид, буру, борную кислоту, октаборат натрия, борат натрия, метаборат натрия, антимоилтартрат калия, диазомет и метам.

(9) Модуляторы каналов TRPV хордотональных органов включают следующие активные ингредиенты: пиметрозин и пирифлуквиназон.

(10) Ингибиторы роста клещей включают следующие активные ингредиенты: клофентезин, гекситазокс, дифлоvidaзин и этоксазол.

(11) Микробные разрушители мембран средней кишки насекомых включают следующие активные ингредиенты: *B.t. var. israelensis*, *B.t. var. aizawai*, *B.t. var. kurstaki*, *B.t. var. tenebrionensis* и *Bacillus sphaericus*.

(12) Ингибиторы митохондриальной АТФ-синтазы включают следующие активные ингредиенты: тетрадифон, пропаргит, азоклотин, цигексатин, фенбутатин-оксид и диафентиурон.

(13) Разобщающие средства окислительного фосфорилирования, действующие посредством нарушения протонного градиента, включают следующие активные ингредиенты: хлорфенапир, DNOC и сульфлурамид.

(14) Блокаторы каналов никотинового ацетилхолинового рецептора (nAChR) включают следующие активные ингредиенты: бенсултап, картапа гидрохлорид, тиоциклам и тиосултап-натрий.

(15) Ингибиторы биосинтеза хитина, тип 0, включают следующие активные ингредиенты: бистрифлурон, хлорфлуазурон, дифлубензурон, флуциклоксурон, флуфеноксурон, гексафлумурон, люфенурон, новалурон, новифлумурон, тефлубензурон и трифлумурон.

(16) Ингибиторы биосинтеза хитина, тип 1, включают следующий активный ингредиент: бупрофезин.

(17) Средство, нарушающее линьку двукрылых, включает следующий активный ингредиент: циро-

мазин.

(18) Агонисты рецептора экдизона включают следующие активные ингредиенты: хромафенозид, галофенозид, метоксифенозид и тебуфенозид.

(19) Агонисты рецептора октопамина включают следующий активный ингредиент: амитраз.

(20) Ингибиторы транспорта электронов с помощью митохондриального комплекса III включают следующие активные ингредиенты: гидраметилнон, ацеквиноцил, бифеназат и флуаكريпирим.

(21) Ингибиторы транспорта электронов с помощью митохондриального комплекса I включают следующие активные ингредиенты: феназаквин, фенпироксимат, пиримидифен, пиридабен, тебуфенпират, толфенпират и ротенон.

(22) Блокаторы потенциалозависимых натриевых каналов включают следующие активные ингредиенты: индосакарб и метафлумизон.

(23) Ингибиторы ацетил-СоА-карбоксилазы включают следующие активные ингредиенты: спиро-диклофен, спиромезифен и спиротетрамат.

(24) Ингибиторы транспорта электронов с помощью митохондриального комплекса IV включают следующие активные ингредиенты: фосфид алюминия, фосфид кальция, фосфин, фосфид цинка и цианид.

(25) Ингибиторы транспорта электронов с помощью митохондриального комплекса II включают следующие активные ингредиенты: циенопирafen, цифлуметофен и пифллубумид.

(28) Модуляторы рецептора рианодина включают следующие активные ингредиенты: хлорантранилипрол, циантранилипрол и флубендиамид.

(29) Модуляторы хордотональных органов с неопределенным целевым сайтом включают следующий активный ингредиент: флониамид.

Группы 26 и 27 не определены в данной версии схемы классификации. Кроме того, существует группа UN, которая содержит активные ингредиенты неизвестного или неопределенного механизма действия. Данная группа включает следующие активные ингредиенты: азадирахтин, бензоксимат, бромпропилат, хинометионат, дикофол, пептид GS-омега/каппа НХТХ-Nv1a, сернистую известь, пиридалил и серу.

Термин "вредитель" означает организм, который приносит ущерб людям или деятельности человека (например, касающейся сельскохозяйственных культур, пищевых продуктов, домашнего скота и т.д.), при этом указанный организм относится к типам Arthropoda, Mollusca или Nematoda. Конкретными примерами являются муравьи, тли, клопы постельные, жуки, щетинохвостки, гусеницы, тараканы, сверчки, уховертки, блохи, мухи, кузнечики, червовидные личинки, шершни, цикадки настоящие, цикадки, вши, саранча, личинки насекомых, войлочники, клещи, моли, нематоды, слепняки, фулгуроиды, листоблошки, сидячебрюхие, щитовки, чешуйницы, слизни, улитки, пауки, ногохвостки, щитники, симфилы, термиты, трипсы, иксодовые клещи, осы, белокрылки и проволочники.

Дополнительными примерами вредителей являются следующие.

(1) Подтипы Chelicerata, Myriapoda и Hexapoda.

(2) Классы: Arachnida, Symphyla и Insecta.

(3) Отряд Anoplura. Неисключительный перечень конкретных родов включает без ограничения *Haematopinus* spp., *Hoplopleura* spp., *Linognathus* spp., *Pediculus* spp., *Polyplax* spp., *Solenopotes* spp. и *Neohaematopinis* spp.

Неисключительный перечень конкретных видов включает без ограничения *Haematopinus asini*, *Haematopinus suis*, *Linognathus setosus*, *Linognathus ovillus*, *Pediculus humanus capitis*, *Pediculus humanus humanus* и *Pthirus pubis*.

(4) Отряд Coleoptera. Неисключительный перечень конкретных родов включает без ограничения *Acanthoscelides* spp., *Agriotes* spp., *Anthonomus* spp., *Apion* spp., *Apogonia* spp., *Araecerus* spp., *Aulacophora* spp., *Bruchus* spp., *Cerosterna* spp., *Cerotoma* spp., *Ceutorhynchus* spp., *Chaetocnema* spp., *Colaspis* spp., *Ctenicera* spp., *Curculio* spp., *Cyclocephala* spp., *Diabrotica* spp., *Dinoderus* spp., *Gnathocerus* spp., *Hemicoelus* spp., *Heterobostrachus* spp., *Hypera* spp., *Ips* spp., *Lyctus* spp., *Megascelis* spp., *Meligethes* spp., *Mezium* spp., *Niptus* spp., *Otiiorhynchus* spp., *Pantomorus* spp., *Phyllophaga* spp., *Phyllotreta* spp., *Ptinus* spp., *Rhizotrogus* spp., *Rhynchites* spp., *Rhynchophorus* spp., *Scolytus* spp., *Sphenophorus* spp., *Sitophilus* spp., *Tenebrio* spp., и *Tribolium* spp.

Неисключительный перечень конкретных видов включает без ограничения

Acanthoscelides obtectus, *Agrilus planipennis*, *Ahasverus advena*, *Alphitobius diaperinus*, *Anoplophora glabripennis*, *Anthonomus grandis*, *Anthrenus verbasci*, *Anthrenus falvipes*, *Ataenius spretulus*, *Atomaria linearis*, *Attageus unicolor*, *Bothynoderes punctiventris*, *Bruchus pisorum*, *Callosobruchus maculatus*, *Carpophilus hemipterus*, *Cassida vittata*, *Cathartus quadricollis*, *Cerotoma trifurcata*, *Ceutorhynchus assimilis*, *Ceutorhynchus napi*, *Conoderus scalaris*, *Conoderus stigmatosus*, *Conotrachelus nemophar*, *Cotinis nitida*, *Crioceris asparagi*, *Cryptolestes ferrugineus*, *Cryptolestes pusillus*, *Cryptolestes turcicus*, *Cylindrocopturus adpersus*, *Deporaus marginatus*, *Dermestes lardarius*, *Dermestes maculatus*, *Epilachna varivestis*, *Euviolletta peltata*, *Faustinus cubae*, *Hylobius pales*, *Hylotrupes bajulus*, *Hypera postica*, *Hypothenemus hampei*, *Lasioderma serricornis*, *Leptinotarsa decemlineata*, *Limonius canus*, *Liogenys fuscus*, *Liogenys suturalis*, *Lissorhoptrus oryzophilus*, *Lophocateres pusillus*, *Lyctus planicollis*, *Maecolaspis joliveti*, *Melanotus communis*, *Meligethes aeneus*, *Melolontha melolontha*, *Necrobia rufipes*, *Oberea brevis*, *Oberea linearis*, *Oryctes rhinoceros*, *Oryzaephilus mercator*, *Oryzaephilus surinamensis*, *Oulema melanopus*, *Oulema oryzae*, *Phyllophaga cuyabana*, *Polycaon stoutii*, *Popillia japonica*, *Prostephanus truncatus*, *Rhyzopertha dominica*, *Sitona lineatus*, *Sitophilus granarius*, *Sitophilus oryzae*, *Sitophilus zeamais*, *Stegobium paniceum*, *Tenebroides mauritanicus*, *Tribolium castaneum*, *Tribolium confusum*, *Trogoderma granarium*, *Trogoderma variabile*, *Xestobium rufovillosum*, и *Zabrus tenebrioides*.

(5) Отряд Dermoptera. Неисключительный перечень конкретных видов включает без ограничения *Forficula auricularia*.

(6) Отряд Blattaria. Неисключительный перечень конкретных видов включает без ограничения *Blattella germanica*, *Blattella asahinai*, *Blatta orientalis*, *Blatta lateralis*, *Parcoblatta pennsylvanica*, *Periplaneta americana*, *Periplaneta australasiae*, *Periplaneta brunnea*, *Periplaneta fuliginosa*, *Pycnoscelus surinamensis*, и *Supella longipalpa*.

(7) Отряд Diptera. Неисключительный перечень конкретных родов включает без ограничения *Aedes* spp., *Agromyza* spp., *Anastrepha* spp., *Anopheles* spp., *Bactrocera* spp., *Ceratitidis* spp., *Chrysops* spp., *Cochliomyia* spp., *Contarinia* spp., *Culex* spp., *Culicoides* spp., *Dasineura* spp., *Delia* spp., *Drosophila* spp., *Fannia* spp., *Hylemya* spp., *Liriomyza* spp., *Musca* spp., *Phorbia* spp., *Pollenia* spp., *Psychoda* spp., *Simulium* spp., *Tabanus* spp., и *Tipula* spp.

Неисключительный перечень конкретных видов включает без ограничения

Agromyza frontella, *Anastrepha suspensa*, *Anastrepha ludens*, *Anastrepha obliqua*, *Bactrocera cucurbitae*, *Bactrocera dorsalis*, *Bactrocera invadens*, *Bactrocera zonata*, *Ceratitidis capitata*, *Dasineura brassicae*, *Delia platura*, *Fannia canicularis*, *Fannia scalaris*, *Gasterophilus intestinalis*, *Gracillia perseae*, *Haematobia irritans*, *Hypoderma lineatum*, *Liriomyza brassicae*, *Liriomyza sativa*, *Melophagus ovinus*, *Musca autumnalis*, *Musca domestica*, *Oestrus ovis*, *Oscinella frit*, *Pegomya betae*, *Piophilina casei*, *Psila rosae*, *Rhagoletis cerasi*, *Rhagoletis pomonella*, *Rhagoletis mendax*, *Sitodiplosis mosellana*, и *Stomoxys calcitrans*.

(8) Отряд Hemiptera. Неисключительный перечень конкретных родов включает без ограничения *Adelges* spp., *Aulacaspis* spp., *Aphrophora* spp., *Aphis* spp., *Bemisia* spp., *Ceroplastes* spp., *Chionaspis* spp., *Chrysomphalus* spp., *Coccus* spp., *Empoasca* spp., *Euschistus* spp., *Lepidosaphes* spp., *Lagynotomus* spp., *Lygus* spp., *Macrosiphum* spp., *Nephotettix* spp., *Nezara* spp., *Nilaparvata* spp., *Philaenus* spp., *Phytocoris* spp., *Piezodorus* spp., *Planococcus* spp., *Pseudococcus* spp., *Rhopalosiphum* spp., *Saissetia* spp., *Therioaphis* spp., *Toumeyella* spp., *Toxoptera* spp., *Trialeurodes* spp., *Triatoma* spp., и *Unaspis* spp.

Неисключительный перечень конкретных видов включает без ограничения

Acrosternum hilare, *Acyrtosiphon pisum*,
Aleyrodes proletella, *Aleurodicus dispersus*, *Aleurothrix floccosus*, *Amrasca biguttula biguttula*, *Aonidiella aurantii*, *Aphis fabae*, *Aphis gossypii*, *Aphis glycines*, *Aphis pomi*, *Aulacorthum solani*, *Bactericera cockerelli*, *Bagrada hilaris*, *Bemisia argentifolii*, *Bemisia tabaci*, *Blissus leucopterus*, *Boisea trivittata*, *Brachycorynella asparagi*, *Brevinnia rehi*, *Brevicoryne brassicae*, *Cacopsylla pyri*, *Cacopsylla pyricola*, *Calocoris norvegicus*, *Ceroplastes rubens*, *Cimex hemipterus*, *Cimex lectularius*, *Coccus pseudomagnoliarum*, *Dagbertus fasciatus*, *Dichelops furcatus*, *Diuraphis noxia*, *Diaphorina citri*, *Dysaphis plantaginea*, *Dysdercus suturellus*, *Edessa meditabunda*, *Empoasca vitis*, *Eriosoma lanigerum*, *Erythroneura elegantula*, *Eurygaster maura*, *Euschistus conspersus*, *Euschistus heros*, *Euschistus servus*, *Halyomorpha halys*, *Helopeltis antonii*, *Hyalopterus pruni*, *Helopeltis antonii*, *Helopeltis theivora*, *Icerya purchasi*, *Idioscopus nitidulus*, *Jacobiasca formosana*, *Laodelphax striatellus*, *Lecanium corni*, *Leptocorisa oratorius*, *Leptocorisa varicornis*, *Lygus hesperus*, *Maconellicoccus hirsutus*, *Macrosiphum euphorbiae*, *Macrosiphum granarium*, *Macrosiphum rosae*, *Macrosteles quadrilineatus*, *Mahanarva frimbiolata*, *Megacopta cribraria*, *Metopolophium dirhodum*, *Mictis longicornis*, *Myzus persicae*, *Nasonovia ribisnigri*, *Nephotettix cincticeps*, *Neurocolpus longirostris*, *Nezara viridula*, *Nilaparvata lugens*, *Paracoccus marginatus*, *Paratrioza cockerelli*, *Parlatoria pergandii*, *Parlatoria ziziphi*, *Peregrinus maidis*, *Phylloxera vitifoliae*, *Physokermes piceae*, *Phytocoris californicus*, *Phytocoris relativus*, *Piezodorus guildinii*, *Planococcus citri*, *Planococcus ficus*, *Poecilocapsus lineatus*, *Psallus vaccinicola*, *Pseudacysta perseae*, *Pseudococcus brevipes*, *Quadraspidiotus perniciosus*, *Rhopalosiphum maidis*, *Rhopalosiphum padi*, *Saissetia oleae*, *Scaptocoris castanea*, *Schizaphis graminum*, *Sitobion avenae*, *Sogatella furcifera*, *Trialeurodes vaporariorum*, *Trialeurodes abutiloneus*, *Unaspis yanonensis*, и *Zulia entrerriana*.

(9) Отряд Hymenoptera. Неисключительный перечень конкретных родов включает без ограничения

Acromyrmex spp., *Atta* spp., *Camponotus* spp., *Diprion* spp., *Dolichovespula* spp., *Formica* spp., *Monomorium* spp., *Neodiprion* spp., *Paratrechina* spp., *Pheidole* spp., *Pogonomyrmex* spp., *Polistes* spp., *Solenopsis* spp., *Technomyrmex* spp., *Tetramorium* spp., *Vespula* spp., *Vespa* spp., и *Xylocopa* spp.

Неисключительный перечень конкретных видов включает без ограничения

Athalia rosae, *Atta texana*, *Caliroa cerasi*, *Cimbex americana*,
Iridomyrmex humilis, *Linepithema humile*, *Mellifera Scutellata*, *Monomorium minimum*, *Monomorium pharaonis*, *Neodiprion sertifer*, *Solenopsis invicta*, *Solenopsis geminata*, *Solenopsis molesta*, *Solenopsis richteri*, *Solenopsis xyloni*, *Tapinoma sessile*, и *Wasmannia auropunctata*.

(10) Отряд Isoptera. Неисключительный перечень конкретных родов включает без ограничения

Coptotermes spp., *Cornitermes* spp., *Cryptotermes* spp., *Heterotermes* spp.,
Kaloterms spp., *Incisitermes* spp., *Macrotermes* spp., *Marginitermes* spp., *Microcerotermes* spp.,
Procornitermes spp., *Reticulitermes* spp., *Schedorhinotermes* spp., и *Zootermopsis* spp.

Неисключительный перечень конкретных видов включает без ограничения

Coptotermes acinaciformis,
Coptotermes curvignathus, *Coptotermes frenchi*, *Coptotermes formosanus*,
Coptotermes gestroi, *Cryptotermes brevis*, *Heterotermes aureus*, *Heterotermes tenuis*,
Incisitermes minor, *Incisitermes snyderi*, *Microtermes obesi*, *Nasutitermes corniger*,
Odontotermes formosanus, *Odontotermes obesus*, *Reticulitermes banyulensis*, *Reticulitermes grassei*,
Reticulitermes flavipes, *Reticulitermes hageni*, *Reticulitermes hesperus*, *Reticulitermes santonensis*,
Reticulitermes speratus, *Reticulitermes tibialis*, и *Reticulitermes virginicus*.

(11) Отряд Lepidoptera. Неисключительный перечень конкретных родов включает без ограничения

Adoxophyes spp., *Agrotis* spp., *Argyrotaenia* spp., *Cacoecia* spp., *Caloptilia* spp., *Chilo* spp., *Chrysodeixis* spp., *Colias* spp., *Crambus* spp., *Diaphania* spp., *Diatraea* spp.,
Earias spp., *Ephestia* spp., *Epimecis* spp., *Feltia* spp., *Gortyna* spp., *Helicoverpa* spp., *Heliothis* spp.,
Indarbela spp., *Lithocolletis* spp., *Loxagrotis* spp., *Malacosoma* spp., *Nemapogon* spp.,
Peridroma spp., *Phyllonorycter* spp., *Pseudaletia* spp., *Plutella* spp., *Sesamia* spp., *Spodoptera* spp.,
Synanthedon spp., и *Yponomeuta* spp.

Неисключительный перечень конкретных видов включает без ограничения

Achaea janata, Adoxophyes orana, Agrotis ipsilon, Alabama argillacea, Amorbia cuneana, Amyeloides transitella, Anacamptodes defectaria, Anarsia lineatella, Anomis sabulifera, Anticarsia gemmatalis, Archips argyrospila, Archips rosana, Argyrotaenia citrana, Autographa gamma, Bonagota cranaodes, Borbo cinnara, Bucculatrix thurberiella, Capua reticulana, Carposina niponensis, Chlumetia transversa, Choristoneura rosaceana, Cnaphalocrocis medinalis, Conopomorpha cramerella, Corecya cephalonica, Cossus cossus, Cydia caryana, Cydia funebrana, Cydia molesta, Cydia nigricana, Cydia pomonella, Darna diducta, Diaphania nitidalis, Diatraea saccharalis, Diatraea grandiosella, Earias insulana, Earias vittella, Ecdytolopha aurantianum, Elasmopalpus lignosellus, Ephestia cautella, Ephestia elutella, Ephestia kuehniella, Epinotia aporema, Epiphyas postvittana, Erionota thrax, Estigmene acraea, Eupoecilia ambiguella, Euxoa auxiliaris, Galleria mellonella, Grapholita molesta, Hedylepta indicata, Helicoverpa armigera, Helicoverpa zea, Heliothis virescens, Hellula undalis, Keiferia lycopersicella, Leucinodes orbonalis, Leucoptera coffeella, Leucoptera malifoliella, Lobesia botrana, Loxagrotis albicosta, Lymantria dispar, Lyonetia clerkella, Mahasena corbeti, Mamestra brassicae, Manduca sexta, Maruca testulalis, Metisa plana, Mythimna unipuncta, Neoleucinodes elegantalis, Nymphula depunctalis, Operophtera brumata, Ostrinia nubilalis, Oxydia vesulia, Pandemis cerasana, Pandemis heparana, Papilio demodocus, Pectinophora gossypiella, Peridroma saucia, Perileucoptera coffeella, Phthorimaea operculella, Phyllocnistis citrella, Phyllonorycter blancardella, Pieris rapae, Plathypena scabra, Platynota idaeusalis, Plodia interpunctella, Plutella xylostella, Polychrosis viteana, Prays endocarpa, Prays oleae, Pseudaletia unipuncta, Pseudoplusia includens, Rachiplusia ni, Scirpophaga incertulas, Sesamia inferens, Sesamia nonagrioides, Setora nitens, Sitotroga cerealella, Sparganothis pilleriana, Spodoptera exigua, Spodoptera frugiperda, Spodoptera eridania, Thecla basilides, Tinea pellionella, Tineola bisselliella, Trichoplusia ni, Tuta absoluta, Zeuzera coffeae, и Zeuzera pyrina.

(12) Отряд Mallophaga. Неисключительный перечень конкретных родов включает без ограничения

Anaticola spp., *Bovicola* spp., *Chelopistes* spp., *Goniodes* spp., *Menacanthus* spp., и *Trichodectes* spp.

Неисключительный перечень конкретных видов включает без ограничения

Bovicola bovis, Bovicola caprae, Bovicola ovis, Chelopistes meleagridis, Goniodes dissimilis, Goniodes gigas, Menacanthus stramineus, Menopon gallinae, и Trichodectes canis.

(13) Отряд Orthoptera. Неисключительный перечень конкретных родов включает без ограничения *Melanoplus* spp. и *Pterophylla* spp. Неисключительный перечень конкретных видов включает без ограничения

Acheta domesticus, Anabrus simplex, Gryllotalpa africana, Gryllotalpa australis, Gryllotalpa brachyptera, Gryllotalpa hexadactyla, Locusta migratoria, Microcentrum retinerve, Schistocerca gregaria, и Scudderia furcata.

(14) Отряд Psocoptera. Неисключительный перечень конкретных видов включает без ограничения

Liposcelis decolor, Liposcelis entomophila, Lachesilla quercus, и Trogium pulsatorium.

(15) Отряд Siphonaptera. Неисключительный перечень конкретных видов включает без ограничения

Ceratophyllus gallinae, Ceratophyllus niger, Ctenocephalides canis, Ctenocephalides felis, и Pulex irritans.

(16) Отряд Thysanoptera. Неисключительный перечень конкретных родов включает без ограничения

Caliothrips spp., *Frankliniella* spp., *Scirtothrips* spp., и *Thrips* spp.

Неисключительный перечень конкретных видов включает без ограничения

Caliothrips phaseoli, Frankliniella bispinosa, Frankliniella fusca, Frankliniella occidentalis, Frankliniella schultzei, Frankliniella tritici, Frankliniella williamsi, Heliothrips haemorrhoidalis, Rhipiphorothrips cruentatus, Scirtothrips citri, Scirtothrips dorsalis, Taeniothrips rhopalantemalis, Thrips hawaiiensis, Thrips nigropilosus, Thrips orientalis, Thrips palmi, и Thrips tabaci.

(17) Отряд Thysanura. Неисключительный перечень конкретных родов включает без ограничения *Lepisma* spp. и *Thermobia* spp.

- (18) Отряд Acarina. Неисключительный перечень конкретных родов включает без ограничения *Acarus* spp., *Aculops* spp., *Argus* spp., *Boophilus* spp., *Demodex* spp., *Dermacentor* spp., *Epirimerus* spp., *Eriophyes* spp., *Ixodes* spp., *Oligonychus* spp., *Panonychus* spp., *Rhizoglyphus* spp., и *Tetranychus* spp.

Неисключительный перечень конкретных видов включает без ограничения *Acarapis woodi*, *Acarus siro*, *Aceria mangiferae*, *Aculops lycopersici*, *Aculus pelekassi*, *Aculus schlechtendali*, *Amblyomma americanum*, *Brevipalpus obovatus*, *Brevipalpus phoenicis*, *Dermacentor variabilis*, *Dermatophagoides pteronyssinus*, *Eotetranychus carpini*, *Liponyssoides sanguineus*, *Notoedres cati*, *Oligonychus coffeae*, *Oligonychus ilicis*, *Ornithonyssus bacoti*, *Panonychus citri*, *Panonychus ulmi*, *Phyllocoptruta oleivora*, *Polyphagotarsonemus latus*, *Rhipicephalus sanguineus*, *Sarcoptes scabiei*, *Tegolophus perseiflorae*, *Tetranychus urticae*, *Tyrophagus longior*, и *Varroa destructor*.

- (19) Отряд Araneae. Неисключительный перечень конкретных родов включает без ограничения *Loxosceles* spp., *Latrodectus* spp. и *Atrax* spp.

Неисключительный перечень конкретных видов включает без ограничения *Loxosceles reclusa*, *Latrodectus mactans* и *Atrax robustus*.

- (20) Класс Symphyla. Неисключительный перечень конкретных видов включает без ограничения *Scutigera* spp.

- (21) Подкласс Collembola. Неисключительный перечень конкретных видов включает без ограничения *Bourletiella hortensis*, *Onychiurus armatus*, *Onychiurus fimetarius*, и *Sminthurus viridis*.

- (22) Тип Nematoda. Неисключительный перечень конкретных родов включает без ограничения *Aphelenchoides* spp., *Belonolaimus* spp., *Criconemella* spp., *Ditylenchus* spp., *Globodera* spp., *Heterodera* spp., *Hirschmanniella* spp., *Hoplolaimus* spp., *Meloidogyne* spp., *Pratylenchus* spp., и *Radopholus* spp.

Неисключительный перечень конкретных видов включает без ограничения *Dirofilaria immitis*, *Globodera pallida*, *Heterodera glycines*, *Heterodera zea*, *Meloidogyne incognita*, *Meloidogyne javanica*, *Onchocerca volvulus*, *Pratylenchus penetrans*, *Radopholus similis*, и *Rotylenchulus reniformis*.

- (23) Тип Mollusca. Неисключительный перечень конкретных видов включает без ограничения *Arion vulgaris*, *Cornu aspersum*, *Deroceras reticulatum*, *Limax flavus*, *Milax gagates*, и *Pomacea canaliculata*.

Особенно предпочтительная группа вредителей, подлежащих контролю, представляет собой вредителей, питающихся соком растений. Питающиеся соком вредители, как правило, имеют протыкающие и/или всасывающие ротовые части и питаются соком и внутренними растительными тканями растений. Примерами питающихся соком растений вредителей, составляющих конкретную проблему для сельского хозяйства, являются без ограничения тли, цикадки, моли, щитовки, трипсы, листоблошки, войлочники, щитники и белокрылки. Конкретными примерами отрядов, которые включают питающихся соком растений вредителей, составляющих конкретную проблему для сельского хозяйства, являются без ограничения Aporlura и Hemiptera. Конкретные примеры полужесткокрылых, которые представляют собой конкретную проблему для сельского хозяйства, включают без ограничения *Aulacaspis* spp., *Aphrophora* spp., *Aphis* spp., *Bemisia* spp., *Coccus* spp., *Euschistus* spp., *Lygus* spp., *Macrosiphum* spp., *Nezara* spp., и *Rhopalosiphum* spp.

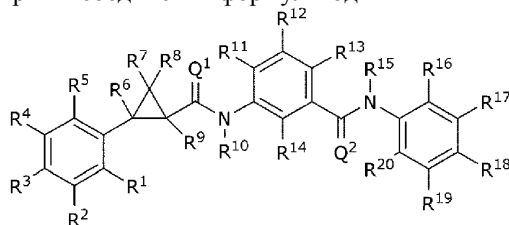
Другой особенно предпочтительной группой вредителей, подлежащих контролю, являются жующие вредители. Жующие вредители, как правило, имеют ротовые части, которые позволяют им пережевывать ткань растений, включая корни, стебли, листья, почки и репродуктивные ткани (включая без ограничения цветы, плоды и семена). Примеры жующих вредителей, составляющих конкретную проблему для сельского хозяйства, включают без ограничения гусениц, жуков, кузнечиков и саранчу. Конкретными примерами отрядов, которые включают жующих вредителей, составляющих конкретную проблему для сельского хозяйства, являются без ограничения Coleoptera и Lepidoptera. Конкретные примеры жесткокрылых, которые представляют собой конкретную проблему для сельского хозяйства, включают без ограничения *Anthonomus* spp., *Ceratomyza* spp., *Chaetocnema* spp., *Colaspis* spp., *Cyclocephala* spp., *Diabrotica* spp., *Hypena* spp., *Phyllorhiza* spp., *Phyllotreta* spp., *Sphenophorus* spp., *Sitophilus* spp.

Фраза "пестицидно эффективное количество" означает количество пестицида, необходимое для достижения заметного эффекта в отношении вредителя, например, эффектов некроза, гибели, замедления развития, предотвращения появления, уничтожения, истребления или другого уменьшения случаев появления и/или активности вредителя в месте обитания. Данный эффект может наступать, когда популяции вредителей покинули место обитания, вредители обезврежены в месте обитания или вокруг места обитания, и/или вредители уничтожены в месте обитания или вокруг места обитания. Разумеется, возможна комбинация данных эффектов. Как правило, размеры популяции, активность вредителей или как разме-

ры популяции, так и активность вредителей необходимо снижать на более чем 50%, предпочтительно более чем на 90% и наиболее предпочтительно на более чем 99%. Как правило, пестицидно эффективное количество для сельскохозяйственных целей составляет от приблизительно 0,0001 г/га до приблизительно 5000 г/га, предпочтительно от приблизительно 0,0001 г/га до приблизительно 500 г/га и еще более предпочтительно от приблизительно 0,0001 г/га до приблизительно 50 г/га.

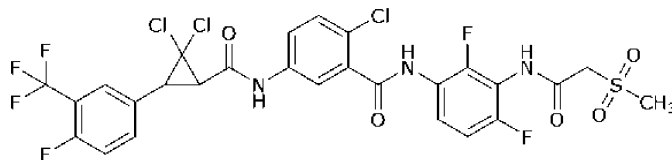
Подробное описание изобретения

В данном документе раскрыты соединения формулы один



Формула один

- где (a) R¹ представляет собой H;
 (b) R² выбирают из группы, состоящей из H, F, Cl, Br, I и (C₁-C₃)галогеналкила;
 (c) R³ выбирают из группы, состоящей из H, F, Cl, Br и I;
 (d) R⁴ выбирают из группы, состоящей из H, F, Cl, Br, I и (C₁-C₃)галогеналкила;
 (e) R⁵ представляет собой H;
 (f) R⁶ представляет собой H;
 (g) R⁷ выбирают из группы, состоящей из F, Cl и Br;
 (h) R⁸ выбирают из группы, состоящей из F, Cl и Br;
 (i) R⁹ представляет собой H;
 (j) Q¹ представляет собой O;
 (k) Q² представляет собой O;
 (l) R¹⁰ представляет собой H;
 (m) R¹¹ представляет собой H;
 (n) R¹² представляет собой H;
 (o) R¹³ выбирают из группы, состоящей из H, F, Cl, Br и I;
 (p) R¹⁴ представляет собой H;
 (q) R¹⁵ представляет собой H;
 (r) R¹⁶, R¹⁷, R¹⁸, R¹⁹ и R²⁰ независимо выбирают из группы, состоящей из H, F, Cl, Br, I и N(R²¹)C(=O)(R²²), где по меньшей мере один, но не более двух из R¹⁶, R¹⁷, R¹⁸, R¹⁹ и R²⁰ представляют собой N(R²¹)C(=O)(R²²);
 (s) R²¹ представляет собой из H;
 (t) R²² выбирают из группы, состоящей из (C₁-C₆)алкил-S(=O)_n-(C₁-C₆)алкила, (C₁-C₆)алкил-S(=O)_n-(C₂-C₆)алкенила, (C₁-C₆)алкил-S(=O)_nарила и (C₁-C₆)алкил-S(=O)_nпиридила, где n=0, 1 или 2, каждый указанный алкил и арил может быть замещен одним или несколькими заместителями, выбранными из группы, состоящей из F, Cl, Br и I, и "арил" означает циклический, ароматический заместитель, состоящий из водорода и углерода, такой как фенил, нафтил и бифенил;
 и его приемлемые с точки зрения сельского хозяйства соли, разделенные стереоизомеры при условии исключения следующего соединения:

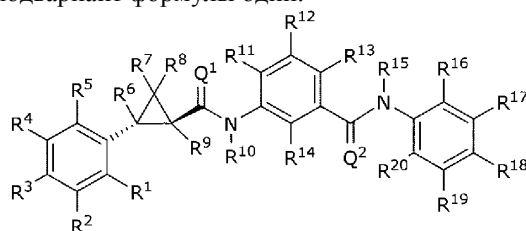


соединение F1299.

Могут присутствовать один или более центров хиральности, в таком случае соединения формулы один могут существовать в виде чистых энантиомеров, смесей энантиомеров, чистых диастереомеров или смесей диастереомеров. Специалистам в данной области техники будет понятно, что один стереоизомер может быть более активным, чем другие стереоизомеры. Отдельные стереоизомеры можно получать посредством известных процедур селективного синтеза, посредством традиционных процедур синтеза с применением разделенных исходных материалов или посредством традиционных процедур разделения. В молекуле могут присутствовать двойные связи, в таком случае соединения формулы один могут существовать в виде отдельных геометрических изомеров (цис или транс, E или Z) или смесей геометрических изомеров (цис и транс, E и Z). Настоящее изобретение охватывает все такие изомеры и их смеси во всех соотношениях. Структуры, раскрытые в настоящем изобретении, могут быть изображены только в одной геометрической форме для ясности, но предполагается, что они отображают все геометрические

формы молекулы.

В одном варианте осуществления соединения формулы один, карбоксамидная группа и фенил, которые соединены с циклопропаном, находятся в R, R-конфигурации, как показано ниже, в формуле два, которая представляет собой подвариант формулы один.



Формула два

В другом варианте осуществления представлено соединение в соответствии с формулой один и формулой два, где R² выбран из группы, состоящей из H, F, Cl, Br, и CF₃.

В другом варианте осуществления представлено соединение в соответствии с формулой один и формулой два, где R³ выбран из группы, состоящей из H, F, Cl, и Br.

В другом варианте осуществления представлено соединение в соответствии с формулой один и формулой два, где R⁴ выбран из группы, состоящей из H, F, Cl, Br и CF₃.

В другом варианте осуществления представлено соединение в соответствии с формулой один и формулой два, где R⁷ представляет собой Cl.

В другом варианте осуществления представлено соединение в соответствии с формулой один и формулой два, где R⁸ представляет собой Cl.

В другом варианте осуществления представлено соединение в соответствии с формулой один и формулой два, где R⁷ и R⁸ представляют собой разные заместители.

В другом варианте осуществления представлено соединение в соответствии с формулой один и формулой два, где R¹³ выбран из группы, состоящей из F, Cl.

В другом варианте осуществления представлено соединение в соответствии с формулой один и формулой два, где R¹⁶, R¹⁸, R¹⁹ и R²⁰ независимо выбраны из группы, состоящей из H, F, Cl, Br, I и R¹⁷ представляет собой N(R²¹)C(=O)(R²²).

В другом варианте осуществления представлено соединение в соответствии с формулой один и формулой два, где R¹⁶, R¹⁷, R¹⁹ и R²⁰ независимо выбраны из группы, состоящей из H, F, Cl, Br, I и R¹⁸ представляет собой N(R²¹)C(=O)(R²²).

В другом варианте осуществления представлено соединение в соответствии с формулой один и формулой два, где R²² выбран из группы, состоящей из (C₁-C₆)алкил-S(=O)_n-(C₁-C₆)алкила, (C₁-C₆)алкил-S(=O)_n-(C₂-C₆)алкенила, (C₁-C₆)алкил-S(=O)_nфенила, (C₁-C₆)алкил-S(=O)_nпиридила, где n=0, 1 или 2, каждый указанный алкил и алкенил может быть замещен одним или несколькими заместителями, выбранными из группы, состоящей из F, Cl, Br и I, и где каждый указанный фенил и пиридил может быть замещен одним или несколькими заместителями, выбранными из группы, состоящей из F, Cl, Br и I.

В другом варианте осуществления представлено соединение в соответствии с формулой один и формулой два,

где R¹ представляет собой H;

R² выбран из группы, состоящей из H, F, Cl и CF₃;

R³ выбран из группы, состоящей из H, F и Cl;

R⁴ выбран из группы, состоящей из H, F, Cl и CF₃;

R⁵ представляет собой H;

R⁷ представляет собой Cl;

R⁸ представляет собой Cl;

Q¹ представляет собой O;

Q² представляет собой O;

R¹⁰ представляет собой H;

R¹¹ представляет собой H;

R¹² представляет собой H;

R¹³ представляет собой Cl;

R¹⁴ представляет собой H;

R¹⁵ представляет собой H;

R¹⁶ представляет собой F;

R¹⁷ представляет собой N(R²¹)C(=O)(R²²);

R¹⁸ представляет собой F;

R¹⁹ представляет собой H;

R²⁰ представляет собой H;

R²¹ представляет собой H; и

R^{22} выбран из группы, состоящей из (C_1-C_6) алкил-S(=O) $_n$ -(C_1-C_6)алкила, (C_1-C_6) алкил-S(=O) $_n$ -(C_2-C_6)алкенила, (C_1-C_6) алкил-S(=O) $_n$ фенила, (C_1-C_6) алкил-S(=O) $_n$ пиридила, где $n=0, 1$ или 2 и каждый указанный алкил, алкенил, фенил и пиридил может быть замещен одним или несколькими заместителями, выбранными из группы, состоящей из F и Cl.

В другом варианте осуществления представлено соединение в соответствии с формулой один и формулой два,

где R^1 представляет собой H;

R^2 выбран из группы, состоящей из H, F, Cl и CF_3 ;

R^3 выбран из группы, состоящей из H, F и Cl;

R^4 выбран из группы, состоящей из H, F, Cl и CF_3 ;

R^5 представляет собой H;

R^7 представляет собой Cl;

R^8 представляет собой Cl;

Q^1 представляет собой O;

Q^2 представляет собой O;

R^{10} представляет собой H;

R^{11} представляет собой H;

R^{12} представляет собой H;

R^{13} представляет собой Cl;

R^{14} представляет собой H;

R^{15} представляет собой H;

R^{16} представляет собой F;

R^{17} представляет собой H;

R^{18} представляет собой $N(R^{21})C(=O)(R^{22})$;

R^{19} представляет собой H;

R^{20} представляет собой H;

R^{21} представляет собой H; и

R^{22} выбран из группы, состоящей из (C_1-C_6) алкил-S(=O) $_n$ -(C_1-C_6)алкила, (C_1-C_6) алкил-S(=O) $_n$ -(C_2-C_6)алкенила, (C_1-C_6) алкил-S(=O) $_n$ фенила, (C_1-C_6) алкил-S(=O) $_n$ пиридила, где $n=0, 1$ или 2 и каждый указанный алкил, алкенил, фенил и пиридил может быть замещен одним или несколькими заместителями, выбранными из группы, состоящей из F и Cl.

В другом варианте осуществления соединение выбрано из табл. 1, предпочтительно соединение выбрано из группы, состоящей из F2, F3, F4, F5, F6, F7, F8, F9, F10, F11, F12, F13, F14, F15, F16, F17, F18, F19, F22, F23, F24, F25, F26, F27, F28, F29, F30, F31, F32, F33, F34, F35, F37, F39, F42, F44, F45, F46, F47, F48, F49, F50, F51, и F52.

В другом варианте осуществления соединения выбрано из табл. 1, более предпочтительно соединение выбрано из группы, состоящей из F3, F5, F6, F10, F12, F13, F14, F15, F16, F17, F18, F19, F23, F27, F28, F29, F31, F32, F37, F39, F46, F47, и F49.

В другом варианте осуществления соединения выбраны из табл. 1, предпочтительно соединения выбраны из группы, состоящей из F15, F16, F17, F18, F19, F21, F23, F24, F25, F32, F34 и F46.

Получение соединения формулы один.

Получение циклопропиламидов.

Циклопропиламиды 1-3, где Q^1 представляет собой O и $R^1, R^2, R^3, R^4, R^5, R^6, R^7, R^8, R^9, R^{10}, R^{11}, R^{12}, R^{13}, R^{14}, R^{15}, R^{16}, R^{17}, R^{18}, R^{19}, R^{20}, R^{21}, R^{22}$ и Q^2 являются раскрытыми ранее, можно получать посредством способов, раскрытых в Heemstra, R.J. et al., в патенте США № 9781935 B2 (WO 2016/168059), а также путем обработки аминами или солями аминов 1-2, где $R^{10}, R^{11}, R^{12}, R^{13}, R^{14}, R^{15}, R^{16}, R^{17}, R^{18}, R^{19}, R^{20}, R^{21}, R^{22}$ и Q^2 являются раскрытыми ранее, и активированными карбоновыми кислотами 1-1, где A представляет собой активирующую группу, и $R^1, R^2, R^3, R^4, R^5, R^6, R^7, R^8$, и R^9 являются раскрытыми ранее, в присутствии основания, такого как триэтиламин, диизопропилэтиламин, 4-метилморфолин, бикарбонат натрия или 4-диметиламинопиридин в безводном апротонном растворителе, таком как дихлорметан, тетрагидрофуран, 1,2-дихлорэтан, диметилформамид, этилацетат или любая их комбинация, при значениях температуры от приблизительно $0^\circ C$ до приблизительно $120^\circ C$ (схема 1, стадия а).

Карбоновые кислоты 1-1, где A представляет собой активирующую группу, могут представлять собой галогенангидрид, такой как хлорангидрид, бромангидрид или фторангидрид; сложный эфир карбоновой кислоты, такой как пара-нитрофениловый сложный эфир, пентафторфениловый сложный эфир, этил-(гидроксиимино)цианоацетатный сложный эфир, метиловый сложный эфир, этиловый сложный эфир, бензиловый сложный эфир, N-гидроксисукцинимидиловый сложный эфир, гидроксibenзотриазол-1-иловый сложный эфир или гидроксипиридилтриазол-1-иловый сложный эфир; O-ацил-изомочевину; ангидрид кислоты или сложный тиоэфир. Хлорангидриды можно получать из соответствующих карбоновых кислот путем обработки дегидратирующим хлорирующим реагентом, таким как оксалилхлорид или тионилхлорид, в присутствии N, N-диметилформамида или без него. Активированные сложные эфиры карбоновых кислот 1-1 можно получать из карбоновых кислот *in situ* с помощью соли урония, такой как

гексафторфосфат 1-[бис(диметиламино)метиле]-1Н-1,2,3-триазоло[4,5-б]пиридиний-3-оксида (НАТУ), гексафторфосфат О-(бензотриазол-1-ил)-N,N,N',N'-тетраметилурония (НВТУ) или гексафторфосфат (1-циано-2-этокси-2-оксоэтилиденаминоокси)диметиламинорфолоинокарбения (СОМУ). Активированные сложные эфиры карбоновых кислот 1-1 также можно получать из карбоновых кислот *in situ* с помощью соли фосфония, такой как гексафторфосфат бензотриазол-1-илокситрипирролидинофосфония (Ру-Вор). Активированные сложные эфиры карбоновых кислот 1-1 также можно получать из карбоновых кислот *in situ* с помощью реагента для реакций сочетания, такого как 1-(3-диметиламинопропил)-3-этилкарбодиимид или дициклогексилкарбодиимид, в присутствии триазола, такого как моногидрат гидроксибензотриазола (НОВт) или 1-гидрокси-7-азабензотриазол (НОАт). О-ацил-изомочевины можно получать с помощью дегидратирующего карбодиимида, такого как 1-(3-диметиламинопропил)-3-этилкарбодиимид или дициклогексилкарбодиимид.

Активированные сложные эфиры карбоновых кислот 1-1 также можно получать из карбоновых кислот *in situ* с помощью реагента для реакций сочетания, такого как гексафторфосфат 2-хлор-1,3-диметил-имидазолидиния (СІР), в присутствии триазола, такого как 1-гидрокси-7-азабензотриазол (НОАт). Активированные сложные эфиры карбоновых кислот 1-1 также можно получать из карбоновых кислот *in situ* с помощью реагента для реакций сочетания, такого как 2,4,6-трипропил-1,3,5,2,4,6-триоксатрифосфинана 2,4,6-триоксид (ТЗР®), в присутствии основания, такого как пиридин.

Амины или соли аминов 1-2, где Q² представляет собой О, можно непосредственно обрабатывать источником серы, таким как пентасульфид фосфора или 2,4-бис(4-метоксифенил)-1,3,2,4-дигиадифосфетан-2,4-дисульфид (реагент Лоуссона) с добавками, такими как 1,1,1,3,3,3-гексаметилдисилоксан, или без них в апротонном растворителе, выбранном из тетрагидрофурана, дихлорметана, хлороформа, толуола или пиридина, при значениях температуры от приблизительно 40°C до приблизительно 120°C с получением аминов или солей аминов 1-2, где Q² представляет собой S.

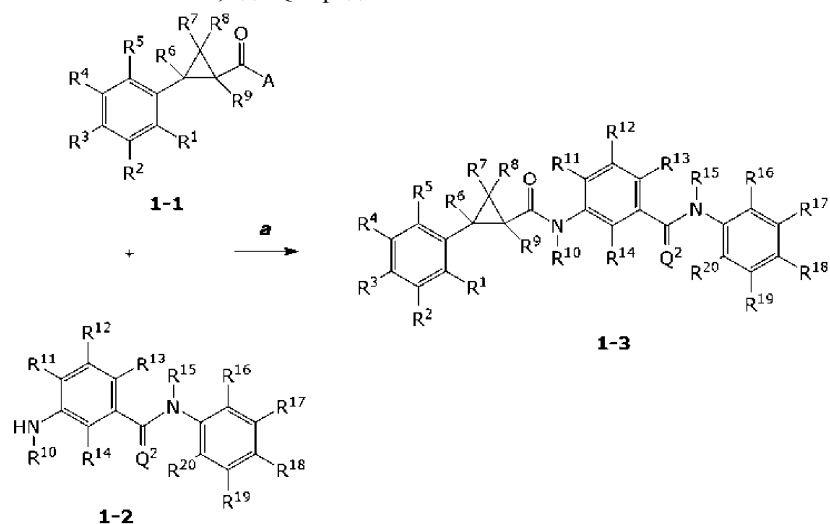


Схема 1

Циклопропиламиды 2-3, где Q² представляет собой О и R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶, R⁷, R⁸, R⁹, Q¹, R¹⁰, R¹¹, R¹², R¹³, R¹⁴, R¹⁵, R¹⁶, R¹⁷, R¹⁸, R¹⁹, R²⁰, R²¹ и R²² являются раскрытыми ранее, можно получать путем обработки аминами или солями аминов 2-2 и активированными карбоновыми кислотами 2-1, где А представляет собой активирующую группу, и R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶, R⁷, R⁸, R⁹, Q¹, R¹⁰, R¹¹, R¹², R¹³, R¹⁴, R¹⁵, R¹⁶, R¹⁷, R¹⁸, R¹⁹, R²⁰, R²¹, R²² и Q² являются раскрытыми ранее с помощью основания, такого как триэтиламин, диизопропилэтиламин, 4-метилморфолин, пиридин, бикарбонат натрия или 4-диметиламинопиридин в безводном апротонном растворителе, таком как дихлорметан, тетрагидрофуран, 1,2-дихлорэтан, диметилформамид, этилацетат или любая их комбинация, при значениях температуры от приблизительно 0°C до приблизительно 120°C (схема 2, стадия а).

Активированные карбоновые кислоты 2-1 могут представлять собой галогенангидрид, такой как хлорангидрид, бромангидрид или фторангидрид; сложный эфир карбоновой кислоты, такой как паранитрофениловый сложный эфир, пентафторфениловый сложный эфир, этил-(гидроксиимино)цианоацетатный сложный эфир, метиловый сложный эфир, этиловый сложный эфир, бензиловый сложный эфир, N-гидроксисукцинимидиловый сложный эфир, гидроксibenзотриазол-1-иловый сложный эфир или гидроксипиридилтриазол-1-иловый сложный эфир; О-ацил-изомочевину; ангидрид кислоты или сложный тиоэфир. Хлорангидриды можно получать из соответствующих карбоновых кислот путем обработки дегидратирующим хлорирующим реагентом, таким как оксалилхлорид или тионилхлорид. Активированные сложные эфиры карбоновых кислот 2-1 можно получать из карбоновых кислот *in situ* с помощью соли урания, такой как гексафторфосфат 1-[бис(диметиламино)метиле]-1Н-1,2,3-триазоло[4,5-б]пиридиний-3-оксида (НАТУ), гексафторфосфат О-(бензотриазол-1-ил)-N,N,N',N'-тетраметилурония (НВТУ) или гексаф-

торфосфат (1-циано-2-этокси-2-оксоэтилиденаминоокси)диметиламинорффолинокарбения (COMU). Активированные сложные эфиры карбоновых кислот 2-1 также можно получать из карбоновых кислот *in situ* с помощью соли фосфония, такой как гексафторфосфат бензотриазол-1-илокситрипирролидинофосфония (РyВор). Активированные сложные эфиры карбоновых кислот 2-1 также можно получать из карбоновых кислот *in situ* с помощью реагента для реакций сочетания, такого как 1-(3-диметиламинопропил)-3-этилкарбодиимид или дициклогексилкарбодиимид, в присутствии триазола, такого как моногидрат гидроксibenзотриазола (НОВt) или 1-гидрокси-7-азабензотриазол (НОAt). О-ацил-изомочевины можно получать с помощью дегидратирующего карбодиимида, такого как 1-(3-диметиламинопропил)-3-этилкарбодиимид или дициклогексилкарбодиимид. Активированные сложные эфиры карбоновых кислот 2-1 также можно получать из карбоновых кислот *in situ* с помощью реагента для реакций сочетания, такого как гексафторфосфат 2-хлор-1,3-диметил-имидазолидиния (СIP), в присутствии триазола, такого как 1-гидрокси-7-азабензотриазол (НОAt). Активированные сложные эфиры карбоновых кислот 2-1 также можно получать из карбоновых кислот *in situ* с помощью реагента для реакций сочетания, такого как 2,4,6-трипропил-1,3,5,2,4,6-триоксатрифосфинана 2,4,6-триоксид (ТЗР®), в присутствии основания, такого как пиридин.

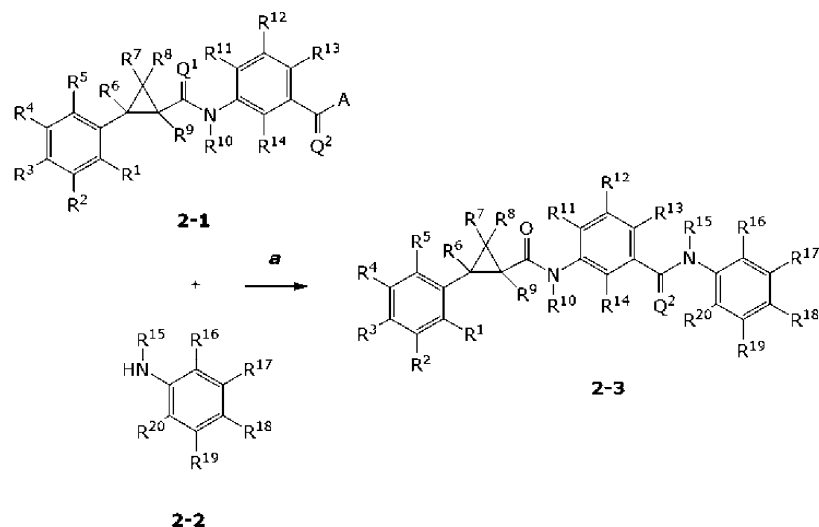


Схема 2

Циклопропиламиды 3-3, где по меньшей мере один, но не более двух из R^{16} , R^{17} , R^{18} , R^{19} и R^{20} представляют собой $N(R^{21})C(=O)(R^{22})$; Q^2 представляет собой O, R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 , R^7 , R^8 , R^9 , Q^1 , R^{10} , R^{11} , R^{12} , R^{13} , R^{14} и R^{15} , являются раскрытыми ранее, можно получать путем обработки аминов 3-1, где по меньшей мере один, но не более двух из R^{16} , R^{17} , R^{18} , R^{19} и R^{20} представляют собой $N(R^{21})_2$, и R^{21} представляет собой H; Q^2 представляет собой O, R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 , R^7 , R^8 , R^9 , Q^1 , R^{10} , R^{11} , R^{12} , R^{13} , R^{14} и R^{15} являются раскрытыми ранее, активированной карбоновой кислотой 3-2, где A представляет собой активирующую группу, и R^{22} является раскрытым ранее, и в присутствии основания, такого как триэтиламин, диизопропилэтиламин, 4-метилморфолин, 4-диметиламинопиридин или пиридин, в безводном апротонном растворителе, таком как дихлорметан, тетрагидрофуран, 1,2-дихлорэтан, N,N-диметилформамид или любая их комбинация, при значениях температуры от приблизительно 0°C до приблизительно 120°C (схема 3, стадия а).

Активированные карбоновые кислоты 3-2 могут представлять собой галогенангидрид, такой как хлорангидрид, бромангидрид, фторангидрид или хлорформат; сложный эфир карбоновой кислоты, такой как п-нитрофениловый сложный эфир, пентафторфениловый сложный эфир, этил(гидроксиимино)цианоацетатный сложный эфир, метиловый сложный эфир, этиловый сложный эфир, бензиловый сложный эфир, N-гидроксисукцинимидиловый сложный эфир, гидроксibenзотриазол-1-иловый сложный эфир или гидроксипиридилтриазол-1-иловый сложный эфир; О-ацил-изомочевину; ангидрид кислоты или сложный тиоэфир. Хлорангидриды можно получать из соответствующих карбоновых кислот путем обработки дегидратирующим хлорирующим реагентом, таким как оксалилхлорид или тионилхлорид. Активированные сложные эфиры карбоновых кислот 3-2 можно получать из карбоновых кислот *in situ* с помощью соли урния, такой как гексафторфосфат 1-[бис(диметиламино)метиле]-1Н-1,2,3-триазоло[4,5-*b*]пиридиний-3-оксида (НАТУ), гексафторфосфат О-(бензотриазол-1-ил)-N,N,N',N'-тетраметилурония (НВТУ) или гексафторфосфат (1-циано-2-этокси-2-оксоэтилиденаминоокси)диметиламинорффолинокарбения (COMU). Активированные сложные эфиры карбоновых кислот 3-2 также можно получать из карбоновых кислот *in situ* с помощью соли фосфония, такой как гексафторфосфат бензотриазол-1-илокситрипирролидинофосфония (РyВор). Активированные сложные эфиры карбоновых кислот 3-2 также можно получать из карбоновых кислот *in situ* с помощью реагента для реакции сочетания, такого как 1-(3-диметиламинопропил)-3-этилкарбодиимид или дициклогексилкарбодиимид, в присутствии триазола, такого как моногидрат гидроксibenзотриазола

(НОВт) или 1-гидрокси-7-азабензотриазол (НОАт). О-ацил-изомочевины можно получать с помощью дегидратирующего карбодиимида, такого как 1-(3-диметиламинопропил)-3-этилкарбодиимид или дихлоргексилкарбодиимид. Активированные сложные эфиры карбоновых кислот 3-2 также можно получать из карбоновых кислот *in situ* с помощью реагента для реакций сочетания, такого как гексафторфосфат 2-хлор-1,3-диметил-имидазолидиния (СІР), в присутствии триазола, такого как 1-гидрокси-7-азабензотриазол (НОАт). Активированные сложные эфиры карбоновых кислот 3-2 также можно получать из карбоновых кислот *in situ* с помощью реагента для реакций сочетания, такого как 2,4,6-трипропил-1,3,5,2,4,6-триоксатрифосфинана 2,4,6-триоксид (ТЗР®), в присутствии основания, такого как пиридин.

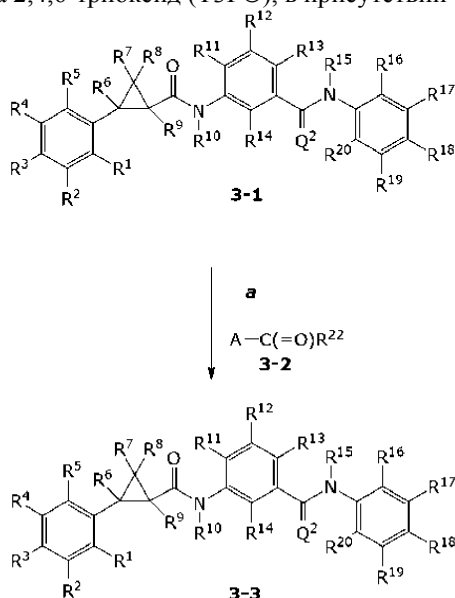
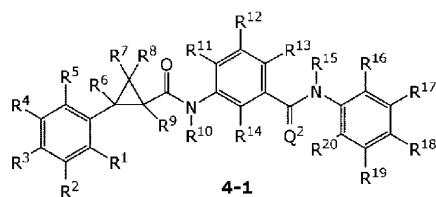


Схема 3

Циклопропиламиды 4-2, где по меньшей мере один, но не более двух из R¹⁶, R¹⁷, R¹⁸, R¹⁹ и R²⁰ представляют собой N(R²¹)₂, и R²¹ представляет собой H; Q² представляет собой O, R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶, R⁷, R⁸, R⁹, Q¹, R¹⁰, R¹¹, R¹², R¹³, R¹⁴ и R¹⁵ являются раскрытыми ранее, можно получать путем обработки 4-1, где по меньшей мере один, но не более двух из R¹⁶, R¹⁷, R¹⁸, R¹⁹ и R²⁰ представляют собой NO₂; R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶, R⁷, R⁸, R⁹, Q¹, R¹⁰, R¹¹, R¹², R¹³, R¹⁴ и R¹⁵ являются раскрытыми ранее, с помощью металла, такого как палладий на угле, в присутствии восстанавливающего средства, такого как газообразный водород, в растворителе, таком как этилацетат, или с помощью металла, такого как железо, в присутствии восстанавливающего средства, такого как хлорид аммония, в смеси растворителей, таких как метанол и вода, при температуре от приблизительно 25°C до приблизительно 60°C (схема 4, стадия а).

В качестве альтернативы циклопропиламиды 4-2, где по меньшей мере один, но не более двух из R¹⁶, R¹⁷, R¹⁸, R¹⁹ и R²⁰ представляют собой N(R²¹)₂, и R²¹ представляет собой H; Q² представляет собой O, R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶, R⁷, R⁸, R⁹, Q¹, R¹⁰, R¹¹, R¹², R¹³, R¹⁴ и R¹⁵ являются раскрытыми ранее, можно получать путем обработки 4-1, где по меньшей мере один, но не более двух из R¹⁶, R¹⁷, R¹⁸, R¹⁹ и R²⁰ представляют собой N(R²¹)C(=O)O(C₁-C₆)алкил, где R²¹ представляет собой H; Q² представляет собой O, R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶, R⁷, R⁸, R⁹, Q¹, R¹⁰, R¹¹, R¹², R¹³, R¹⁴ и R^{15a} являются раскрытыми ранее, с помощью раствора ангидрида кислоты, такой как хлористоводородная кислота, в 1,4-диоксане и дихлорметане при температуре приблизительно 25°C (схема 4, стадия b).

В качестве альтернативы циклопропиламиды 4-2, где по меньшей мере один, но не более двух из R¹⁶, R¹⁷, R¹⁸, R¹⁹ и R²⁰ представляют собой N(R²¹)₂, и R²¹ представляет собой H; Q² представляет собой O, R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶, R⁷, R⁸, R⁹, Q¹, R¹⁰, R¹¹, R¹², R¹³, R¹⁴ и R¹⁵ являются раскрытыми ранее, можно получать путем обработки 4-1, где по меньшей мере один, но не более двух из R¹⁶, R¹⁷, R¹⁸, R¹⁹ и R²⁰ представляют собой N(C(=O)O(C₁-C₆)алкил)₂; Q² представляет собой O, R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶, R⁷, R⁸, R⁹, Q¹, R¹⁰, R¹¹, R¹², R¹³, R¹⁴ и R¹⁵ являются раскрытыми ранее, с помощью раствора ангидрида кислоты, такой как хлористоводородная кислота, в 1,4-диоксане и дихлорметане, при температуре приблизительно 25°C (схема 4, стадия c).



a, b или c

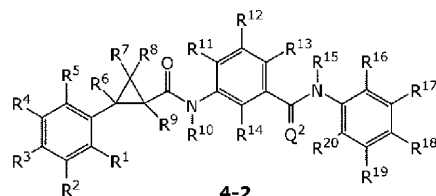
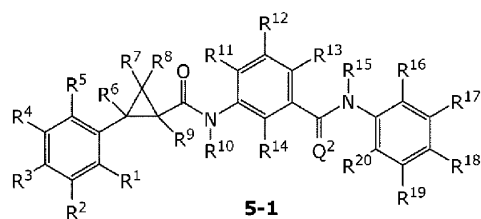


Схема 4

Циклопропиламиды 5-1, где по меньшей мере один, но не более двух из R^{16} , R^{17} , R^{18} , R^{19} и R^{20} представляют собой $N(R^{21})C(=O)(R^{22})$, и R^{22} содержит сульфид, можно окислять до соответствующего сульфоксида или сульфона 5-2 путем обработки с помощью приблизительно одного эквивалента метаклорпероксибензойной кислоты в полярном апротонном растворителе, таком как дихлорэтан, при значениях температуры от приблизительно 0°C до приблизительно 50°C (схема 5, стадия a). В качестве альтернативы циклопропиламиды 5-1, где R^{22} содержит сульфид, можно окислять до соответствующего сульфоксида или сульфона путем обработки с помощью одного эквивалента пербората натрия в протонном растворителе, таком как уксусная кислота (сульфоксид), или двух эквивалентов пербората натрия (сульфон). Предпочтительно окисление будут проводить при значениях температуры от приблизительно 40°C до приблизительно 100°C с применением приблизительно 1,5 эквивалента пербората натрия с получением хроматографически разделяемых смесей сульфоксид- и сульфонциклопропиламидов 5-2 (схема 5, стадия b). В качестве альтернативы циклопропиламиды 5-1, содержащие сульфид, можно окислять до соответствующего сульфоксида путем обработки с помощью приблизительно одного эквивалента 30% водного раствора пероксида водорода, в полярном протонном растворителе, таком как гексафторпропанол, при температуре окружающей среды (схема 5, стадия c). В качестве альтернативы циклопропиламиды 5-1, содержащие сульфид, можно окислять до соответствующего сульфоксида и сульфона путем обработки с помощью Oxone® в количестве от приблизительно 1 до приблизительно 2,5 эквивалента в полярном протонном растворителе, таком как метанол, при температуре окружающей среды (схема 5, стадия d).



a, b, c или d

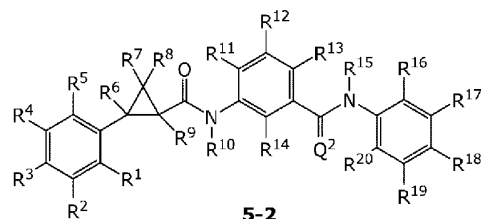


Схема 5

В другом варианте осуществления циклопропиловую кислоту R1-1, где R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶, R⁷, R⁸ и R⁹ раскрыты ранее, можно разделять на ее (R,R)- и (S,S)-энантиомеры с помощью способа со схемы R1.

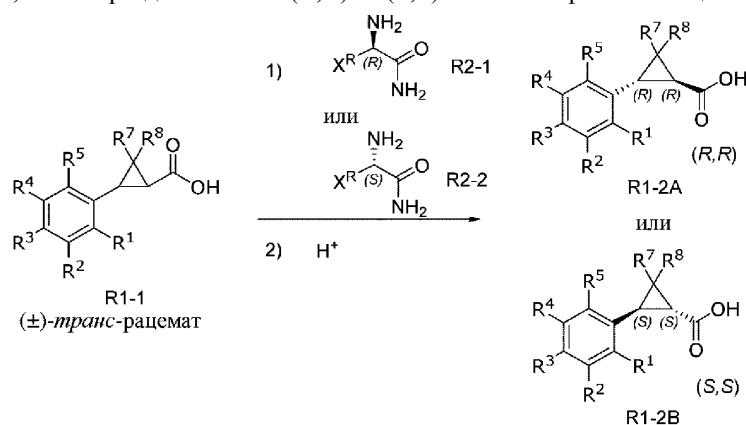
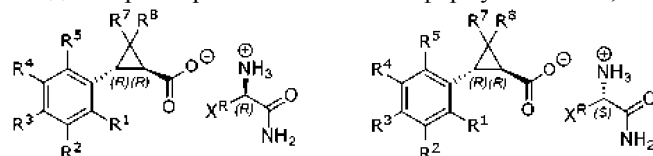


Схема R1

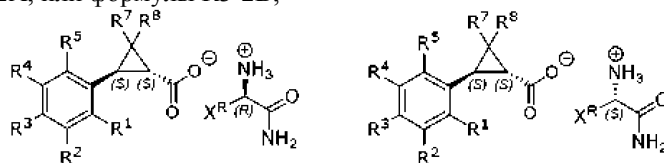
где X^R выбран из группы, состоящей из C₁-C₄алкила или бензила.

На схеме R1 (±)-транс-рацемат формулы R1-1 (т.е. смесь (R,R)- и (S,S)-энантиомеров транс-2,2-дихлор-3-(замещенный фенил)циклопропанкарбоновой кислоты) объединяют с расщепляющим средством, которое представляет собой энантиомерный амин либо формулы R2-1, либо формулы R2-2, в подходящем растворителе с получением диастереомерных солей аминов формулы R3-1 A, или формулы R3-1B,



R3-1A R3-1B,

или формулы R3-2A, или формулы R3-2B,



R3-2A R3-2B,

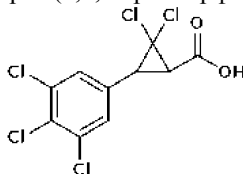
которые селективно кристаллизуются или выпадают в осадок в полученной смеси. Диастереомерную соль амина формулы R3-1A или формулы R3-1B или формулы R3-2A или формулы R3-2B можно затем выделять из смеси и обрабатывать кислотой с получением (1R,3R)- или (1S,3S)-2,2-дигалоген-3-(замещенный фенил)циклопропанкарбоновой кислоты формулы R1-2A или формулы R1-2B соответственно.

Примеры

Данные примеры представлены в иллюстративных целях и не предназначены для ограничения настоящего изобретения лишь вариантами осуществления, раскрытыми в данных примерах.

Исходные материалы, реагенты и растворители, которые получали из коммерческих источников, применяли без дополнительной очистки. Безводные растворители получали в упаковке Sure/Seal™ от Aldrich и применяли в том виде, в котором получали. Значения температуры плавления определяли на капиллярном приборе для определения значений температуры плавления Thomas Hoover Unimelt или на автоматической системе для определения значений температуры плавления OptiMelt от Stanford Research Systems и не корректировали. Примеры, в которых используется "комнатная температура", проводили в лабораториях с регулируемым климатом при значениях температуры в диапазоне от приблизительно 20°C до приблизительно 24°C. Молекулам даны их известные названия, полученные в соответствии с программами определения названия в ISIS Draw, ChemDraw или ACD Name Pro. Если в таких программах невозможно назвать молекулу, такую молекулу называют с помощью традиционных правил определения названия. Спектральные данные ¹H ЯМР представлены в ppm (δ), и их регистрировали при 300, 400, 500 или 600 МГц; спектральные данные ¹³C ЯМР представлены в ppm (δ), и их регистрировали при 75, 100 или 150 МГц; и спектральные данные ¹⁹F ЯМР представлены в ppm (δ), и их регистрировали при 376 МГц, если не указано иное.

Пример 1. Получение транс-2,2-дихлор-3-(3,4,5-трихлорфенил)циклопропанкарбоновой кислоты (C1).



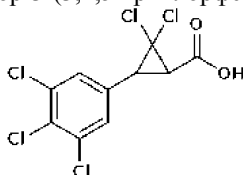
Указанное в заголовке соединение получали из транс-1,2,3-трихлор-5-(2,2-дихлор-3-(4-метоксифенил)циклопропил)бензола (C2) в соответствии со способами, раскрытыми у Heemstra, R.J. et al. в примере 1 патента США № 9781935 В2 (WO 2016/168059), и выделяли в виде желтого порошка (1,5 грамма (г), 39%):

^1H ЯМР (400 МГц, CDCl_3) δ 7,31 (d, $J=0,7$ Гц, 2H), 3,40 (d, $J=8,2$ Гц, 1H), 2,86 (d, $J=8,3$ Гц, 1H);

^{13}C ЯМР (101 МГц, CDCl_3) δ 171,05, 134,55, 132,44, 131,75, 128,89, 61,18, 39,26, 37,14;

ESIMS масса/заряд 333 ($[\text{M}-\text{H}]^-$).

Пример 2. Получение транс-2,2-дихлор-3-(3,4,5-трихлорфенил)циклопропанкарбоновой кислоты (C1).

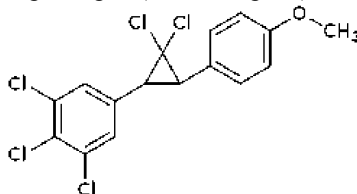


Указанное в заголовке соединение получали из транс-2,2-дихлор-3-(3,4,5-трихлорфенил)циклопропан-1-карбальдегида (C5) в соответствии со способами, раскрытыми у Heemstra, R.J. et al. в примере 96 патента США № 9781935 В2 (WO 2016/168059), и выделяли в виде белого твердого вещества (2,78 г, 95%):

^1H ЯМР (400 МГц, $\text{DMSO}-d_6$) δ 13,41 (s, 1H), 7,81 (d, $J=0,6$ Гц, 2H), 3,62 (d, $J=8,6$ Гц, 1H), 3,52 (d, $J=8,6$ Гц, 1H);

ESIMS масса/заряд 332 ($[\text{M}-\text{H}]^-$).

Пример 3. Получение транс-1,2,3-трихлор-5-(2,2-дихлор-3-(4-метоксифенил)циклопропил)бензола (C2).

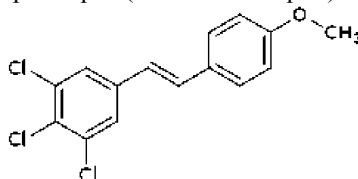


Указанное в заголовке соединение получали из (E)-1,2,3-трихлор-5-(4-метоксистирил)бензола (C3) и N-бензил-N,N-диэтилэтанаминия хлорида в соответствии со способами, раскрытыми у Heemstra, R.J. et al. в примере 3 патента США № 9781935 В2 (WO 2016/168059), и выделяли в виде темной пены (4,7 г, 100%):

^1H ЯМР (400 МГц, CDCl_3) δ 7,40 (d, $J=0,6$ Гц, 2H), 7,29-7,22 (m, 2H), 6,96-6,89 (m, 2H), 3,83 (s, 3H), 3,12 (d, $J=8,8$ Гц, 1H), 3,06 (d, $J=8,7$ Гц, 1H);

^{13}C ЯМР (101 МГц, CDCl_3) δ 159,46, 135,08, 134,23, 130,91, 129,85, 129,16, 125,42, 114,02, 64,67, 55,32, 39,62, 38,48.

Пример 4. Получение (E)-1,2,3-трихлор-5-(4-метоксистирил)бензола (C3).



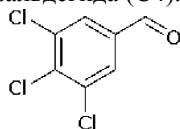
Указанное в заголовке соединение получали из 3,4,5-трихлорбензальдегида (C4) и диэтил-4-метоксибензилфосфоната в соответствии со способами, раскрытыми у Heemstra, R.J. et al. в примере 5 патента США № 9781935 В2 (WO 2016/168059), и выделяли в виде грязно-белого твердого вещества (3,7 г, 31%):

^1H ЯМР (400 МГц, CDCl_3) δ 7,49-7,46 (m, 2H), 7,47-7,39 (m, 2H), 7,04 (d, $J=16,3$ Гц, 1H), 6,93-6,89 (m, 2H), 6,78 (d, $J=16,3$ Гц, 1H), 3,84 (s, 3H);

^{13}C ЯМР (101 МГц, CDCl_3) δ 159,46, 135,08, 134,23, 130,91, 129,85, 129,16, 125,42, 114,02, 64,67, 55,32, 39,62, 38,48;

EIMS масса/заряд 313 ($[\text{M}]^+$).

Пример 5. Получение 3,4,5-трихлорбензальдегида (C4).

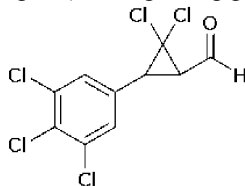


Указанное в заголовке соединение получали из 5-бром-1,2,3-трихлорбензола в соответствии со способами, раскрытыми у Heemstra, R.J. et al. в примере 10 патента США № 9781935 B2 (WO 2016/168059), и выделяли в виде белого твердого вещества (смесь 10:1 указанного в заголовке соединения и 1,2,3-трихлорбензола, 7,96 г, 99%):

^1H ЯМР (CDCl_3) δ 9,91 (s, 1H), 7,88 (s, 2H);

EIMS масса/заряд 209 ($[\text{M}]^+$).

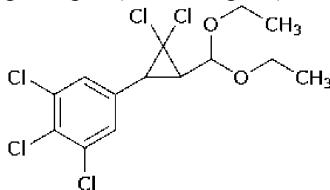
Пример 6. Получение транс-2,2-дихлор-3-(3,4,5-трихлорфенил)циклопропан-1-карбальдегида (C5).



Указанное в заголовке соединение получали из транс-1,2,3-трихлор-5-(2,2-дихлор-3-(диэтоксиметил)циклопропил)бензола (C6) в соответствии со способами, раскрытыми у Heemstra, R.J. et al. в примере 97 патента США № 9781935 B2 (WO 2016/168059), и выделяли в виде желтого твердого вещества (2,8 г, 69%):

^1H ЯМР (400 МГц, CDCl_3) δ 9,55 (d, $J=3,9$ Гц, 1H), 7,30 (d, $J=0,7$ Гц, 2H), 3,48 (dt, $J=8,0, 0,8$ Гц, 1H), 2,92 (dd, $J=7,9, 3,9$ Гц, 1H).

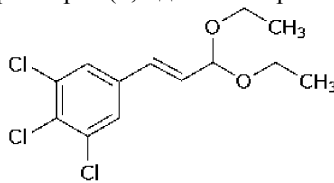
Пример 7. Получение транс-1,2,3-трихлор-5-(2,2-дихлор-3-(диэтоксиметил)циклопропил)бензола (C6).



Указанное в заголовке соединение получали из (E)-1,2,3-трихлор-5-(3,3-диэтоксипроп-1-ен-1-ил)бензола (C7) в соответствии со способами, раскрытыми у Heemstra, R.J. et al. в примере 98 патента США № 9781935 B2 (WO 2016/168059), и выделяли в виде коричневого масла (146 г, 93%):

^1H ЯМР (400 МГц, CDCl_3) δ 7,29 (d, $J=0,7$ Гц, 2H), 4,59 (d, $J=6,1$ Гц, 1H), 3,82-3,54 (m, 4H), 2,75 (d, $J=8,5$ Гц, 1H), 2,23 (dd, $J=8,5, 6,1$ Гц, 1H), 1,30 (t, $J=7,0$ Гц, 3H), 1,20 (t, $J=7,0$ Гц, 3H).

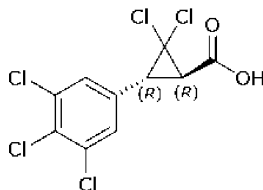
Пример 8. Получение (E)-1,2,3-трихлор-5-(3,3-диэтоксипроп-1-ен-1-ил)бензола (C7).



Указанное в заголовке соединение получали из 3,4,5-трихлорбензальдегида в соответствии со способами, раскрытыми у Heemstra, R.J. et al. в примере 99 патента США № 9781935 B2 (WO 2016/168059), и выделяли в виде оранжевого масла (40 г, 91%):

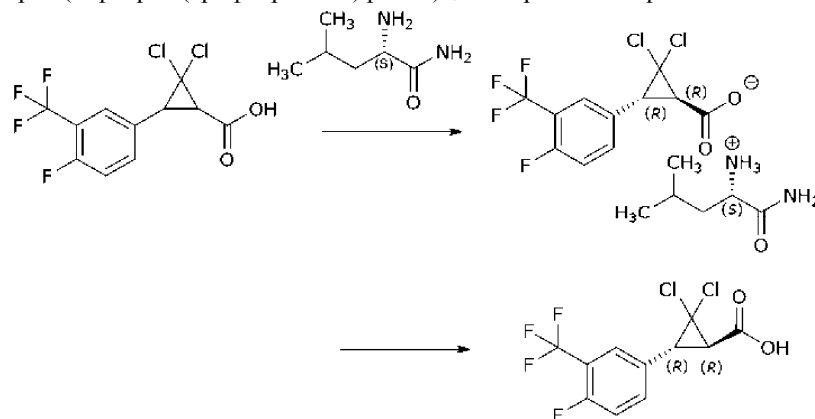
^1H ЯМР (400 МГц, CDCl_3) δ 7,41 (s, 2H), 6,58 (dd, $J=16,1, 1,2$ Гц, 1H), 6,21 (dd, $J=16,1, 4,6$ Гц, 1H), 5,06 (dd, $J=4,7, 1,2$ Гц, 1H), 3,69 (dq, $J=9,3, 7,1$ Гц, 2H), 3,55 (dq, $J=9,5, 7,0$ Гц, 2H), 1,25 (t, $J=7,1$ Гц, 6H).

Пример R1. Разделение (1R,3R)-2,2-дихлор-3-(3,4,5-трихлорфенил)циклопропан-1-карбоновой кислоты (C8).



Указанное в заголовке соединение разделяли в соответствии со способами, раскрытыми у Heemstra, R.J. et al. в примере 100 патента США № 9781935 B2 (WO 2016/168059), и выделяли в виде белого твердого вещества (2 г, 29%, 99% ee). Аналитические данные соответствуют рацемической кислоте C1.

Пример R4. Разделение рацемической транс-2,2-дихлор-3-(4-фтор-3-(трифторметил)фенил)циклопропан-1-карбоновой кислоты (C9) и (L)-лейцинамида с получением (1R,3R)-2,2-дихлор-3-(4-фтор-3-(трифторметил)фенил)циклопропан-1-карбоновой кислоты (C10).



Перемешивали смесь (L)-лейцинамида (15,6 г, 120 ммоль) и рацемической транс-2,2-дихлор-3-(4-фтор-3-(трифторметил)фенил)циклопропан-1-карбоновой кислоты (C9, получена в соответствии со способами, раскрытыми у Heemstra, R.J. et al. в примере 1 патента США № 9781935 B2 (WO 2016/168059); 63,4 г, 200 ммоль) в ацетонитриле (800 мл) при 60°C в течение 1 ч (ч.). После того как начало осажаться твердое вещество, смесь выдерживали при комнатной температуре в течение 4 ч. Твердое вещество собирали, промывали с помощью минимального количества ацетонитрила и высушивали с получением соли (L)-лейцинамида и транс-(1R,3R)-2,2-дихлор-3-(4-фтор-3-(трифторметил)фенил)циклопропан-1-карбоксилата в виде белого твердого вещества (38,9 г, 95% ee, 43%): ¹H ЯМР (400 МГц, DMSO-d₆) δ 7,80 (s, 1H), 7,73 (m, 2H), 7,49 (dd, J=10,7, 8,6 Гц, 1H), 7,31 (s, 1H), 3,53 (dd, J=7,9, 6,4 Гц, 1H), 3,34 (d, J=8,6 Гц, 1H), 3,07 (d, J=8,6 Гц, 1H), 1,77-1,60 (m, 1H), 1,60-1,40 (m, 2H), 0,89 (t, J=6,7 Гц, 6H); ¹⁹F ЯМР (376 МГц, DMSO-d₆) δ -59,88, -117,93.

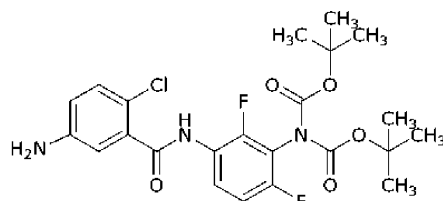
Соль в виде белого твердого вещества разбавляли с помощью EtOAc и промывали 1,5-нормальным (н.) раствором HCl и водой. Органический слой высушивали над Na₂SO₄, фильтровали и концентрировали с получением указанного в заголовке продукта в виде белого твердого вещества (27,3 г, 95% ee, выход 43%):

¹H ЯМР (400 МГц, DMSO-d₆) δ 13,24 (s, 1H), 8,03-7,71 (m, 2H), 7,54 (dd, J=10,6, 8,7 Гц, 1H), 3,65-3,51 (m, 2H);

¹⁹F ЯМР (376 МГц, DMSO-d₆) δ -59,93, -117,06;

ESIMS масса/заряд=316 ([M-H]).

Пример 9. Получение трет-бутил-N-((трет-бутоксикарбонил)-N-(3-(5-амино-2-хлорбензамидо)-2,6-дифторфенил)карбамата (C11).



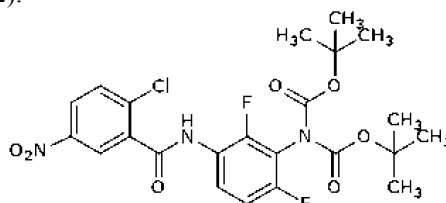
Указанное в заголовке соединение получали из трет-бутил-N-((трет-бутоксикарбонил)-N-(3-(2-хлор-5-нитробензамидо)-2,4-дифторфенил)карбамата (C12) в соответствии со способами, раскрытыми у Heemstra, R.J. et al. в примере 83 патента США № 9781935 B2 (WO 2016/168059), и выделяли в виде белого твердого вещества (2,89 г, 59%):

¹H ЯМР (400 МГц, DMSO-d₆) δ 10,28 (s, 1H), 7,67 (td, J=8,8, 5,8 Гц, 1H), 7,24 (td, J=9,3, 1,7 Гц, 1H), 7,13 (d, J=8,6 Гц, 1H), 6,73 (d, J=2,7 Гц, 1H), 6,65 (dd, J=8,6, 2,8 Гц, 1H), 5,48 (s, 2H), 1,40 (s, 18H);

¹⁹F ЯМР (376 МГц, DMSO-d₆) δ -123,86, -126,24;

ESIMS масса/заряд 496 ([M-H]).

Пример 10. Получение трет-бутил-N-((трет-бутоксикарбонил)-N-(3-(2-хлор-5-нитробензамидо)-2,4-дифторфенил)карбамата (C12).



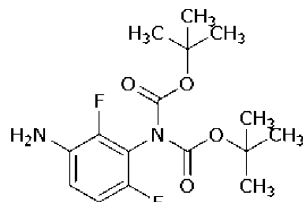
Указанное в заголовке соединение получали из 2-хлор-5-нитробензойной кислоты и трет-бутил-N-((трет-бутоксикарбонил)-N-(3-амино-2,6-дифторфенил)карбамата (С13) в соответствии со способами, раскрытыми у Heemstra, R. J. et al. в примере 28 патента США № 9781935 В2 (WO 2016/168059), и выделяли в виде желтого масла (5,2 г, 66%):

^1H ЯМР (400 МГц, DMSO- d_6) δ 10,69 (s, 1H), 8,51 (d, J=2,7 Гц, 1H), 8,35 (dd, J=8,8, 2,8 Гц, 1H), 7,97-7,79 (m, 2H), 7,30 (td, J=9,3, 1,7 Гц, 1H), 1,41 (s, 18H);

^{19}F ЯМР (376 МГц, DMSO- d_6) δ -123,43, -127,02 (d, J=2,0 Гц);

ESIMS масса/заряд 526 ([M-H] $^-$).

Пример 11. Получение трет-бутил-N-((трет-бутоксикарбонил)-N-(3-амино-2,6-дифторфенил)карбамата (С13).



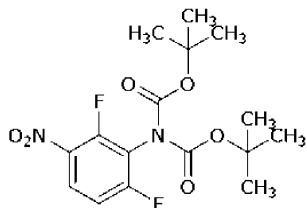
Указанное в заголовке соединение получали из трет-бутил-N-((трет-бутоксикарбонил)-N-(2,6-дифтор-3-нитрофенил)карбамата (С14) в соответствии со способами, раскрытыми у Heemstra, R.J. et al. в примере 91 патента США № 9781935 В2 (WO 2016/168059), и выделяли в виде белого твердого вещества (5,06 г, 100%):

^1H ЯМР (400 МГц, DMSO- d_6) δ 6,87 (td, J=9,3, 1,7 Гц, 1H), 6,74 (td, J=9,4, 5,7 Гц, 1H), 5,12 (s, 2H), 1,39 (s, 18H);

^{19}F ЯМР (376 МГц, DMSO- d_6) δ -137,96 (d, J=3,7 Гц), -141,10 (d, J=3,7 Гц);

ESIMS масса/заряд 244 ([M-BOC] $^-$).

Пример 12. Получение трет-бутил-N-((трет-бутоксикарбонил)-N-(2,6-дифтор-3-нитрофенил)карбамата (С14).



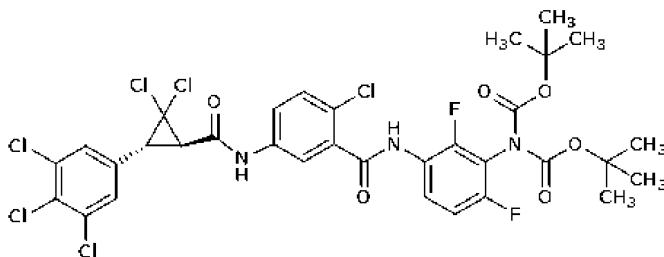
Указанное в заголовке соединение получали из 2,6-дифтор-5-нитроанилина в соответствии со способами, раскрытыми у Heemstra, R.J. et al. в примере 89 патента США № 9781935 В2 (WO 2016/168059), и выделяли в виде белой пены (5,2 г, 69%):

^1H ЯМР (300 МГц, CDCl_3) δ 8,14 (ddd, J=9,2, 8,1, 5,5 Гц, 1H), 7,10 (ddd, J=9,7, 8,0, 2,0 Гц, 1H), 1,45 (s, 18H);

^{19}F ЯМР (376 МГц, CDCl_3) δ -105,95 (dd, J=10,9, 2,7 Гц), -119,53 (d, J=10,6 Гц);

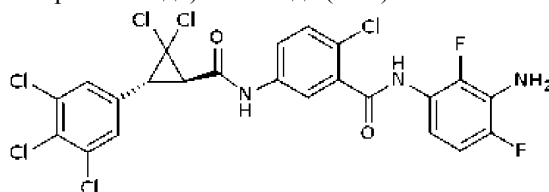
ESIMS масса/заряд 397 ([M+Na] $^+$).

Пример 13. Получение трет-бутил-N-((трет-бутоксикарбонил)-N-(3-(2-хлор-5-((1R,3R)-2,2-дихлор-3-(3,4,5-трихлорфенил)циклопропан-1-карбоксамидо)бензамидо)-2,6-дифторфенил)карбамата (DP1).



Указанное в заголовке соединение получали из (1R,3R)-2,2-дихлор-3-(3,4,5-трихлорфенил)циклопропан-1-карбоновой кислоты (С8) и трет-бутил-N-((трет-бутоксикарбонил)-N-(3-(5-амино-2-хлорбензамидо)-2,6-дифторфенил)карбамата (С11) в соответствии со способами, раскрытыми у Heemstra, R.J. et al. в примере 13 патента США № 9781935 В2 (WO 2016/168059), и выделяли в виде белого твердого вещества (0,171 г, 64%).

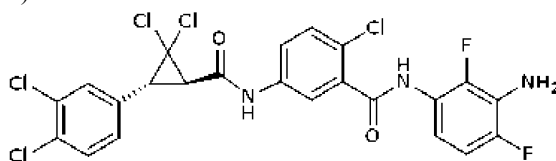
Пример 14. Получение N-(3-амино-2,4-дифторфенил)-2-хлор-5-((1R,3R)-2,2-дихлор-3-(3,4,5-трихлорфенил)циклопропан-1-карбоксамидо)бензамида (DP2).



Указанное в заголовке соединение получали из трет-бутил-N-((трет-бутоксикарбонил)-N-(3-(2-хлор-5-((1R,3R)-2,2-дихлор-3-(3,4,5-трихлорфенил)циклопропан-1-карбоксамидо)бензамидо)-2,6-дифторфенил)карбамата (DP1) в соответствии со способами, раскрытыми Heemstra, R.J. et al. в примере 62 патента США № 9781935 B2 (WO 2016/168059), и выделяли в виде белого твердого вещества (0,108 г, 84%).

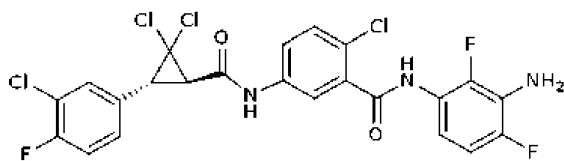
Следующие соединения получали аналогично процедурам, указанным в вышеизложенных примерах, или с помощью способов, раскрытых на схемах (см. выше.)

N-(3-Амино-2,4-дифторфенил)-2-хлор-5-((1R,3R)-2,2-дихлор-3-(3,4-дихлорфенил)циклопропан-1-карбоксамидо)бензамид (DP3).



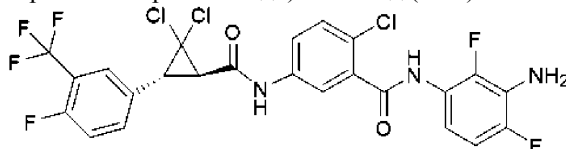
Выделенный в виде белого твердого вещества (0,115 г, 89%).

N-(3-Амино-2,4-дифторфенил)-2-хлор-5-((1R,3R)-2,2-дихлор-3-(3-хлор-4-фторфенил)циклопропан-1-карбоксамидо)бензамид (DP4).



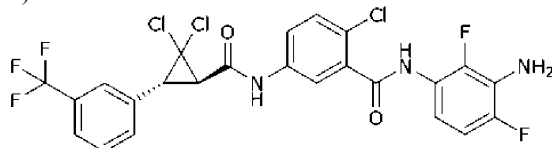
Выделенный в виде белого твердого вещества (0,087 г, 84%).

N-(3-Амино-2,4-дифторфенил)-2-хлор-5-((1R,3R)-2,2-дихлор-3-(4-фтор-3-(трифторметил)фенил)циклопропан-1-карбоксамидо)бензамид (DP5).



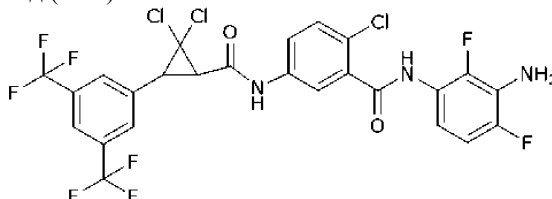
Выделенный в виде белой пены (0,043 г, 53%).

N-(3-Амино-2,4-дифторфенил)-2-хлор-5-((1R,3R)-2,2-дихлор-3-(3-(трифторметил)фенил)циклопропан-1-карбоксамидо)бензамид (DP6).



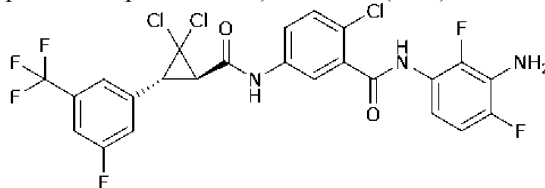
Выделенный в виде белого твердого вещества (0,860 г, 85%).

транс-Г-(3-Амино-2,4-дифторфенил)-5-(3-(3,5-бис(трифторметил)фенил)-2,2-дихлорциклопропан-1-карбоксамидо)-2-хлорбензамид (DP7).



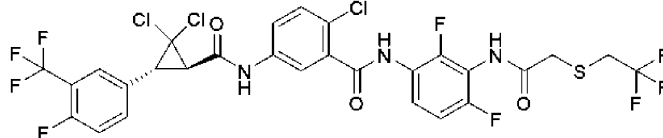
Выделенный в виде белой пены (1,27 г, 98%).

N-(3-Амино-2,4-дифторфенил)-2-хлор-5-((1R,3R)-2,2-дихлор-3-(3-фтор-5-(трифторметил)фенил)циклопропан-1-карбоксамидо)бензамид (DP8).



Выделенный в виде белого твердого вещества (0,784 г, 87%).

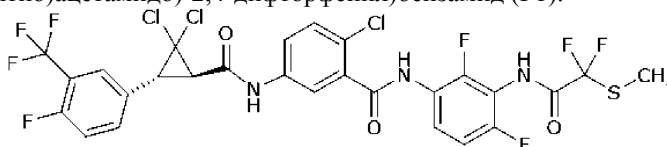
Пример 15. Получение 2-хлор-5-((1R,3R)-2,2-дихлор-3-(4-фтор-3-(трифторметил)фенил)циклопропан-1-карбоксамидо)-N-(2,4-дифтор-3-(2-((2,2,2-трифторэтил)тио)ацетидамо)фенил)бензамида (F15).



В перемешиваемый с помощью магнитной мешалки раствор N-(3-амино-2,4-дифторфенил)-2-хлор-5-((1R,3R)-2,2-дихлор-3-(4-фтор-3-(трифторметил)фенил)циклопропан-1-карбоксамидо)бензамида (DP5; 250 миллиграммов (мг), 0,419 миллимоль (ммоль)) в этилацетате (4 миллилитра (мл)) добавляли 2-((2,2,2-трифторэтил)тио)уксусную кислоту (77 мг, 0,440 ммоль) с последующим добавлением пиридина (134 микролитра (мкл), 1,26 ммоль) и 2,4,6-трипропил-1,3,5,2,4,6-триоксатрифосфинан-2,4,6-триоксида (ТЗР®; 503 мкл, 0,838 ммоль) и полученный светло-желтый раствор нагревали до 55°C и перемешивали в течение 12 ч. Раствор концентрировали в потоке газообразного азота (N₂) и неочищенный остаток очищали с помощью автоматизированной флэш-хроматографии (силикагель (SiO₂); от 0 до 60% этилацетата в гексанах) с получением указанного в заголовке соединения (284 мг, 90%) в виде белого твердого вещества.

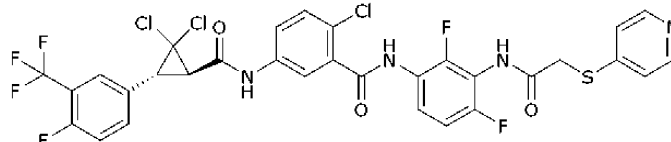
Следующие соединения получали аналогично процедуре, указанной в примере 15.

2-Хлор-5-((1R,3R)-2,2-дихлор-3-(4-фтор-3-(трифторметил)фенил)циклопропан-1-карбоксамидо)-N-(3-(2,2-дифтор-2-(метилтио)ацетидамо)-2,4-дифторфенил)бензамид (F1).



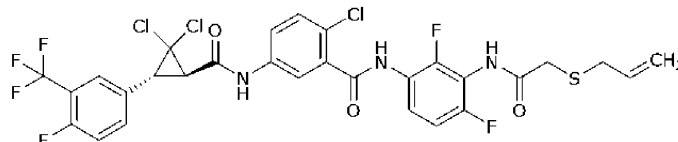
Выделенный в виде белого твердого вещества (29 мг, 46%).

2-Хлор-5-((1R,3R)-2,2-дихлор-3-(4-фтор-3-(трифторметил)фенил)циклопропан-1-карбоксамидо)-N-(2,4-дифтор-3-(2-(пиридин-4-илтио)ацетидамо)фенил)бензамид (F2).



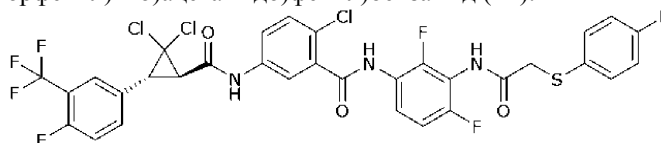
Выделенный в виде светло-бежевой пены (82 мг, 79%).

N-(3-(2-(Аллилтио)ацетидамо)-2,4-дифторфенил)-2-хлор-5-((1R,3R)-2,2-дихлор-3-(4-фтор-3-(трифторметил)фенил)циклопропан-1-карбоксамидо)бензамид (F3).



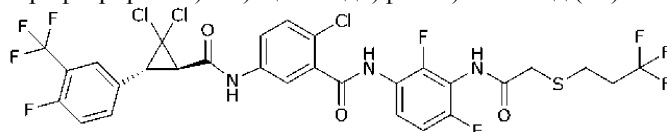
Выделенный в виде белого твердого вещества (85 мг, 85%).

2-Хлор-5-((1R,3R)-2,2-дихлор-3-(4-фтор-3-(трифторметил)фенил)циклопропан-1-карбоксамидо)-N-(2,4-дифтор-3-(2-((4-фторфенил)тио)ацетидамо)фенил)бензамид (F4).



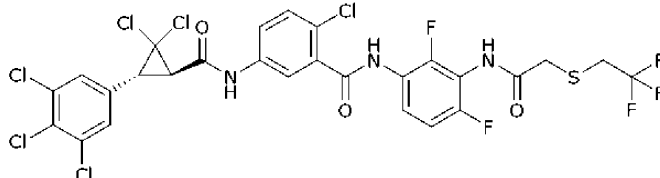
Выделенный в виде белого твердого вещества (80 мг, 74%).

2-Хлор-5-((1R,3R)-2,2-дихлор-3-(4-фтор-3-(трифторметил)фенил)циклопропан-1-карбоксамидо)-N-(2,4-дифтор-3-(2-((3,3,3-трифторпропил)тио)ацетида)фенил)бензамид (F5).



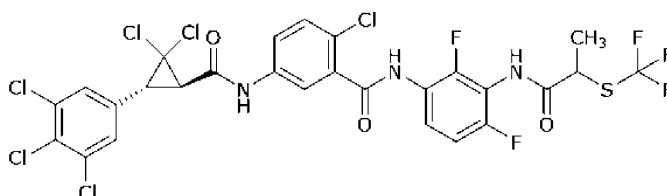
Выделенный в виде белого твердого вещества (81 мг, 80%).

2-Хлор-5-((1R,3R)-2,2-дихлор-3-(3,4,5-трихлорфенил)циклопропан-1-карбоксамидо)-N-(2,4-дифтор-3-(2-((2,2,2-трифторэтил)тио)ацетида)фенил)бензамид (F6).



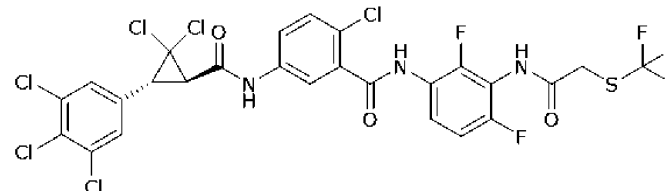
Выделенный в виде белого твердого вещества (122 мг, 75%).

2-Хлор-5-((1R,3R)-2,2-дихлор-3-(3,4,5-трихлорфенил)циклопропан-1-карбоксамидо)-N-(2,4-дифтор-3-(2-(трифторметил)тио)пропанамида)фенил)бензамид (F7).



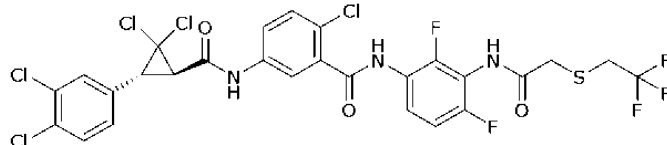
Выделенный в виде белого твердого вещества (129 мг, 80%).

2-Хлор-5-((1R,3R)-2,2-дихлор-3-(3,4,5-трихлорфенил)циклопропан-1-карбоксамидо)-N-(2,4-дифтор-3-(2-(трифторметил)тио)ацетида)фенил)бензамид (F8).



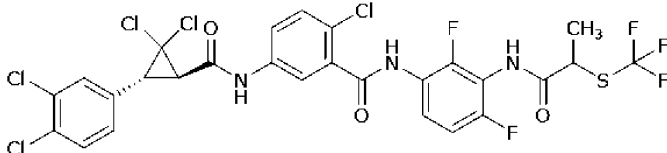
Выделенный в виде белого твердого вещества (125 мг, 79%).

2-Хлор-5-((1R,3R)-2,2-дихлор-3-(3,4-дихлорфенил)циклопропан-1-карбоксамидо)-N-(2,4-дифтор-3-(2-((2,2,2-трифторэтил)тио)ацетида)фенил)бензамид (F9).



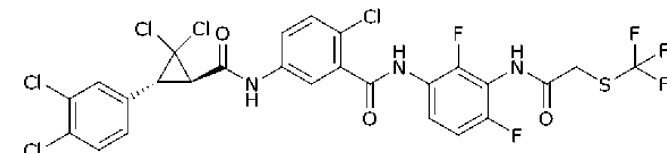
Выделенный в виде белого твердого вещества (136 мг, 68%).

2-Хлор-5-((1R,3R)-2,2-дихлор-3-(3,4-дихлорфенил)циклопропан-1-карбоксамидо)-N-(2,4-дифтор-3-(2-(трифторметил)тио)пропанамида)фенил)бензамид (F10).



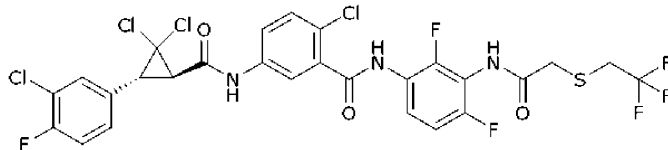
Выделенный в виде белого твердого вещества (142 мг, 73%).

2-Хлор-5-((1R,3R)-2,2-дихлор-3-(3,4-дихлорфенил)циклопропан-1-карбоксамидо)-N-(2,4-дифтор-3-(2-(трифторметил)тио)ацетида)фенил)бензамид (F11).



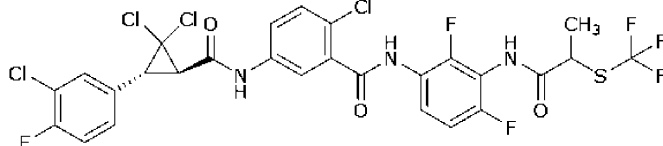
Выделенный в виде белого твердого вещества (152 мг, 79%).

2-Хлор-5-((1R,3R)-2,2-дихлор-3-(3-хлор-4-фторфенил)циклопропан-1-карбоксамидо)-N-(2,4-дифтор-3-(2-((2,2,2-трифторэтил)тио)ацетиламино)фенил)бензамид (F12).



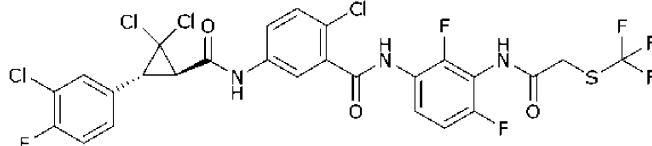
Выделенный в виде белого твердого вещества (141 мг, 70%).

2-Хлор-5-((1R,3R)-2,2-дихлор-3-(3-хлор-4-фторфенил)циклопропан-1-карбоксамидо)-N-(2,4-дифтор-3-(2-((трифторметил)тио)пропанамидо)фенил)бензамид (F13).



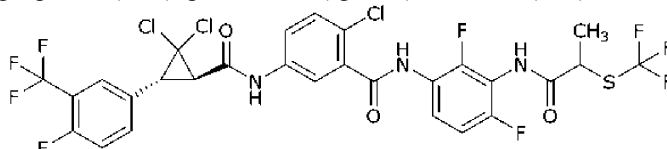
Выделенный в виде белого твердого вещества (151 мг, 76%).

2-Хлор-5-((1R,3R)-2,2-дихлор-3-(3-хлор-4-фторфенил)циклопропан-1-карбоксамидо)-N-(2,4-дифтор-3-(2-((трифторметил)тио)ацетиламино)фенил)бензамид (F14).



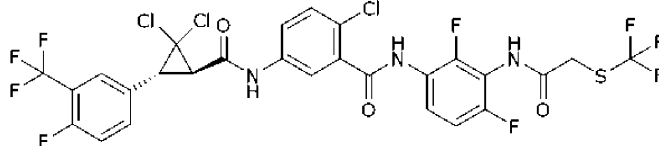
Выделенный в виде белого твердого вещества (143 мг, 74%).

2-Хлор-5-((1R,3R)-2,2-дихлор-3-(4-фтор-3-(трифторметил)фенил)циклопропан-1-карбоксамидо)-N-(2,4-дифтор-3-(2-((трифторметил)тио)пропанамидо)фенил)бензамид (F16).



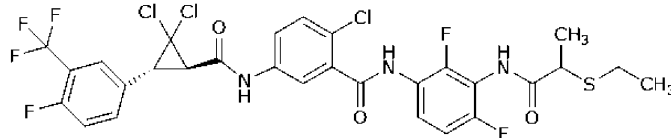
Выделенный в виде белого твердого вещества (302 мг, 91%).

2-Хлор-5-((1R,3R)-2,2-дихлор-3-(4-фтор-3-(трифторметил)фенил)циклопропан-1-карбоксамидо)-N-(2,4-дифтор-3-(2-((трифторметил)тио)ацетиламино)фенил)бензамид (F17).



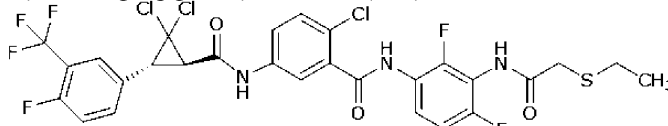
Выделенный в виде белого твердого вещества (426 мг, 83%).

2-Хлор-5-((1R,3R)-2,2-дихлор-3-(4-фтор-3-(трифторметил)фенил)циклопропан-1-карбоксамидо)-N-(3-(2-(этилтио)пропанамидо)-2,4-дифторфенил)бензамид (F18).



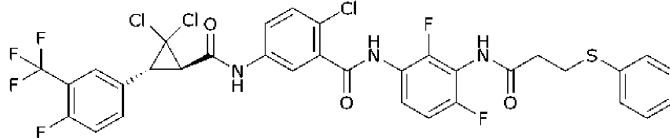
Выделенный в виде белой пены (101 мг, 80%).

2-Хлор-5-((1R,3R)-2,2-дихлор-3-(4-фтор-3-(трифторметил)фенил)циклопропан-1-карбоксамидо)-N-(3-(2-(этилтио)ацетиламино)-2,4-дифторфенил)бензамид (F19).



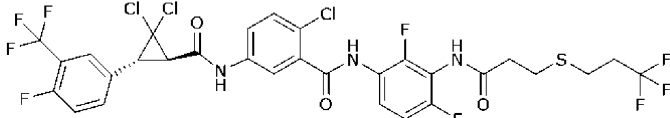
Выделенный в виде белого твердого вещества (117 мг, 95%).

2-Хлор-5-((1R,3R)-2,2-дихлор-3-(4-фтор-3-(трифторметил)фенил)циклопропан-1-карбоксамидо)-N-(2,4-дифтор-3-(3-(фенилтио)пропанамидо)фенил)бензамид (F20).



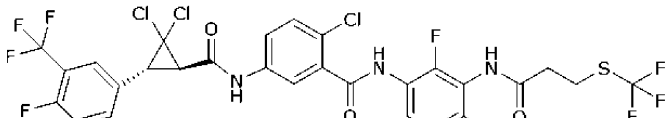
Выделенный в виде белого твердого вещества (89 мг, 83%).

2-Хлор-5-((1R,3R)-2,2-дихлор-3-(4-фтор-3-(трифторметил)фенил)циклопропан-1-карбоксамидо)-N-(2,4-дифтор-3-(3-((3,3,3-трифторпропил)тио)пропанамидо)фенил)бензамид (F21).



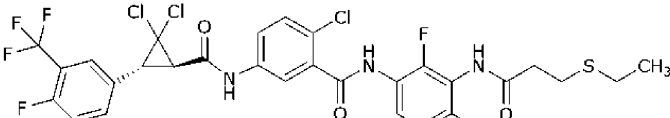
Выделенный в виде белого твердого вещества (77 мг, 74%).

2-Хлор-5-((1R,3R)-2,2-дихлор-3-(4-фтор-3-(трифторметил)фенил)циклопропан-1-карбоксамидо)-N-(2,4-дифтор-3-(3-(трифторметил)тио)пропанамидо)фенил)бензамид (F22).



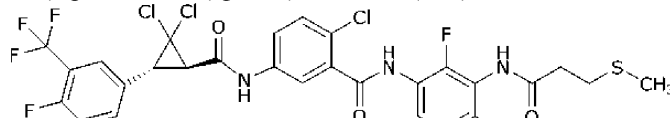
Выделенный в виде белого твердого вещества (83 мг, 83%).

2-Хлор-5-((1R,3R)-2,2-дихлор-3-(4-фтор-3-(трифторметил)фенил)циклопропан-1-карбоксамидо)-N-(3-(3-(этилтио)пропанамидо)-2,4-дифторфенил)бензамид (F23).



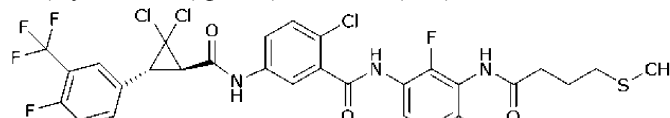
Выделенный в виде белого твердого вещества (61 мг, 65%).

2-Хлор-5-((1R,3R)-2,2-дихлор-3-(4-фтор-3-(трифторметил)фенил)циклопропан-1-карбоксамидо)-N-(2,4-дифтор-3-(3-(метилтио)пропанамидо)фенил)бензамид (F24).



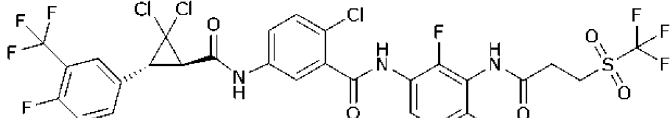
Выделенный в виде белого твердого вещества (72 мг, 78%).

2-Хлор-5-((1R,3R)-2,2-дихлор-3-(4-фтор-3-(трифторметил)фенил)циклопропан-1-карбоксамидо)-N-(2,4-дифтор-3-(4-(метилтио)бутанамидо)фенил)бензамид (F25).



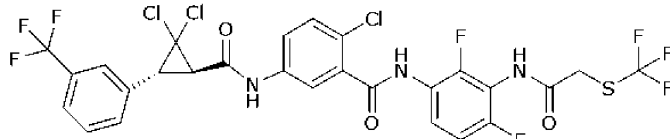
Выделенный в виде белого твердого вещества (57 мг, 60%).

2-Хлор-5-((1R,3R)-2,2-дихлор-3-(4-фтор-3-(трифторметил)фенил)циклопропан-1-карбоксамидо)-N-(2,4-дифтор-3-(3-((трифторметил)сульфонил)пропанамидо)фенил)бензамид (F46).



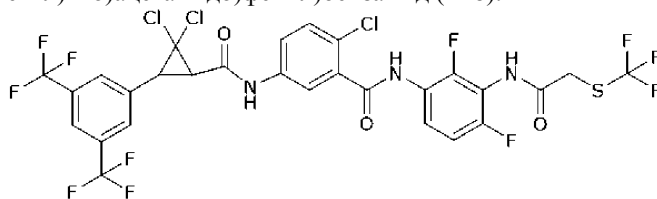
Выделенный в виде белого твердого вещества (55 мг, 53%).

2-Хлор-5-((1R,3R)-2,2-дихлор-3-(3-(трифторметил)фенил)циклопропан-1-карбоксамидо)-N-(2,4-дифтор-3-(2-((трифторметил)тио)ацетидамо)фенил)бензамид (F47).



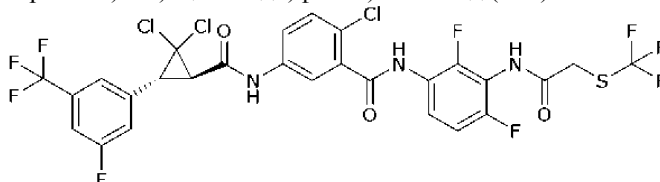
Выделенный в виде белого твердого вещества (74 мг, 75%).

транс-5-(3-(3,5-Бис(трифторметил)фенил)-2,2-дихлорциклопропан-1-карбоксамидо)-2-хлор-N-(2,4-дифтор-3-(2-((трифторметил)тио)ацетиламино)фенил)бензамид (F48).



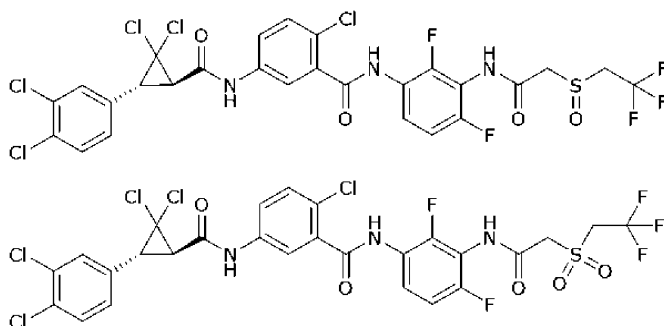
Выделенный в виде белой пены (110 мг, 90%).

2-Хлор-5-((1R,3R)-2,2-дихлор-3-(3-фтор-5-(трифторметил)фенил)циклопропан-1-карбоксамидо)-N-(2,4-дифтор-3-(2-((трифторметил)тио)ацетиламино)фенил)бензамид (F49).



Выделенный в виде белого твердого вещества (70 мг, 84%).

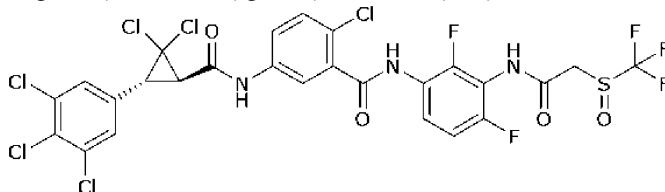
Пример 16. Получение 2-хлор-5-((1R,5R)-2,2-дихлор-3-(3,4-дихлорфенил)циклопропан-1-карбоксамидо)-N-(2,4-дифтор-3-(2-((2,2,2-трифторэтил)сульфинил)ацетиламино)фенил)бензамида (F30) и 2-хлор-5-((1R,3R)-2,2-дихлор-3-(3,4-дихлорфенил)циклопропан-1-карбоксамидо)-N-(2,4-дифтор-3-(2-((2,2,2-трифторэтил)сульфонил)ацетиламино)фенил)бензамида (F42).



В перемешиваемый с помощью магнитной мешалки раствор 2-хлор-5-((1R,3R)-2,2-дихлор-3-(3,4-дихлорфенил)циклопропан-1-карбоксамидо)-N-(2,4-дифтор-3-(2-((2,2,2-трифторэтил)тио)ацетиламино)фенил)бензамида (F9; 78 мг, 0,11 ммоль) в 1,2-дихлорэтане (DCE; 2,1 мл) добавляли 3-хлорпероксибензойную кислоту (34,1 мг, 0,148 ммоль) при 0°C и обеспечивали медленное нагревание полученного бесцветного раствора до комнатной температуры в течение периода, составляющего 16 ч. Анализ реакционной смеси молочного цвета (белый осадок) с помощью LCMS свидетельствовал о полном расходовании исходного материала с превращением в сульфоксид (92%) и сульфон (8%). Смесь нагревали до 45°C и перемешивали в течение ночи с получением соотношения продуктов в виде сульфоксида и сульфона 43:56. Реакционную смесь молочного цвета разбавляли этилацетатом (15 мл) и полученный раствор промывали последовательно 10% водным раствором бисульфита натрия (2×5 мл), насыщенным водным раствором бикарбоната натрия (5 мл) и насыщенным водным раствором хлорида натрия (солевой раствор; 5 мл), высушивали над сульфатом натрия, фильтровали и концентрировали при пониженном давлении. Остаток очищали с помощью автоматизированной флэш-хроматографии (SiO₂; от 0 до 90% этилацетата в гексанах) с получением указанных в заголовке соединений (F30, 30 мг, 38%; F42, 41 мг, 51%) в виде белых твердых веществ.

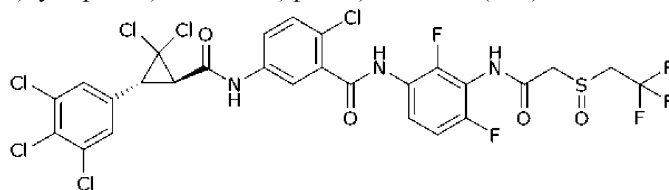
Следующие соединения получали аналогично процедуре, указанной в примере 16.

2-Хлор-5-((1R,3R)-2,2-дихлор-3-(3,4,5-трихлорфенил)циклопропан-1-карбоксамидо)-N-(2,4-дифтор-3-(2-((трифторметил)сульфинил)ацетиламино)фенил)бензамид (F26).



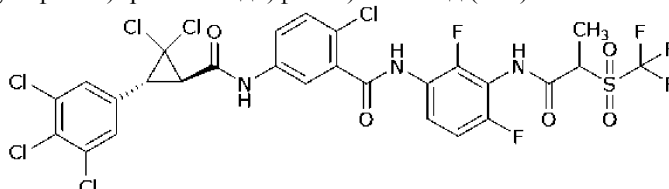
Выделенный в виде белого твердого вещества (22 мг, 32%).

2-Хлор-5-((1R,3R)-2,2-дихлор-3-(3,4,5-трихлорфенил)циклопропан-1-карбоксамидо)-N-(2,4-дифтор-3-(2-((2,2,2-трифторэтил)сульфинил)ацетиламино)фенил)бензамид (F29).



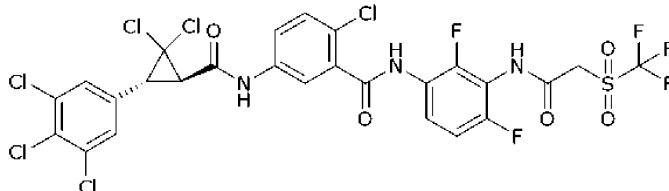
Выделенный в виде белого твердого вещества (27 мг, 40%).

2-Хлор-5-((1R,3R)-2,2-дихлор-3-(3,4,5-трихлорфенил)циклопропан-1-карбоксамидо)-N-(2,4-дифтор-3-(2-((трифторметил)сульфонил)пропанамидо)фенил)бензамид (F35).



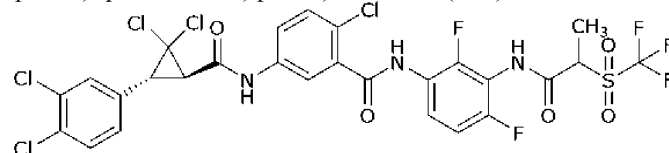
Выделенный в виде белого твердого вещества (27 мг, 35%).

2-Хлор-5-((1R,3R)-2,2-дихлор-3-(3,4,5-трихлорфенил)циклопропан-1-карбоксамидо)-N-(2,4-дифтор-3-(2-((трифторметил)сульфонил)ацетиламино)фенил)бензамид (F36).



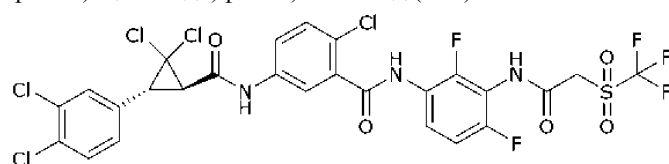
Выделенный в виде белого твердого вещества (32 мг, 46%).

2-Хлор-5-((1R,3R)-2,2-дихлор-3-(3,4-дихлорфенил)циклопропан-1-карбоксамидо)-N-(2,4-дифтор-3-(2-((трифторметил)сульфонил)пропанамидо)фенил)бензамид (F37).



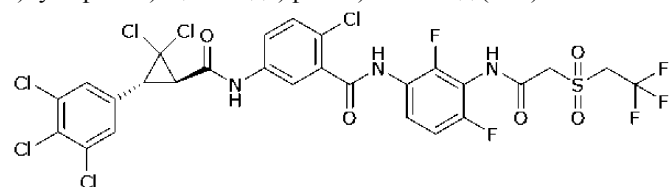
Выделенный в виде белого твердого вещества (30 мг, 32%).

2-Хлор-5-((1R,3R)-2,2-дихлор-3-(3,4-дихлорфенил)циклопропан-1-карбоксамидо)-N-(2,4-дифтор-3-(2-((трифторметил)сульфонил)ацетиламино)фенил)бензамид (F38).



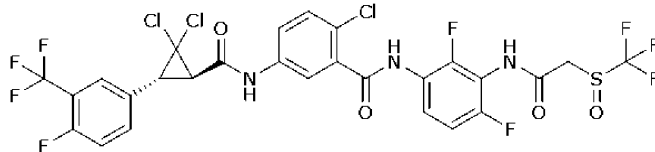
Выделенный в виде белого твердого вещества (70 мг, 69%).

2-Хлор-5-((1R,3R)-2,2-дихлор-3-(3,4,5-трихлорфенил)циклопропан-1-карбоксамидо)-N-(2,4-дифтор-3-(2-((2,2,2-трифторэтил)сульфонил)ацетиламино)фенил)бензамид (F41).



Выделенный в виде белого твердого вещества (32 мг, 47%).

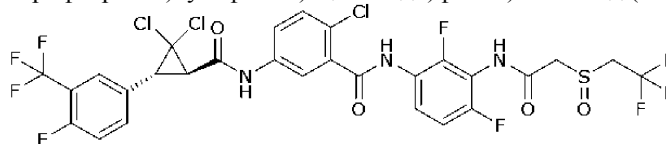
Пример 17. Получение 2-хлор-5-((1R,3R)-2,2-дихлор-3-(4-фтор-3-(трифторметил)фенил)циклопропан-1-карбоксамидо)-N-(2,4-дифтор-3-(2-((трифторметил)сульфинил)ацетиламино)фенил)бензамида (F33).



В раствор 2-хлор-5-((1R,3R)-2,2-дихлор-3-(4-фтор-3-(трифторметил)фенил)циклопропан-1-карбоксамидо)-N-(2,4-дифтор-3-(2-((трифторметил)тио)ацетиламино)фенил)бензамида (F17; 197 мг, 0,267 ммоль) в уксусной кислоте (2,7 мл) добавляли тетрагидрат пербората натрия (62 мг, 0,40 ммоль) и полученную смесь молочного цвета нагревали до 55°C и перемешивали в течение 16 ч. Реакционную смесь нагревали до 65°C и перемешивали в течение 5 ч, охлаждали до 55°C и обрабатывали с помощью дополнительного количества пербората (12 мг, 0,053 ммоль). Реакционную смесь молочного цвета перемешивали при 55°C в течение 16 ч, охлаждали до комнатной температуры, разбавляли дихлорметаном (50 мл) и осторожно нейтрализовали насыщенным водным раствором бикарбоната натрия. Фазы разделяли и водную фазу экстрагировали с помощью дополнительного количества дихлорметана (10 мл). Объединенные органические фазы промывали солевым раствором (25 мл) и высушивали путем пропускания через картридж фазоразделителя. Растворитель выпаривали и полученный остаток очищали с помощью автоматизированной флэш-хроматографии (SiO₂; от 0 до 60% этилацетата в гексанах) с получением указанного в заголовке соединения (19 мг, 9,4%) в виде белого твердого вещества.

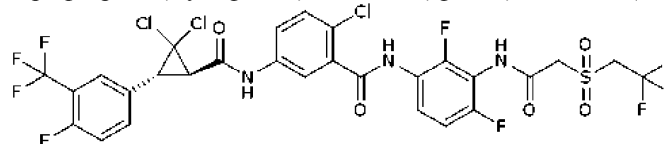
Следующие соединения получали аналогично процедуре, указанной в примере 17.

2-Хлор-5-((1R,3R)-2,2-дихлор-3-(4-фтор-3-(трифторметил)фенил)циклопропан-1-карбоксамидо)-N-(2,4-дифтор-3-(2-((2,2,2-трифторэтил)сульфинил)ацетиламино)фенил)бензамид (F32).



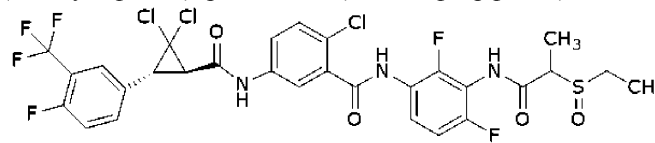
Выделенный в виде белого твердого вещества (118 мг, 62%).

2-Хлор-5-((1R,3R)-2,2-дихлор-3-(4-фтор-3-(трифторметил)фенил)циклопропан-1-карбоксамидо)-N-(2,4-дифтор-3-(2-((2,2,2-трифторэтил)сульфонил)ацетиламино)фенил)бензамид (F44).



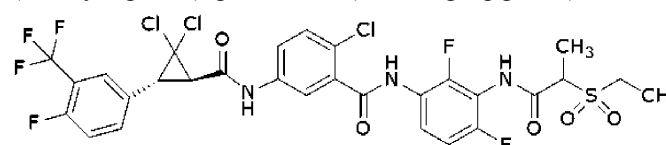
Выделенный в виде белого твердого вещества (47 мг, 24%).

Пример 18. Получение 2-хлор-5-((1R,3R)-2,2-дихлор-3-(4-фтор-3-(трифторметил)фенил)циклопропан-1-карбоксамидо)-N-(3-(2-(этилсульфинил)пропанамидо)-2,4-дифторфенил)бензамида (F34).



Растворяли 2-хлор-5-((1R,3R)-2,2-дихлор-3-(4-фтор-3-(трифторметил)фенил)циклопропан-1-карбоксамидо)-N-(3-(2-(этилтио)пропанамидо)-2,4-дифторфенил)бензамид (F18) (0,130 г, 0,182 ммоль) в гексафтор-изопропанол (5 мл). При комнатной температуре добавляли 30% водный раствор пероксида водорода (0,083 г, 0,729 ммоль). Через 2 ч реакцию смесь выливали в этилацетат (50 мл) и промывали насыщенным водным раствором бисульфита натрия (10 мл) и водой (10 мл). Органический экстракт концентрировали в вакууме на ротационном испарителе и полученный неочищенный продукт очищали с помощью флэш-хроматографии на диоксиде кремния и С-18 с получением указанного в заголовке соединения (0,066 г, 47%) в виде белой пены (смесь диастереомеров).

Пример 19. Получение 2-хлор-5-((1R,3R)-2,2-дихлор-3-(4-фтор-3-(трифторметил)фенил)циклопропан-1-карбоксамидо)-N-(3-(2-(этилсульфонил)пропанамидо)-2,4-дифторфенил)бензамида (F45).

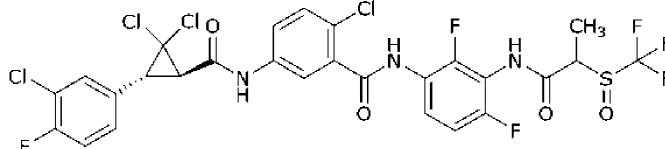


Растворяли 2-хлор-5-((1R,3R)-2,2-дихлор-3-(4-фтор-3-(трифторметил)фенил)циклопропан-1-карбоксамидо)-N-(3-(2-(этилтио)пропанамидо)-2,4-дифторфенил)бензамид (F18) (0,093 г, 0,130 ммоль) в

2 мл метанола (2 мл). При комнатной температуре добавляли Oxone® (0,100 г, 0,326 ммоль). Через 20 ч реакционную смесь выливали в этилацетат (50 мл) и промывали насыщенным водным раствором бисульфита натрия (10 мл) и водой (10 мл). Органический экстракт концентрировали под вакуумом на роторном испарителе и полученный неочищенный продукт очищали с помощью флэш-хроматографии на силикагеле с получением указанного в заголовке соединения (0,079 г, 77%) в виде белого твердого вещества.

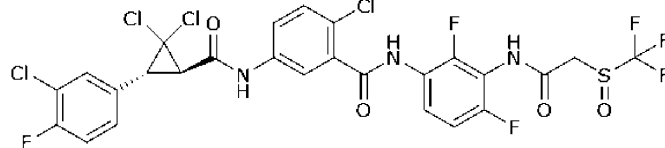
Следующие соединения получали аналогично процедуре, указанной в примере 19.

2-Хлор-5-((1R,3R)-2,2-дихлор-3-(3-хлор-4-фторфенил)циклопропан-1-карбоксамидо)-N-(2,4-дифтор-3-(2-((трифторметил)сульфинил)пропанамидо)фенил)бензамид (F27).



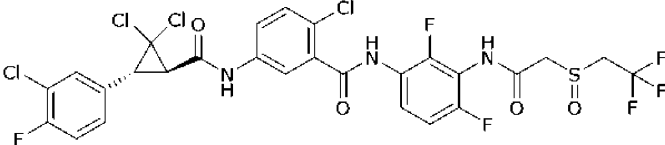
Выделенный в виде белого твердого вещества (28 мг, 24%).

2-Хлор-5-((1R,3R)-2,2-дихлор-3-(3-хлор-4-фторфенил)циклопропан-1-карбоксамидо)-N-(2,4-дифтор-3-(2-((трифторметил)сульфинил)ацетидамо)фенил)бензамид (F28).



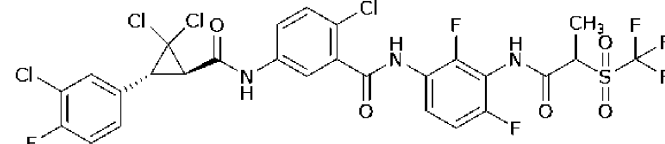
Выделенный в виде светло-телесного твердого вещества (13 мг, 15%).

2-Хлор-5-((1R,3R)-2,2-дихлор-3-(3-хлор-4-фторфенил)циклопропан-1-карбоксамидо)-N-(2,4-дифтор-3-(2-((2,2,2-трифторэтил)сульфинил)ацетидамо)фенил)бензамид (F31).



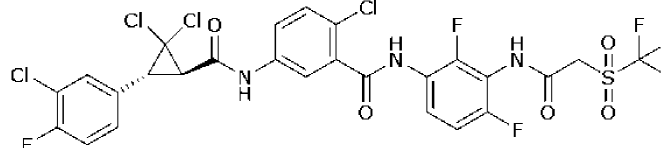
Выделенный в виде белого твердого вещества (16 мг, 19%).

2-Хлор-5-((1R,3R)-2,2-дихлор-3-(3-хлор-4-фторфенил)циклопропан-1-карбоксамидо)-N-(2,4-дифтор-3-(2-((трифторметил)сульфонил)пропанамидо)фенил)бензамид (F39).



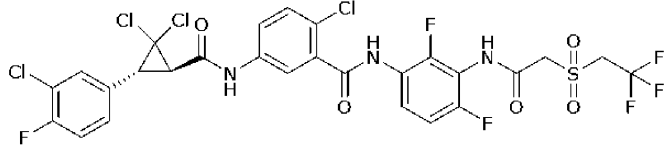
Выделенный в виде белого твердого вещества (27 мг, 25%).

2-Хлор-5-((1R,3R)-2,2-дихлор-3-(3-хлор-4-фторфенил)циклопропан-1-карбоксамидо)-N-(2,4-дифтор-3-(2-((трифторметил)сульфонил)ацетидамо)фенил)бензамид (F40).



Выделенный в виде светло-телесного твердого вещества (30 мг, 32%).

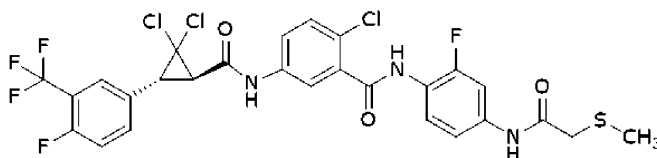
2-Хлор-5-((1R,3R)-2,2-дихлор-3-(3-хлор-4-фторфенил)циклопропан-1-карбоксамидо)-N-(2,4-дифтор-3-(2-((2,2,2-трифторэтил)сульфонил)ацетидамо)фенил)бензамид (F43).



Выделенный в виде белого твердого вещества (54 мг, 63%).

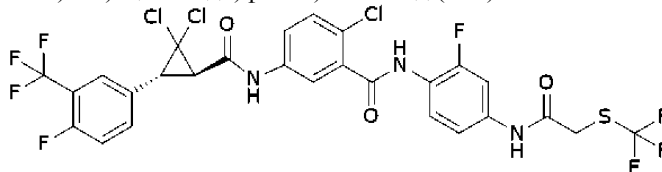
Следующие соединения получали аналогично процедуре, указанной в примере 15.

2-Хлор-5-((1R,3R)-2,2-дихлор-3-(4-фтор-3-(трифторметил)фенил)циклопропан-1-карбоксамидо)-N-(2-фтор-4-(2-(метилтио)ацетидамо)фенил)бензамид (F50).



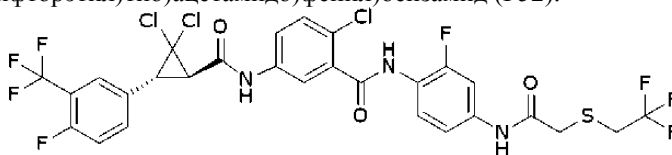
Выделенный в виде белого твердого вещества (38 мг, 50%).

2-Хлор-5-((1R,3R)-2,2-дихлор-3-(4-фтор-3-(трифторметил)фенил)циклопропан-1-карбоксамидо)-N-(2-фтор-4-(2-((трифторметил)тио)ацетамидо)фенил)бензамид (F51).



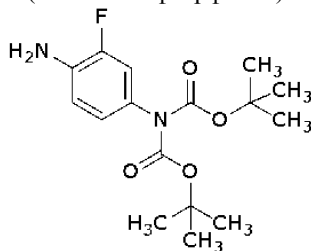
Выделенный в виде светло-желтой пены (58 мг, 75%).

2-Хлор-5-((1R,3R)-2,2-дихлор-3-(4-фтор-3-(трифторметил)фенил)циклопропан-1-карбоксамидо)-N-(2-фтор-4-(2-(2,2,2-трифторэтил)тио)ацетамидо)фенилбензамид (F52).



Выделенный в виде белой пены (59 мг, 75%).

Пример 20. Получение трет-бутил-N-(4-амино-3-фторфенил)-N-трет-бутоксикарбонилкарбамата (C15).



Указанное в заголовке соединение получали из трет-бутил-N-трет-бутоксикарбонил-N-(3-фтор-4-нитрофенил)карбамата в соответствии со способами, раскрытыми у Heemstra, R.J. et al. в примере 91 патента США № 9781935 В2, и выделяли в виде твердого вещества персикового цвета (3,475 г, 100%):

т.пл. 77-82°C;

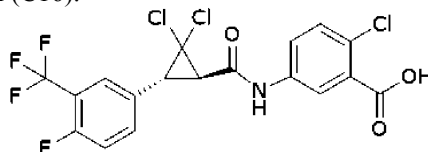
^1H ЯМР (300 МГц, DMSO- d_6) δ 6,90-6,83 (m, 1H), 6,74-6,64 (m, 2H), 5,23 (s, 2H), 1,38 (s, 18H);

^{19}F ЯМР (564 МГц, DMSO- d_6) δ -134,64, -134,66, -134,66, -134,68;

HRMS-ESI (масса/заряд) $[\text{M}]^+$ расщ. значение для $\text{C}_{16}\text{H}_{23}\text{FN}_2\text{O}_4$, 326,1642;

наблюдаемое значение 326,1646.

Пример 21. Получение 2-хлор-5-((1R,3R)-2,2-дихлор-3-(4-фтор-3-(трифторметил)фенил)циклопропан-1-карбоксамидо)бензойной кислоты (C16).

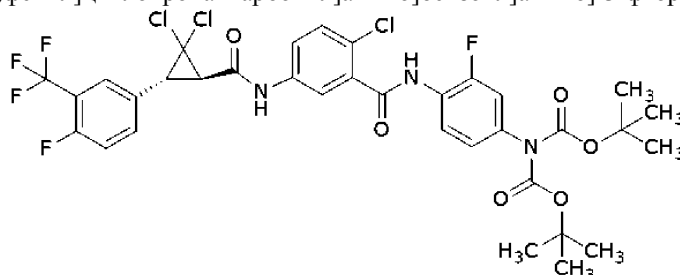


Указанное в заголовке соединение получали из (1R,3R)-2,2-дихлор-3-(4-фтор-3-(трифторметил)фенил)циклопропан-1-карбоновой кислоты (C10, полученной, как у Heemstra, R.J. et al., в публикации заявки на патент США № 2018/0098541 A1) и 5-амино-2-хлорбензойной кислоты в соответствии со способами, раскрытыми у Heemstra, R.J. et al. в примере 39 публикации заявки на патент США № 2018/0098541 A1, и выделяли в виде твердого бежевого вещества (5,80 г, 93%):

^1H ЯМР (400 МГц, DMSO- d_6) δ 13,48 (s, 1H), 10,94 (s, 1H), 8,17 (d, $J=2,7$ Гц, 1H), 7,94-7,72 (m, 3H), 7,68-7,44 (m, 2H), 3,68 (d, $J=8,4$ Гц, 1H), 3,49 (d, $J=8,5$ Гц, 1H); ^{19}F ЯМР (376 МГц, DMSO- d_6) δ -59,93 (d, $J=12,6$ Гц), -116,95 (q, $J=12,5$ Гц);

ESIMS масса/заряд 472 ($[\text{M}+\text{H}]^+$).

Пример 22. Получение трет-бутил-N-трет-бутоксикарбонил-N-[4-[[2-хлор-5-[[[(1R,3R)-2,2-дихлор-3-[4-фтор-3-(трифторметил)фенил]циклопропанкарбонил]амино]бензоил]амино]-3-фторфенил]карбамата (C17).



Указанное в заголовке соединение получали из трет-бутил-N-(4-амино-3-фторфенил)-N-трет-бутоксикарбонилкарбамата (полученного из трет-бутил-N-трет-бутоксикарбонил-N-(3-фтор-4-нитрофенил)карбамата в соответствии со способами, раскрытыми Heemstra, R.J. et al. в примере 91 патента США № 9781935 B2) и 2-хлор-5-((1R,3R)-2,2-дихлор-3-(4-фтор-3-(трифторметил)фенил)циклопропан-1-карбоксамидо)бензойной кислоты (C16) в соответствии со способами, раскрытыми для F602 в примере 15 у Heemstra, R.J. et al. в патенте США № 9781935 B2, и выделяли в виде белого твердого вещества (0,606 г, 89%):

т.пл. 128-132°C;

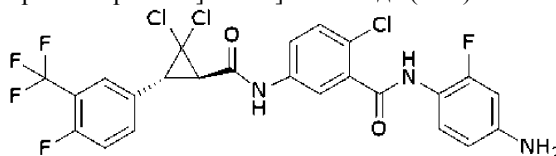
^1H ЯМР (300 МГц, DMSO- d_6) δ 10,98 (s, 1H), 10,49 (s, 1H), 7,94-7,75 (m, 5H), 7,63-7,54 (m, 2H), 7,31 (dd, $J=11,3, 2,4$ Гц, 1H), 7,09 (d, $J=8,6$ Гц, 1H), 3,70 (d, $J=8,5$ Гц, 1H), 3,52 (d, $J=8,5$ Гц, 1H), 1,41 (s, 18H);

^{19}F ЯМР (471 МГц, DMSO- d_6) δ -59,91 (d, $J=12,3$ Гц), -116,93 (ddq, $J=18,3, 12,2, 6,4$ Гц), -121,42, -121,52 (m);

HRMS-ESI (масса/заряд) $[M]^+$ расщ. значение для $\text{C}_{34}\text{H}_{31}\text{Cl}_3\text{F}_5\text{N}_3\text{O}_6$, 777,1199;

наблюдаемое значение 777,1192.

Пример 23. Получение N-(4-амино-2-фторфенил)-2-хлор-5-[[[(1R,3R)-2,2-дихлор-3-[4-фтор-3-(трифторметил)фенил]циклопропанкарбонил]амино]бензамида (C18).



Указанное в заголовке соединение получали из трет-бутил-N-трет-бутоксикарбонил-N-[4-[[2-хлор-5-[[[(1R,3R)-2,2-дихлор-3-[4-фтор-3-(трифторметил)фенил]циклопропанкарбонил]амино]бензоил]амино]-3-фторфенил]карбамата (C17) в соответствии со способами, раскрытыми для F175 в примере 62 у Heemstra, R.J. et al. в патенте США № 9781935 B2, и выделяли в виде бежевой пены (0,502 г, 94%):

^1H ЯМР (500 МГц, DMSO- d_6) δ 10,92 (s, 1H), 9,82 (s, 1H), 7,89-7,80 (m, 3H), 7,74 (dd, $J=8,8, 2,6$ Гц, 1H), 7,59 (dd, $J=10,7, 8,7$ Гц, 1H), 7,52 (d, $J=8,8$ Гц, 1H), 7,17 (t, $J=8,6$ Гц, 1H), 6,45-6,35 (m, 2H), 5,37 (s, 2H), 3,69 (d, $J=8,5$ Гц, 1H), 3,50 (d, $J=8,5$ Гц, 1H);

^{19}F ЯМР (471 МГц, DMSO- d_6) δ -59,91 (d, $J=12,3$ Гц), -116,94 (ddq, $J=18,3, 12,3, 6,5$ Гц), -122,15 (dd, $J=12,3, 8,8$ Гц);

HRMS-ESI (масса/заряд) $[M]^+$ расщ. значение для $\text{C}_{24}\text{H}_{15}\text{Cl}_3\text{F}_5\text{N}_3\text{O}_2$, 577,0150;

наблюдаемое значение 577,0152.

Отмечают, что некоторые реагенты и условия реакций могут являться не совместимыми с определенными функциональными группами, которые могут присутствовать в определенных соединениях формулы один или определенных соединениях, применяемых при получении определенных соединений формулы один. В таких случаях может быть необходимым использование стандартных протоколов введения и удаления защитных групп, описанных в полном объеме в литературе и общеизвестных специалисту в данной области техники. Кроме того, для завершения синтеза необходимых молекул в некоторых случаях может быть необходимым осуществление дополнительных стандартных стадий синтеза, не описанных в данном документе. Специалисту в данной области техники также будет понятно, что возможным является обеспечение синтеза необходимых молекул путем осуществления некоторых стадий путей синтеза в порядке, отличном от описанного порядка. Специалисту в данной области техники также будет понятно, что возможным является осуществление взаимопревращений стандартных функциональных групп или реакций замещения в необходимых соединениях с введением или модификацией заместителей.

Биологические анализы.

В данный документ включены следующие биоанализы в отношении совки малой (*Spodoptera exigua*), совки ни (*Trichoplusia ni*) и желтолихорадочного комара (*Aedes aegypti*) из-за ущерба, который они причиняют. Кроме того, совка малая и совка ни являются двумя надлежащими видами-индикаторами для широкого ряда жующих вредителей. Более того, тля персиковая зеленая является надлежащим видом-индикатором для широкого ряда питающихся соком растений вредителей. Результаты с

этими четырьмя видами-индикаторами вместе с желтолихорадочным комаром показывают широкую применимость соединений формулы один для борьбы с вредителями типов Arthropoda, Mollusca и Nematoda (Drewes et al.).

Пример А. Биологические анализы на примере совки малой (*Spodoptera exigua*, LAPHEG) ("BAW") и совки ни (*Trichoplusia ni*, TRIPNI) ("CL").

Совка малая является серьезным, представляющим экономическую проблему, вредителем люцерны, спаржи, видов свеклы, citrusовых, кукурузы, хлопчатника, видов лука, видов гороха, видов перца, видов картофеля, видов сои, видов сахарной свеклы, видов подсолнечника, табака и видов томата, помимо прочих сельскохозяйственных культур. Она обитает в Юго-Восточной Азии, но сейчас встречается в Африке, Австралии, Японии, Северной Америке и Южной Европе. Личинки могут собираться в большие скопления, вызывая значительные потери урожая. Она, как известно, является устойчивой в отношении некоторых пестицидов.

Совка ни является серьезным вредителем, встречающимся по всему миру. Она поражает люцерну, виды фасоли, виды свеклы, брокколи, брюссельскую капусту, кочанную капусту, канталупу, цветную капусту, сельдерей, виды браунколи, хлопчатник, виды огурца, баклажан, кудрявую капусту, салат-латук, виды дыни, горчицу, петрушку, виды гороха, виды перца, виды картофеля, виды сои, шпинат, тыкву, виды томата, виды репы и виды арбуза, помимо прочих сельскохозяйственных культур. Этот вид является весьма губительным для растений из-за его прожорливости. Личинки потребляют в три раза больше своей массы каждый день. Места поедания отличаются большим накоплением липкого, влажного фекального материала, который может способствовать более высокому уровню заболеваемости, при этом вызывая вторичные проблемы для растений в месте обитания. Она, как известно, является устойчивой в отношении некоторых пестицидов.

Следовательно, в связи с вышеуказанными факторами важен контроль этих вредителей. Кроме того, соединения, с помощью которых осуществляют контроль этих вредителей (BAW и CL), известных как жующие вредители, будут пригодны при борьбе с другими вредителями, которые жуют растения.

Некоторые соединения, раскрытые в данном документе, тестировали в отношении BAW и CL с применением процедур, описанных в следующих примерах. При описании результатов использовали "Оценочную таблицу для BAW и CL" (см. раздел с таблицами).

Биоанализы в отношении BAW.

Биоанализы в отношении BAW проводили посредством анализа с помощью 128-луночного планшета с пищевым рационом. Личинки BAW возрастом одна-пять секунд помещали в каждую лунку (3 мл) планшета с пищевым рационом, которые предварительно заполняли с помощью 1 мл искусственного пищевого рациона, в который вносили 50 мкг/см² тестового соединения (растворенной в 50 мкл смеси 90:10 ацетон-вода) (в каждую из восьми лунок), и затем обеспечивали высыхание. Планшеты накрывали прозрачным самоклеющимся покрытием, проделывали отверстия для обеспечения газообмена и выдерживали при 25°C, соотношение свет-темнота 14:10, в течение пяти-семи дней. Процент смертности регистрировали для личинок в каждой лунке; затем усредняли активность в восьми лунках. Результаты указаны в таблице под названием "Таблица ABC. Биологические результаты" (см. раздел с таблицами).

Биоанализы в отношении CL.

Биоанализы в отношении CL проводили посредством анализа с помощью 128-луночного планшета с пищевым рационом. Личинки CL возрастом одна-пять секунд помещали в каждую лунку (3 мл) планшета с пищевым рационом, которые предварительно заполняли с помощью 1 мл искусственного пищевого рациона, в который вносили 50 мкг/см² тестового соединения (растворенной в 50 мкл смеси 90:10 ацетон-вода) (в каждую из восьми лунок), и затем обеспечивали высыхание. Планшеты накрывали прозрачным самоклеющимся покрытием, проделывали отверстия для обеспечения газообмена и выдерживали при 25°C, соотношение свет-темнота 14:10, в течение пяти-семи дней. Процент смертности регистрировали для личинок в каждой лунке; затем усредняли активность в восьми лунках. Результаты указаны в таблице под названием "Таблица ABC. Биологические результаты" (см. раздел с таблицами).

Пример В. Биоанализы на примере тли персиковой зеленой (*Myzus persicae*, MYZUPE) ("GPA").

GPA является наиболее значительным вредителем-тлей на персиковых деревьях, вызывающим снижение интенсивности роста, сморщивание листьев и отмирание различных тканей. Она также опасна тем, что выступает в качестве переносчика вирусов растений, таких как вирус Y картофеля и вирус скручивания листьев картофеля, на представителей семейства пасленовых/картофеля Solanaceae и различных вирусов мозаики на многие другие пищевые культуры. GPA поражает такие растения как брокколи, лопух, капуста кочанная, морковь, цветная капуста, дайкон, баклажан, виды зеленой фасоли, салат-латук, макадамия, папайя, виды перца, виды батата, виды томата, кресс водяной и цуккини, помимо прочих сельскохозяйственных культур. GPA также поражает многие декоративные культуры, такие как гвоздика, хризантема, цветущая капуста белокочанная, пуансеттия и виды розы. GPA развила стойкость в отношении многих пестицидов. В настоящее время этот вредитель находится на третьем месте по количеству зарегистрированных случаев стойкости насекомых (Sparks et al.). Следовательно, в связи с вышеуказанными факторами важен контроль этого вредителя. Кроме того, соединения, с помощью которых осу-

шествляют контроль этого вредителя (GPA), известного как питающийся соком вредитель, пригодны при контроле других вредителей, которые питаются соком растений.

Некоторые соединения, раскрытые в данном документе, тестировали в отношении GPA с применением процедур, описанных в следующем примере. При описании результатов использовали "Оценочную таблицу для GPA и YFM" (см. раздел с таблицами).

В качестве тестового субстрата использовали проростки капусты кочанной, выращенные в 3-дюймовых горшках, с 2-3 небольшими (3-5 см) истинными листьями. Проростки инфицировали с помощью 20-50 GPA (на стадиях бескрылой взрослой особи и нимфы) за один день перед химической обработкой. Четыре горшка с отдельными проростками использовали для каждой обработки. Тестовые молекулы (2 мг) растворяли в 2 мл растворителя ацетон/метанол (1:1), получая маточные растворы с концентрацией 1000 ppm тестовой молекулы. Маточные растворы разбавляли 5X с помощью 0,025% Tween 20 в воде с получением раствора с концентрацией 200 ppm тестовой молекулы. Использовали ручной распылитель аспираторного типа для распыления раствора на обе стороны листьев капусты кочанной вплоть до стекания. Контрольные растения (проверка растворителя) обрызгивали только разбавителем, содержащим 20% растворителя ацетон/метанол (1:1) по объему. Обработанные растения выдерживали в камере для выдерживания в течение трех дней при примерно 25°C и относительной влажности (RH) окружающей среды перед оцениванием. Оценку проводили путем подсчета количества живых тлей на растение под микроскопом. Процент контроля измеряли с помощью поправочной формулы Эбботта (W.S. Abbott, "A Method of Computing the Effectiveness of an Insecticide", J. Econ. Entomol., 18 (1925), с. 265-267) следующим образом. Скорректированный % контроля = $100 \times (X - Y) / X$, где X = количество живых тлей на проверочных растениях с растворителем, а Y = количество живых тлей на обработанных растениях. Результаты указаны в таблице под названием "Таблица ABC. Биологические результаты" (см. раздел с таблицами).

Пример С. Биоанализы на примере желтолихорадочного комара (*Aedes aegypti*, AEDSAE) ("YFM").

YFM предпочитает питаться за счет человека в дневное время и наиболее часто встречается в местах обитания человека или вблизи них. YFM является переносчиком нескольких заболеваний. Данный комар может распространять вирусы лихорадки денге и желтой лихорадки. Желтая лихорадка является вторым наиболее опасным заболеванием, переносимым комарами, после малярии. Желтая лихорадка представляет собой острое вирусное геморрагическое заболевание, и до 50% сильно пораженных людей без лечения будут умирать от желтой лихорадки. Каждый год регистрируют около 200000 случаев желтой лихорадки, вызывающие 30000 смертей во всем мире. Лихорадка денге представляет собой опасное вирусное заболевание; ее иногда называют "костоломной лихорадкой" или "лихорадкой разбитого сердца" из-за сильной боли, которую она может вызывать. Лихорадка денге является причиной смерти приблизительно 20000 людей каждый год. Следовательно, в связи с вышеуказанными факторами важен контроль этого вредителя. Кроме того, соединения, с помощью которых осуществляют контроль этого вредителя (YFM), который известен как сосущий вредитель, пригодны для борьбы с другими вредителями, которые вызывают страдания людей и животных.

Некоторые соединения, раскрытые в данном документе, тестировали в отношении YFM с применением процедур, описанных в следующем абзаце. При описании результатов использовали "Оценочную таблицу для GPA и YFM" (см. раздел с таблицами).

Использовали основные планшеты, содержащие 400 мкг молекулы, растворенной в 100 мкл диметилсульфоксида (DMSO) (эквивалентно раствору с концентрацией 4000 ppm). Основной планшет объединенных молекул содержал 15 мкл на лунку. В этот планшет в каждую лунку добавляли 135 мкл смеси 90:10 воды/ацетона. Робот (Biomek® NXP Laboratory Automation Workstation) запрограммирован перенести 15 мкл материала, полученного в результате аспирации, из основного планшета в пустой 96-луночный неглубокий планшет ("дочерний" планшет). Подготавливали по 6 повторностей ("дочерних" планшетов) на основной планшет. Созданные "дочерние" планшеты затем сразу же инфицировали личинками YFM.

За день до обработки планшетов яйца комара помещали в воду Millipore, содержащую печеночный порошок, чтобы началось вылупление (4 г в 400 мл). После получения "дочерних" планшетов с помощью робота их инфицировали с помощью 220 мкл смеси печеночный порошок/личинки комара (личинки возрастом приблизительно 1 день). После инфицирования планшетов личинками комаров для покрытия планшета использовали препятствующую испарению крышку для снижения высыхания. Планшеты выдерживали при комнатной температуре в течение 3 дней перед оцениванием. Через 3 дня каждую лунку регистрировали и оценивали, исходя из смертности. Результаты указаны в таблице под названием "Таблица ABC. Биологические результаты" (см. раздел с таблицами).

Пригодные для применения в сельском хозяйстве соли присоединения кислоты, солевые производные, сольваты, сложноэфирные производные, полиморфы, изотопы и радионуклиды.

Соединения формулы один можно составлять в приемлемые с точки зрения сельского хозяйства соли присоединения кислоты. В качестве неограничивающего примера, аминная функциональная группа может образовывать соли с хлористоводородной, бромистоводородной, серной, фосфорной, уксусной, бензойной, лимонной, малоновой, салициловой, яблочной, фумаровой, щавелевой, янтарной, винной,

молочной, глюконовой, аскорбиновой, малеиновой, аспарагиновой, бензолсульфоновой, метансульфоновой, этансульфоновой, гидроксиметансульфоновой и гидроксиэтансульфоновой кислотами. Кроме того, в качестве неограничивающего примера, кислотная функциональная группа может образовывать соли, в том числе полученные с помощью щелочных или щелочноземельных металлов и полученные с помощью аммиака и аминов. Примеры предпочтительных катионов включают натрий, калий и магний.

Соединения формулы один можно составлять в производные солей. В качестве неограничивающего примера, солевые производные можно получать путем приведения свободного основания в контакт с достаточным количеством требуемой кислоты с получением соли. Свободное основание можно регенерировать путем обработки соли подходящим разбавленным водным раствором основания, таким как разбавленный водный раствор гидроксида натрия, карбоната калия, аммиака и бикарбоната натрия. В качестве примера, во многих случаях пестицид, такой как 2,4-D, делают более растворимым в воде путем его превращения в его диметиламинную соль.

Соединения формулы один можно составлять в стабильные комплексы с растворителем таким образом, что комплекс остается ненарушенным после удаления не задействованного в комплексе растворителя. Такие комплексы часто называют "солями". Однако особенно желательно получать стабильные гидраты с водой в качестве растворителя.

Соединения формулы один, содержащие кислотную функциональную группу, можно получать в виде сложноэфирных производных. Эти сложноэфирные производные затем можно использовать таким же образом, как используют соединения, раскрытые в данном документе.

Соединения формулы один можно получать в виде различных кристаллических полиморфов. Полиморфизм является важным для разработки агрохимикатов, поскольку различные кристаллические полиморфы или структуры одного соединения могут иметь весьма различные физические свойства и биологические характеристики.

Соединения формулы один можно получать с различными изотопами. Особенно важными являются соединения, содержащие ^2H (также известный как дейтерий) или ^3H (также известный как тритий) вместо ^1H . Соединения формулы один можно получать с различными радионуклидами. Особенно важными являются соединения, содержащие ^{14}C (также известный как радиоактивный изотоп углерода). Соединения формулы один, содержащие дейтерий, тритий или ^{14}C , можно использовать в биологических исследованиях, обеспечивая прослеживание в химических и физиологических процессах, и исследованиях периода полураспада, а также исследованиях МоА.

Комбинации.

В другом варианте осуществления настоящего изобретения соединения формулы один можно применять в комбинации (например, в сложной смеси или при одновременном либо последовательном применении) с одним или более активными ингредиентами.

В другом варианте осуществления настоящего изобретения соединения формулы один можно применять в комбинации (например, в сложной смеси или при одновременном либо последовательном применении) с одним или более активными ингредиентами, при этом каждый характеризуется МоА, который является одинаковым, аналогичным, но чаще всего отличным от МоА соединений формулы один.

В другом варианте осуществления соединения формулы один можно применять в комбинации (например, в сложной смеси или при одновременном либо последовательном применении) с одним или более соединениями с акарицидными, альгицидными, авицидными, бактерицидными, фунгицидными, гербицидными, инсектицидными, моллюскоцидными, нематоцидными, родентицидными и/или вируцидными свойствами.

В другом варианте осуществления соединения формулы один можно применять в комбинации (например, в сложной смеси или при одновременном либо последовательном применении) с одним или более соединениями, которые представляют собой антифиданты, отпугивающие птиц вещества, хемостерилизаторы, антидоты гербицидов, приманки для насекомых, отпугивающие насекомых вещества, отпугивающие млекопитающих вещества, средства для дезориентации самцов, активаторы роста растений, регуляторы роста растений и/или синергисты.

В другом варианте осуществления соединения формулы один можно также применять в комбинации (например, в сложной смеси или при одновременном, или последовательном применении) с одним или более биопестицидами.

В другом варианте осуществления в комбинациях пестицидных композиций соединения формулы один и активный ингредиент можно применять в широком ряде весовых соотношений. Например, в двухкомпонентной смеси в отношении весового соотношения соединения формулы один и активного ингредиента можно использовать весовые соотношения из табл. В. Однако в общем предпочтительными являются весовые соотношения от менее чем приблизительно 10:1 до приблизительно 1:10. Также иногда предпочтительно применять трех-, четырех-, пяти-, шести-, семикомпонентную смесь или смесь с большим количеством компонентов, содержащую молекулу формулы один и дополнительные два или более активных ингредиентов.

Весовые соотношения соединения формулы один и активного ингредиента также могут быть представлены как X:Y; где X представляет собой весовые части соединения формулы один, и Y представляет

собой весовые части активного ингредиента. Диапазон числовых значений весовых частей для X составляет $0 < X \leq 100$, а весовых частей для Y составляет $0 < Y \leq 100$ и показан наглядно в табл. С. В качестве неограничивающего примера, весовое соотношение соединения формулы один и активного ингредиента может составлять 20:1.

Диапазоны весовых соотношений соединения формулы один и активного ингредиента могут быть представлены как от $X_1:Y_1$ до $X_2:Y_2$, где X и Y определены выше.

В одном варианте осуществления диапазон весовых соотношений может составлять от $X_1:Y_1$ до $X_2:Y_2$, где $X_1 > Y_1$, и $X_2 < Y_2$. В качестве неограничивающего примера, диапазон весовых соотношений соединения формулы один и активного ингредиента может составлять от 3:1 до 1:3, включая конечные точки.

В другом варианте осуществления диапазон весовых соотношений может составлять от $X_1:Y_1$ до $X_2:Y_2$, где $X_1 > Y_1$, и $X_2 > Y_2$. В качестве неограничивающего примера, диапазон весовых соотношений соединения формулы один и активного ингредиента может составлять от 15:1 до 3:1, включая конечные точки.

В другом варианте осуществления диапазон весовых соотношений может составлять от $X_1:Y_1$ до $X_2:Y_2$, где $X_1 < Y_1$, и $X_2 < Y_2$. В качестве неограничивающего примера, диапазон весовых соотношений соединения формулы один и активного ингредиента может составлять от приблизительно 1:3 до приблизительно 1:20, включая конечные точки.

Составы.

Пестицид во множестве случаев не подходит для применения в его чистой форме. Обычно необходимо добавлять другие вещества, чтобы пестицид можно было применять в необходимой концентрации и в подходящей форме, обеспечивая удобство применения, эксплуатации, транспортировки, хранения и максимальную пестицидную активность. Таким образом, пестициды составляют, например, в приманки, концентрированные эмульсии, пылевидные препараты, эмульгируемые концентраты, препараты для окуливания, гели, гранулы, микрокапсулы, препараты для обработки семян, суспензионные концентраты, суспензии, таблетки, водорастворимые жидкости, диспергируемые в воде гранулы или сухие жидкотекучие вещества, смачиваемые порошки и крайне малообъемные растворы.

Чаще всего пестициды применяют в виде водных суспензий или эмульсий, полученных из концентрированных составов таких пестицидов. Такие водорастворимые, суспендируемые в воде или эмульгируемые составы являются либо твердыми веществами, обычно известными как смачиваемые порошки, диспергируемые в воде гранулы, либо жидкостями, обычно известными как эмульгируемые концентраты, либо водными суспензиями. Смачиваемые порошки, которые можно прессовать с получением диспергируемых в воде гранул, содержат тщательно перемешанную смесь пестицида, носителя и поверхностно-активных веществ. Концентрация пестицида обычно составляет от приблизительно 10% до приблизительно 90% по весу. Носитель обычно выбирают из видов аттапульгитовой глины, видов монтмориллонитовой глины, видов диатомовой земли или очищенных силикатов. Эффективные поверхностно-активные вещества, составляющие от приблизительно 0,5% до приблизительно 10% смачиваемого порошка, выбирают из сульфированных лигнинов, конденсированных нафталинсульфонатов, нафталинсульфонатов, алкилбензолсульфонатов, алкилсульфатов и неионогенных поверхностно-активных веществ, таких как аддукты этиленоксида и алкилфенолов.

Эмульгируемые концентраты пестицидов содержат целесообразную концентрацию пестицида, такую как от приблизительно 50 г/л до приблизительно 500 г/л жидкости, растворенных в носителе, который представляет собой либо смешиваемый с водой растворитель, либо смесь не смешиваемого с водой органического растворителя и эмульгаторов. Пригодные органические растворители включают ароматические соединения, в частности, ксилолы и нефтяные фракции, в частности, высококипящие нафталиновые и олефиновые фракции нефти, такие как тяжелый обогащенный ароматическими соединениями лигроин. Можно также применять другие органические растворители, такие как терпеновые растворители, в том числе производные канифоли, алифатические кетоны, такие как циклогексанон, и сложные спирты, такие как 2-этоксэтанол. Подходящие эмульгаторы для эмульгируемых концентратов выбирают из традиционных анионных и неионогенных поверхностно-активных веществ.

Водные суспензии предусматривают суспензии нерастворимых в воде пестицидов, диспергированных в водном носителе при концентрации в диапазоне от приблизительно 5% до приблизительно 50% по весу. Суспензии получают путем тонкого размолва пестицида и энергичного примешивания его в носитель, состоящий из воды и поверхностно-активных веществ. Ингредиенты, такие как неорганические соли и синтетические или природные камеди, также можно добавлять для повышения плотности и вязкости водного носителя. Часто более эффективно измельчать и смешивать пестицид, в то же время получая водную смесь и гомогенизируя ее в устройстве, таком как песчаная мельница, шаровая мельница или гомогенизатор поршневого типа. Пестицид в суспензии может быть микроинкапсулирован в пластичный полимер.

Масляные дисперсии (OD) предусматривают суспензии нерастворимых в органическом растворителе пестицидов, тонко диспергированных в смеси органического растворителя и эмульгаторов при концентрации в диапазоне от приблизительно 2% до приблизительно 50% по весу. Один или более пестици-

дов можно растворять в органическом растворителе. Пригодные органические растворители включают ароматические соединения, в частности, ксилолы и нефтяные фракции, в частности, высококипящие нафталиновые и олефиновые фракции нефти, такие как тяжелый обогащенный ароматическими соединениями лигроин. Другие растворители могут включать растительные масла, масла из семян и сложные эфиры растительных масел и масел из семян. Подходящие эмульгаторы для масляных дисперсий выбирают из традиционных анионных и неионогенных поверхностно-активных веществ. Загустители или гелеобразующие средства добавляют в состав масляных дисперсий для модификации реологических свойств или свойств текучести жидкости и для предотвращения разделения и осаждения диспергированных частиц или капель.

Пестициды можно также применять в виде гранулированных композиций, которые являются особенно пригодными для применений в отношении почвы. Гранулированные композиции обычно содержат от приблизительно 0,5% до приблизительно 10% пестицида по весу, диспергированного в носителе, который содержит глину или аналогичное вещество. Такие композиции обычно получают путем растворения пестицида в подходящем растворителе и нанесения его на гранулированный носитель, который был предварительно сформован в частицы соответствующего размера, в диапазоне от приблизительно 0,5 мм до приблизительно 3 мм. Такие композиции также можно составлять путем получения теста или пасты из носителя и молекулы, а затем дробления и высушивания с получением гранулированных частиц необходимого размера. Другая форма гранул представляет собой эмульгируемые в воде гранулы (EG). Это состав, состоящий из гранул, подлежащих применению в качестве традиционной эмульсии активного(ых) ингредиента(ов) по типу "масло в воде", либо растворенного(ых), либо разведенного(ых) в органическом растворителе, после разрушения и растворения в воде. Эмульгируемые в воде гранулы содержат один или несколько активных ингредиентов, или растворенных, или разведенных в подходящем органическом растворителе, которые абсорбируются водорастворимой полимерной оболочкой или некоторым другим типом растворимой или нерастворимой матрицы.

Пылевидные препараты, содержащие пестицид, получают посредством тщательного смешивания пестицида в порошкообразной форме с подходящим пылевидным используемым в сельском хозяйстве носителем, таким как каолиновая глина, измельченный вулканит и т.п. Пылевидные препараты могут подходящим образом содержать от приблизительно 1% до приблизительно 10% пестицида. Пылевидные препараты можно применять в качестве средства для протравливания семян или в качестве средства для внекорневого внесения с помощью опылителя.

Также на практике применяют пестицид в форме раствора в подходящем органическом растворителе, обычно минеральном масле, таком как инсектицидные масла, которые широко применяют в агрохимии.

Пестициды также можно применять в форме аэрозольной композиции. В таких композициях пестицид растворяют или диспергируют в носителе, который является смесью газов-вытеснителей. Аэрозольную композицию упаковывают в контейнер, из которого смесь распределяется через распылительный клапан.

Пестицидные приманки образуют при смешивании пестицида с пищей или аттрактантом или с обоями из них. Когда вредители съедают приманку, они при этом поглощают пестицид. Приманкам можно придавать форму гранул, гелей, жидкотекучих порошков, жидкостей или твердых веществ. Приманки можно применять в местах скопления вредителей.

Препараты для окуливания представляют собой пестициды, которые имеют относительно высокое давление паров и, таким образом, могут существовать в виде газа в концентрациях, достаточных для уничтожения вредителей в почве или замкнутых пространствах. Токсичность препарата для окуливания пропорциональна его концентрации и времени воздействия. Они характеризуются надлежащей способностью к диффузии и действуют путем проникновения в дыхательную систему вредителя или при абсорбции через кутикулу вредителя. Препараты для окуливания применяют для контроля вредителей в хранящихся продуктах под газонепроницаемыми листьями, в герметичных комнатах или зданиях или в специальных камерах.

Пестициды могут быть микроинкапсулированы путем суспендирования частиц или капель пестицида в пластичных полимерах различных типов. Путем изменения химических свойств полимера или изменения факторов при обработке можно получать микрокапсулы различных размеров, растворимости, толщины стенки и степеней проницаемости. Эти факторы определяют скорость, с которой активный ингредиент в них высвобождается, что, в свою очередь, влияет на остаточные характеристики, скорость действия и запах продукта. Микрокапсулы можно составлять в виде суспензионных концентратов или диспергируемых в воде гранул.

Концентраты, представляющие собой масляные растворы, получают путем растворения пестицида в растворителе, который будет удерживать пестицид в растворе. Масляные растворы пестицида обычно обеспечивают более быстрое снижение численности и смерть вредителей, чем другие составы, из-за того, что сами растворители имеют пестицидное действие, и растворение воскообразной оболочки покрова повышает скорость поглощения пестицида. Другие преимущества масляных растворов включают лучшую стабильность при хранении, лучшее проникание в бороздки и лучшую адгезию к жирным поверхностям.

Другой вариант осуществления представляет собой эмульсию типа "масло в воде", где эмульсия содержит масляные шарики, каждый из которых имеет пластинчатое жидкокристаллическое покрытие и диспергирован в водной фазе, где каждый масляный шарик содержит по меньшей мере одну молекулу, которая является активной с точки зрения сельского хозяйства, и отдельно покрыт монопластинчатым или олигопластинчатым слоем, содержащим

- (1) по меньшей мере одно неионогенное липофильное поверхностно-активное средство;
- (2) по меньшей мере одно неионогенное гидрофильное поверхностно-активное средство; и
- (3) по меньшей мере одно ионогенное поверхностно-активное средство, где шарики имеют средний диаметр частиц, составляющий менее 800 нм.

Другие компоненты составов.

В общем, если соединения, раскрытые в формуле один, применяют в составе, такой состав также может содержать другие компоненты. Эти компоненты включают без ограничения (это неполный и не взаимоисключающий список) увлажнители, средства, способствующие распределению, клейкие вещества, смачивающие вещества, буферы, связывающие средства, средства, снижающие унос, средства, обуславливающие совместимость, пеногасители, очищающие средства и эмульгаторы. Несколько компонентов описано далее.

Увлажняющее средство представляет собой вещество, которое при добавлении в жидкость повышает распределение или проникающую способность жидкости путем снижения межфазного натяжения между жидкостью и поверхностью, по которой она распределяется. Увлажняющие средства применяют из-за двух основных функций в агрохимических составах: при обработке и изготовлении для повышения скорости смачиваемости порошков в воде с получением концентратов для растворимых жидкостей или суспензионных концентратов; и при смешивании продукта с водой в распылителе для снижения времени смачивания смачиваемых порошков и для улучшения проникания воды в диспергируемые в воде гранулы. Примерами увлажняющих средств, применяемых в составах смачиваемого порошка, суспензионного концентрата и диспергируемых в воде гранул, являются лаурилсульфат натрия; диоктилсульфосукцинат натрия; алкилфенолэтоксилаты и этоксилаты алифатических спиртов.

Диспергирующее средство представляет собой вещество, которое абсорбируется на поверхности частиц, помогает сохранять состояние дисперсии частиц и предотвращает их повторную агрегацию. Диспергирующие средства добавляют в агрохимические составы для облегчения диспергирования и суспендирования при изготовлении и для обеспечения повторного диспергирования частиц в воде в распылителе. Они широко применяются в смачиваемых порошках, суспензионных концентратах и диспергируемых в воде гранулах. Поверхностно-активные вещества, которые применяют в качестве диспергирующих средств, обладают способностью сильно абсорбироваться на поверхности частицы и обеспечивать заряженный или стерический барьер для перегруппировки частиц. Наиболее часто применяемыми поверхностно-активными веществами являются анионные, неионогенные или смеси двух типов. Для составов смачиваемого порошка наиболее распространенными диспергирующими средствами являются лигносульфонаты натрия. Для суспензионных концентратов очень высокую адсорбцию и стабилизацию получают с применением полиэлектролитов, таких как конденсаты формальдегида сульфоната нафталина натрия. Также применяют тристирилфенол-этоксилат-фосфатные сложные эфиры. Неионогенные вещества, такие как конденсаты алкиларилэтиленоксида и блок-сополимеры ЕО-РО, иногда объединяют с анионными веществами в качестве диспергирующих средств для суспензионных концентратов. В последние годы новые типы очень высокомолекулярных полимерных поверхностно-активных веществ были разработаны в качестве диспергирующих средств. Они имеют очень длинные гидрофобные "скелеты" и большое число этиленоксидных цепочек, образующих "зубья" "гребня" поверхностно-активного вещества. Эти высокомолекулярные полимеры могут придавать крайне надлежащую длительную стабильность суспензионным концентратам из-за того, что гидрофобные скелеты имеют много точек крепления на поверхностях частиц. Примерами диспергирующих средств, применяемых в агрохимических составах, являются лигносульфонаты натрия; конденсаты формальдегида сульфоната нафталина натрия; тристирилфенол-этоксилат-фосфатные сложные эфиры; этоксилаты алифатических спиртов; алкилэтоксилаты; блок-сополимеры ЕО-РО и привитые сополимеры.

Эмульгирующее средство представляет собой вещество, которое стабилизирует суспензию капель одной жидкой фазы в другой жидкой фазе. Без эмульгирующего средства две жидкости будут разделяться на две несмешиваемые жидкие фазы. Наиболее часто применяемые смеси эмульгаторов содержат алкилфенол или алифатический спирт с двенадцатью или более этиленоксидными звеньями и растворимую в масле кальциевую соль додецилбензолсульфоновой кислоты. Диапазон значений гидрофильно-липофильного баланса ("HLB") от приблизительно 8 до приблизительно 18 будет, как правило, обеспечивать надлежащие стабильные эмульсии. Стабильность эмульсии можно иногда улучшать путем добавления небольшого количества поверхностно-активного вещества на основе блок-сополимера ЕО-РО.

Солюбилизующее средство представляет собой поверхностно-активное вещество, которое будет образовывать мицеллы в воде при значениях концентрации выше критической концентрации мицеллообразования. Мицеллы затем способны растворять или солюбилизировать нерастворимые в воде материалы внутри гидрофобной части мицеллы. Типы поверхностно-активных веществ, обычно применяе-

мых для солубилизации, представляют собой неионогенные вещества, сорбитанмоноолеаты, этоксилаты сорбитанмоноолеата и сложные эфиры метилолеата.

Поверхностно-активные вещества иногда применяют либо отдельно, либо с другими добавками, такими как минеральные или растительные масла, в качестве вспомогательных веществ для смесей распылителей для улучшения биологических характеристик пестицида в отношении мишени. Типы поверхностно-активных веществ, применяемых для повышения биоактивности, зависят в целом от природы и механизма действия пестицида. Однако они часто представляют собой неионогенные вещества, такие как алкилэтоксилаты, этоксилаты линейных алифатических спиртов и этоксилаты алифатических аминов.

Носитель или разбавитель в сельскохозяйственном составе представляет собой материал, добавляемый в пестицид для придания продукту требуемой эффективности. Носители обычно представляют собой материалы с высокой абсорбирующей способностью, тогда как разбавители обычно представляют собой материалы с низкой абсорбирующей способностью. Носители и разбавители применяют в составах пылевидных препаратов, смачиваемых порошков, гранул и диспергируемых в воде гранул.

Органические растворители применяют, главным образом, в составах эмульгируемых концентратов, эмульсий типа "масло в воде", суспензий, масляных дисперсий и составах в сверхнизком объеме и, в меньшей степени, в гранулированных составах. Иногда применяют смеси растворителей. Первыми основными группами растворителей являются алифатические парафиновые масла, такие как керосин или очищенные парафины. Вторая основная группа (и наиболее распространенная) содержит ароматические растворители, такие как ксилол и высокомолекулярные фракции C9 и C10 ароматических растворителей. Хлорированные углеводороды являются пригодными в качестве соразтворителей для предотвращения кристаллизации пестицидов, когда состав эмульгируют в воде. Спирты иногда применяют в качестве соразтворителей для повышения силы растворителя. Другие растворители могут включать растительные масла, масла из семян и сложные эфиры растительных масел и масел из семян.

Загустители или гелеобразующие вещества применяют, главным образом, в составе суспензионных концентратов, масляных дисперсий, эмульсий и суспензий для модификации реологических свойств или свойств текучести жидкости и для предотвращения разделения и осаждения диспергированных частиц или капель. Загущающие, гелеобразующие и противоосаждающие средства обычно распределяют на две категории, а именно нерастворимые в воде частицы и растворимые в воде полимеры. Можно получать составы суспензионного концентрата и масляной дисперсии с применением глин и форм диоксида кремния. Примеры этих типов материалов включают без ограничения монтмориллонит, бентонит, алюмосиликат магния и аттапульгит. Растворимые в воде полисахариды в водных суспензионных концентратах применяли в качестве загущающе-гелеобразующих средств в течение многих лет. Типы полисахаридов, наиболее часто применяемых, представляют собой натуральные экстракты семян и морских водорослей или синтетические производные целлюлозы. Примеры таких типов материалов включают без ограничения гуаровую камедь; камедь бобов рожкового дерева; каррагенан; альгинаты; метилцеллюлозу; карбоксиметилцеллюлозу натрия (SCMC) и гидроксипропилцеллюлозу (HEC). Другие типы противоосаждающих средств основаны на видах модифицированного крахмала, полиакрилатах, поливиниловом спирте и полиэтиленоксиде. Другим подходящим противоосаждающим средством является ксантановая камедь.

Микроорганизмы могут вызывать порчу составленных продуктов. Ввиду этого, для устранения или снижения степени их воздействия применяют консерванты. Примеры таких средств включают без ограничения пропионовую кислоту и ее натриевую соль, сорбиновую кислоту и ее натриевую и калиевую соли, бензойную кислоту и ее натриевую соль, натриевую соль п-гидроксибензойной кислоты, метил-п-гидроксибензоат и 1,2-бензотиазолин-3-он (BIT).

Присутствие поверхностно-активных веществ часто вызывает вспенивание составов на водной основе при операциях смешивания при получении и нанесении посредством распылителя. Для снижения склонности к образованию пены часто добавляют пеногасители либо на стадии получения, либо перед заливкой в бутылки. Как правило, есть два типа пеногасителей, а именно силиконовые и несиликоновые. Силиконовые обычно представляют собой водные эмульсии диметилполисилоксана, тогда как несиликоновые пеногасители представляют собой нерастворимые в воде масла, такие как октанол и нонанол, или диоксид кремния. В обоих случаях функция пеногасителя состоит в вытеснении поверхностно-активного средства с поверхности раздела фаз воздух-вода.

"Экологичные" средства (например, вспомогательные вещества, поверхностно-активные вещества, растворители) могут снижать общую степень воздействия на окружающую среду составов для защиты сельскохозяйственных культур. Экологичные средства являются биоразлагаемыми и, как правило, получены из природных и/или экологичных источников, например, источников, относящихся к растениям и животным. Конкретными примерами являются растительные масла, масла из семян и их сложные эфиры, также алкоксилированные алкилполиглюкозиды.

Области применения.

Соединения формулы один можно применять в отношении любого места обитания. Конкретные места обитания для использования таких молекул включают места обитания, где растут люцерна, виды миндаля, виды яблони, ячмень, виды фасоли, канола, кукуруза, хлопчатник, виды крестоцветных, разно-

видности цветов, виды кормовых растений (райграс многолетний пастбищный, суданская трава, высокая овсяница, мятлик луговой и клевер), виды плодовых деревьев, салат-латук, виды овса, масличные культуры, виды апельсина, виды арахиса, виды груши, виды перца, виды картофеля, рис, сорго, виды сои, виды земляники, сахарный тростник, виды сахарной свеклы, виды подсолнечника, табак, виды томата, пшеница (например, твердая краснозерная озимая пшеница, мягкая краснозерная озимая пшеница, белозерная озимая пшеница, твердая краснозерная яровая пшеница и яровая пшеница-дурум) и другие ценные сельскохозяйственные культуры, или где будут посажены их семена.

Соединения формулы один также можно использовать там, где выращиваются растения, такие как сельскохозяйственные культуры, и где имеют место низкие уровни (или даже нет фактического присутствия) вредителей, которые могут приносить ущерб таким растениям в коммерческих масштабах. Использование таких соединений в таком месте обитания приносит пользу растениям, которые будут расти в этом месте обитания. Такие преимущества могут включать без ограничения способствовать росту лучшей корневой системы растения; способствовать тому, что растение лучше выдерживает тяжелые условия роста; улучшение здорового состояния растения; повышение урожая растения (например, увеличенную биомассу и/или повышенное содержание ценных ингредиентов); повышение жизненной силы растения (например, улучшенный рост растений и/или более зеленые листья); повышение качества растений (например, повышенное содержание или улучшенный состав определенных ингредиентов) и повышение стойкости растения в отношении абиотического и/или биотического стресса.

Соединения формулы один можно использовать с сульфатом аммония при выращивании различных растений, поскольку это может обеспечивать дополнительные преимущества.

Соединения формулы один можно использовать на растениях, в отношении растений или вокруг растений, генетически модифицированных для экспрессии специальных признаков, таких как белки *Bacillus thuringiensis* (например, Cry1Ab, Cry1Ac, Cry1Fa, Cry1A.105, Cry2Ab, Vip3A, mCry3A, Cry3Ab, Cry3Bb, Cry34Ab1/Cry35Ab1), других инсектицидных токсинов, или таких, которые экспрессируют стойкость в отношении гербицидов, или таких, которые имеют "пакетированные" привнесенные гены, экспрессирующие инсектицидные токсины, стойкость в отношении гербицидов, повышение питательности или любые другие полезные признаки.

Соединения формулы один можно использовать в отношении лиственной и/или плодородной частей растений для контроля вредителей. Либо такие молекулы будут вступать в непосредственный контакт с вредителем, либо вредитель будет поглощать такие молекулы при поедании растения или при втягивании сока или других питательных веществ из растения.

Соединения формулы один можно также применять в отношении почвы, и в случае применения таким образом можно контролировать питающихся корнями и стеблями вредителей. Корни могут поглощать такие молекулы, при этом перенося их в лиственные части растения для контроля наземных жуков и питающихся соком вредителей.

Системное перемещение пестицидов в растениях можно использовать для контроля вредителей на одной части растения путем применения (например, путем опрыскивания места обитания) соединения формулы один в отношении другой части растения. Например, контроль питающихся листьями насекомых можно обеспечивать путем капельного орошения или внесения в борозду, путем обработки почвы, например, путем полива почвы перед высаживанием или после высаживания, или путем обработки семян растения перед высаживанием.

Соединения формулы один можно применять с приманками. Обычно, в случае приманок, приманки помещают в землю, где, например, термиты могут контактировать с приманкой и/или привлекаться ею. Приманки также можно использовать на поверхности здания (горизонтальной, вертикальной или наклонной поверхности), где, например, муравьи, термиты, тараканы и мухи могут контактировать с приманкой и/или привлекаться ею.

Соединения формулы один могут быть инкапсулированы внутри капсулы или помещены на ее поверхность. Размер капсул может быть в диапазоне от нанометров (диаметр приблизительно 100-900 нм) до микрометров (диаметр приблизительно 10-900 микрон).

Соединения формулы один можно использовать в отношении яиц вредителей. Из-за уникальной способности яиц некоторых вредителей выдерживать некоторые пестициды может потребоваться повторное применение таких соединений для борьбы с вновь появляющимися личинками.

Соединения формулы один можно использовать в качестве препаратов для обработки семян. Обработку семян можно использовать в отношении всех типов семян, в том числе тех, из которых будут прорасти генетически модифицированные растения с экспрессией специальных признаков. Иллюстративные примеры включают такие, которые экспрессируют белки, токсичные в отношении беспозвоночных вредителей, например, белки *Bacillus thuringiensis*, или другие инсектицидные токсины, такие, которые экспрессируют стойкость в отношении гербицидов, как, например, семена "Roundup Ready", или такие, которые имеют "пакетированные" привнесенные гены, экспрессирующие инсектицидные токсины, стойкость в отношении гербицидов, повышение питательности, засухоустойчивость или любые другие полезные признаки. Кроме того, такие обработки семян молекулами формулы один могут дополнительно повышать способность растения лучше выдерживать тяжелые условия роста. Это обеспечивает получение

ние более здорового, более жизнеспособного растения, что может приводить к большей урожайности во время сбора урожая. В общем, как предполагается, от приблизительно 1 г таких соединений до приблизительно 500 г на 100000 семян обеспечивает надлежащие преимущества, как предполагается, количества от приблизительно 10 г до приблизительно 100 г на 100000 семян обеспечивают лучшие преимущества, и, как предполагается, количества от приблизительно 25 г до приблизительно 75 г на 100000 семян обеспечивают еще лучшие преимущества.

Соединения формулы один можно применять с одним или несколькими активными ингредиентами в почвоулучшителе.

Соединения формулы один можно применять для борьбы с эндопаразитами и эктопаразитами в секторе ветеринарии или в области содержания животных, отличных от человека. Такие соединения можно применять путем перорального введения, например, в форме таблеток, капсул, напитков, гранул, путем применения в отношении кожи, например, в форме погружения, распыления, выливания, нанесения и присыпания порошком, и путем парентерального введения, например, в форме инъекции.

Соединения формулы один также можно использовать преимущественно в животноводстве, например, для крупного рогатого скота, цыплят, гусей, коз, свиней, овец и индюков. Их также можно использовать преимущественно для домашних животных, таких как лошади, собаки и кошки. Конкретными вредителями, контроль которых обеспечивают, будут мухи, блохи и клещи, которые докучают таким животным. Подходящие составы вводят перорально животным с питьевой водой или кормом. Дозы и составы, которые подходят, зависят от видов.

Соединения формулы один также можно применять для борьбы с паразитическими червями, в частности кишечными, у животных, перечисленных выше.

Соединения формулы один также можно использовать в терапевтических способах для медицинского ухода за людьми. Такие способы включают без ограничения пероральное введение, например, в форме таблеток, капсул, напитков, гранул, и нанесение на кожу.

Соединения формулы один также можно применять в отношении инвазивных вредителей. Вредители по всему миру мигрировали на новые места (для такого вредителя) и затем становились новыми инвазивными видами в таком новом месте. Такие соединения также можно применять на таких новых инвазивных видах для их контроля в таком новом месте.

Заголовки в данном документе предназначены лишь для удобства и не должны использоваться для толкования какой-либо их части.

Раздел с таблицами

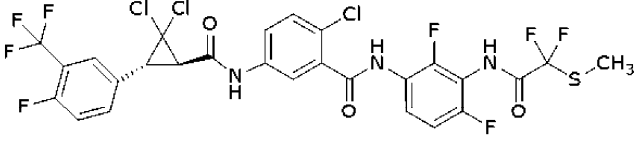
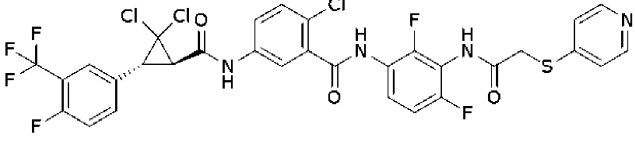
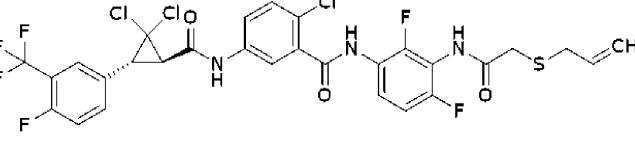
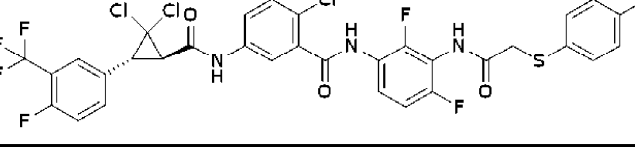
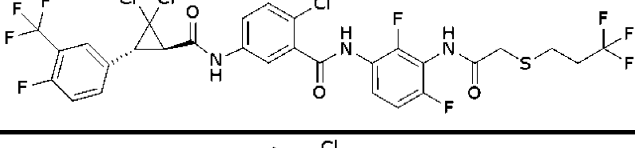
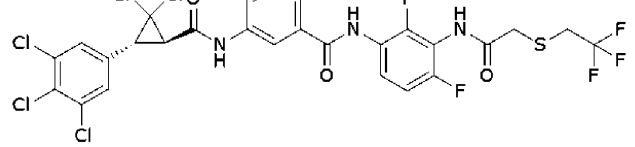
Таблица В

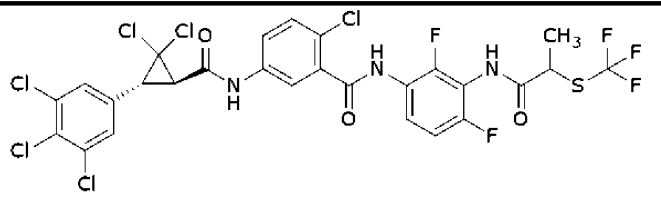
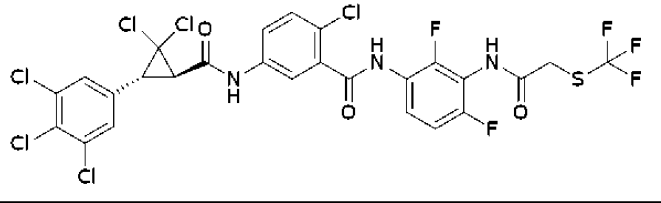
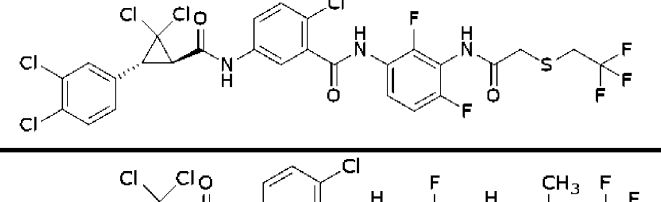
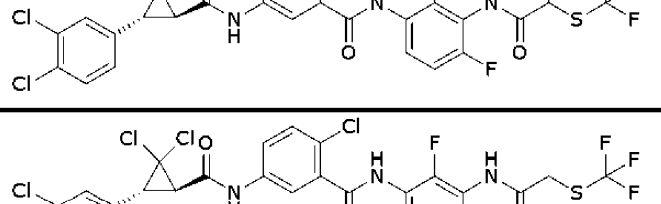
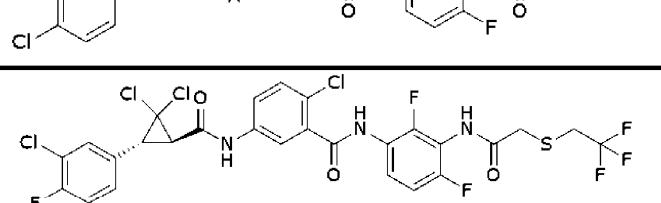
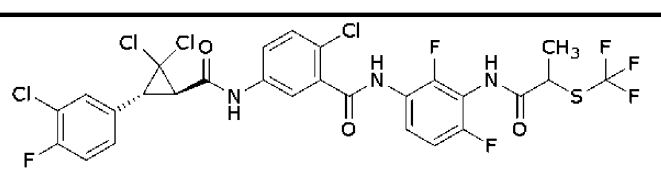

Весовые соотношения	
Соединение формулы один : активный ингредиент	
100:1 до 1:100	
50:1 до 1:50	
20:1 до 1:20	
10:1 до 1:10	
5:1 до 1:5	
3:1 до 1:3	
2:1 до 1:2	
1:1	

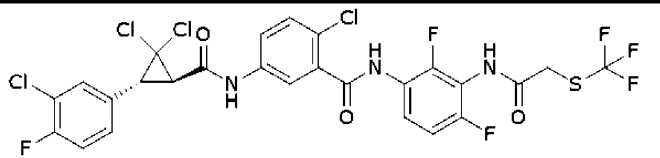
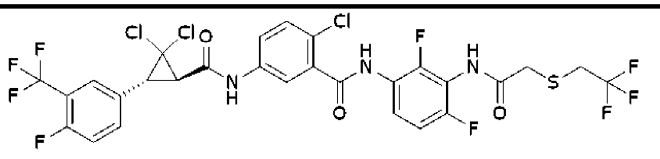
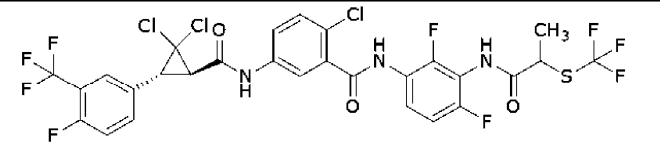
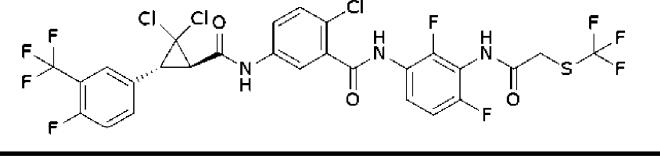
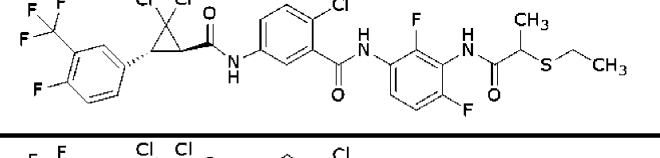
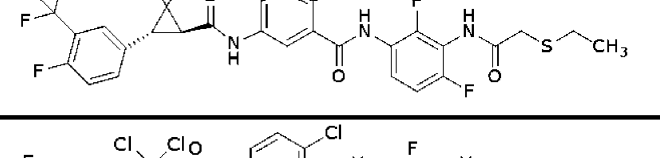
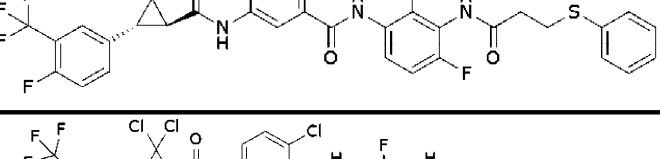
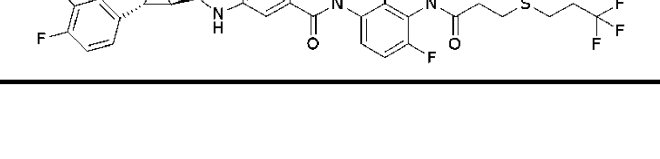
Таблица С

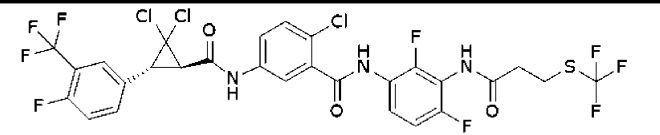
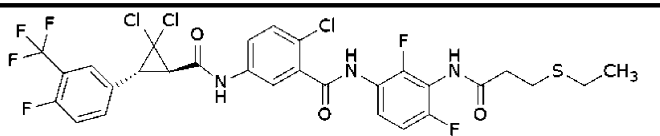
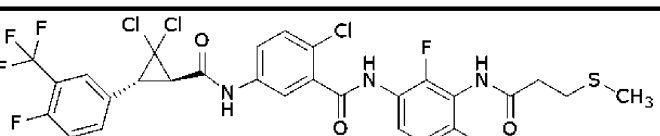
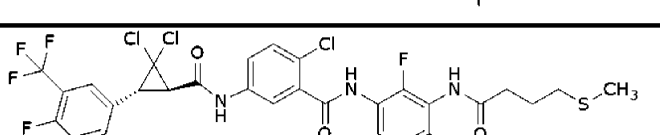
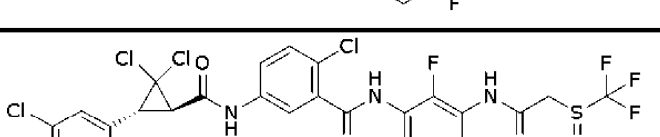
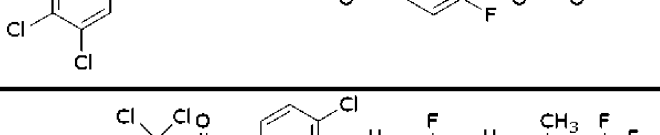
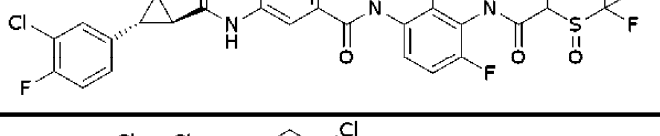
активный ингредиент (Y), весовые части	100	X, Y		X, Y			X, Y			
	50	X, Y	X, Y	X, Y			X, Y	X, Y		
	20	X, Y		X, Y	X, Y		X, Y		X, Y	
	15	X, Y	X, Y					X, Y	X, Y	X, Y
	10	X, Y		X, Y						
	5	X, Y	X, Y	X, Y				X, Y		
	3	X, Y	X, Y		X, Y	X, Y		X, Y	X, Y	X, Y
	2	X, Y		X, Y	X, Y		X, Y		X, Y	
	1	X, Y	X, Y	X, Y	X, Y	X, Y	X, Y	X, Y	X, Y	X, Y
		1	2	3	5	10	15	20	50	100
	молекула формулы один (X), весовые части									

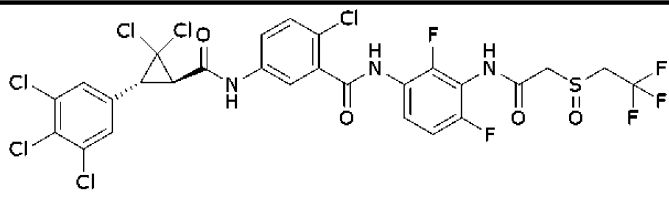
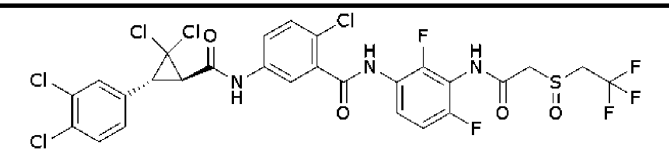
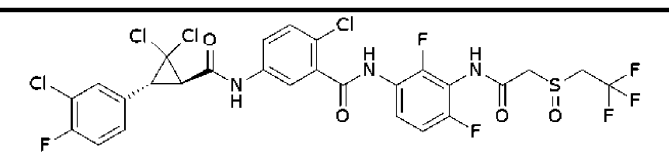
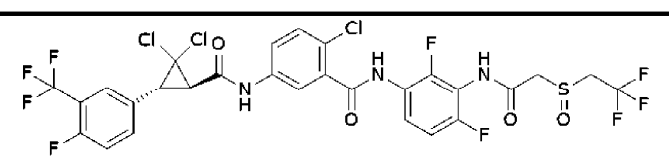
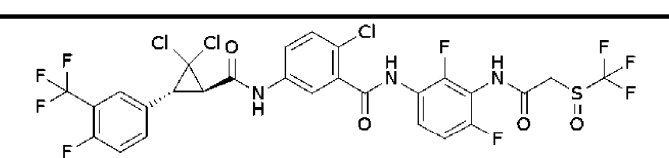
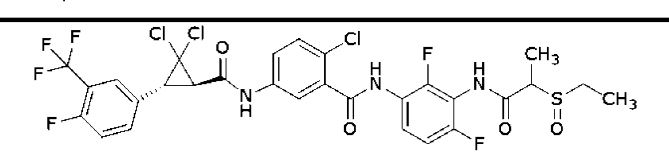
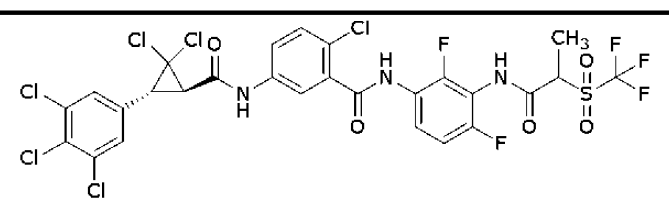
Структура и способ получения соединений ряда F

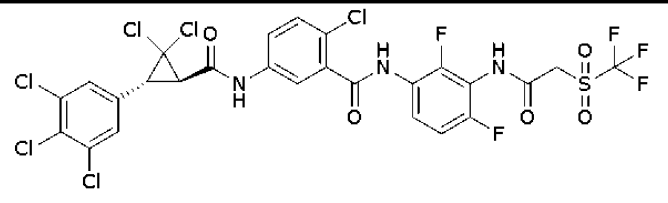
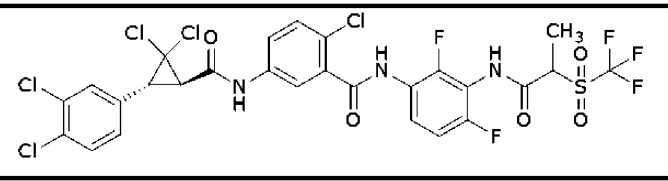
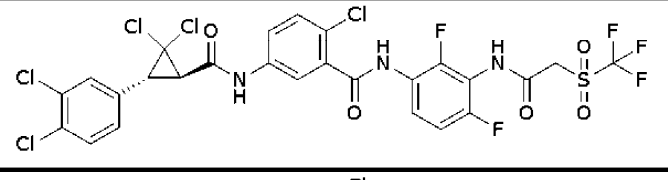
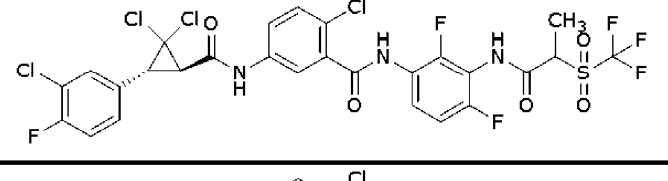
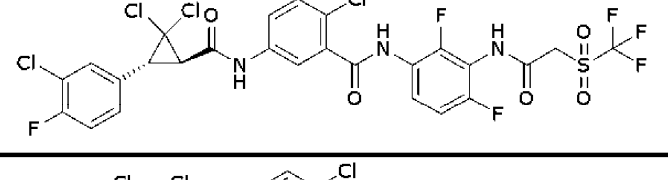
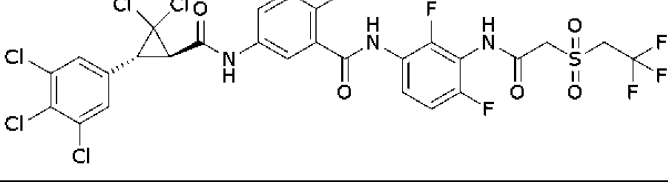
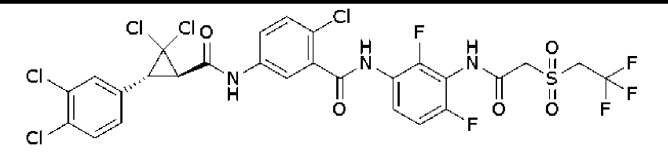
№	Структура	Получ.*
F1		15
F2		15
F3		15
F4		15
F5		15
F6		15

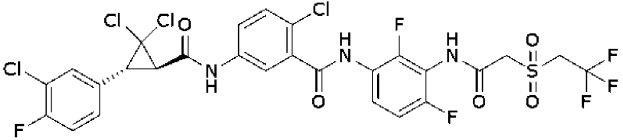
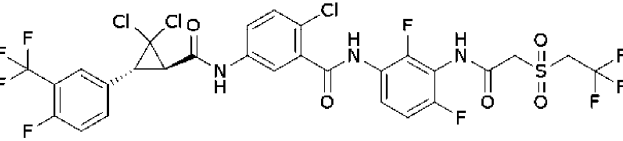
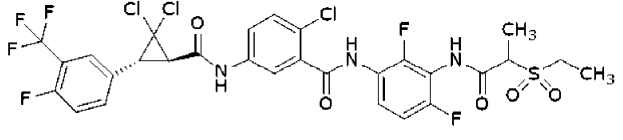
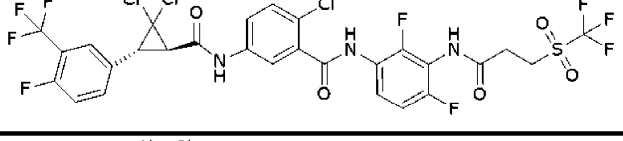
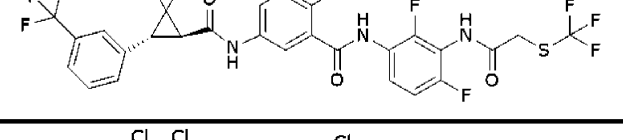
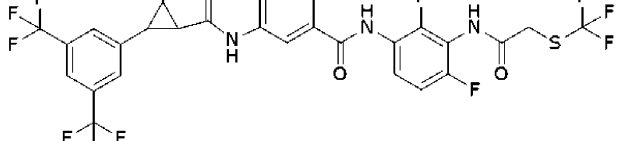
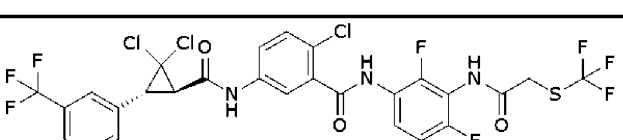
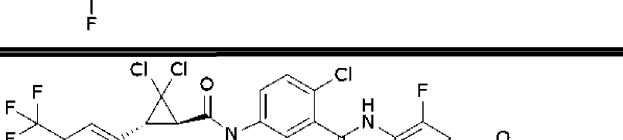
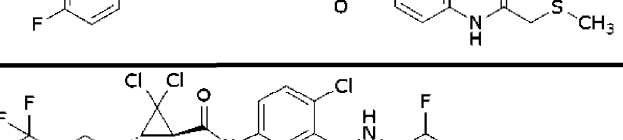
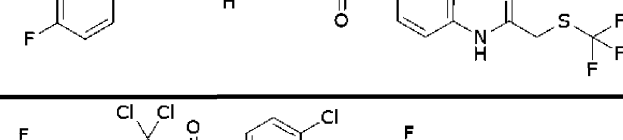
F7		15
F8		15
F9		15
F10		15
F11		15
F12		15
F13		15

F14		15
F15		15
F16		15
F17		15
F18		15
F19		15
F20		15
F21		15

F22		15
F23		15
F24		15
F25		15
F26		16
F27		19
F28		19

F29		16
F30		16
F31		19
F32		17
F33		17
F34		18
F35		16

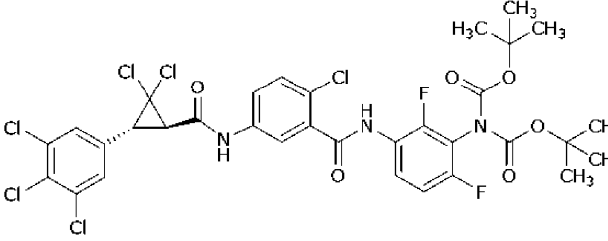
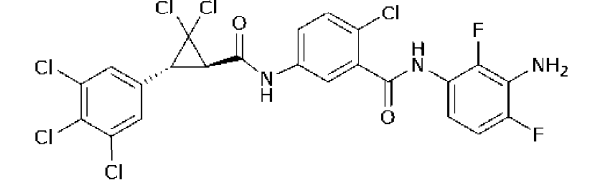
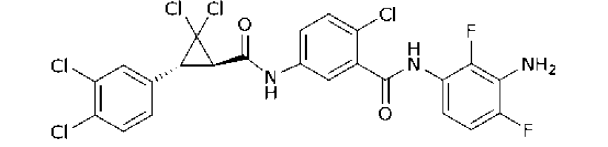
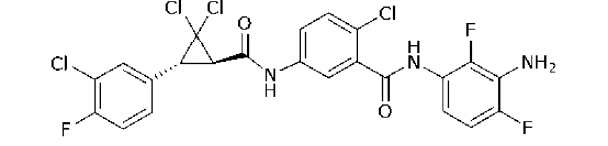
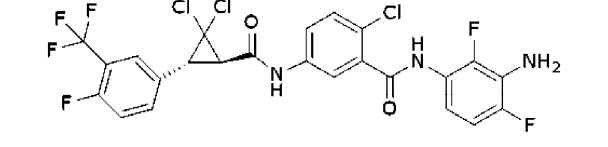
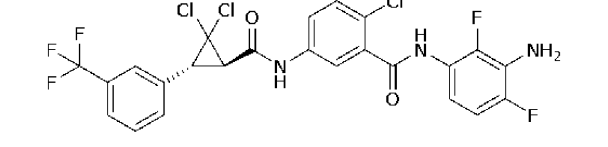
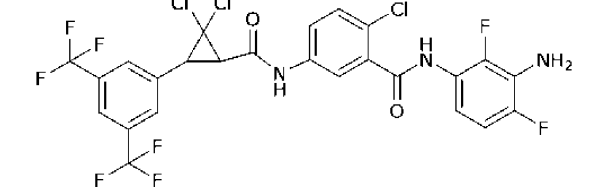
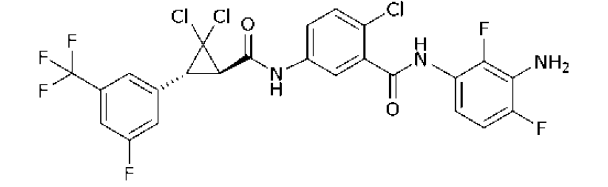
F36		16
F37		16
F38		16
F39		19
F40		19
F41		16
F42		16

F43		19
F44		17
F45		19
F46		15
F47		15
F48		15
F49		15
F50		15
F51		15
F52		15

*получено в соответствии с примером номер

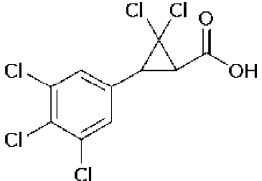
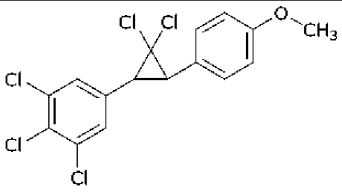
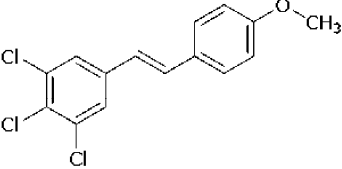
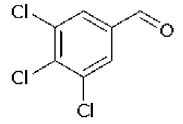
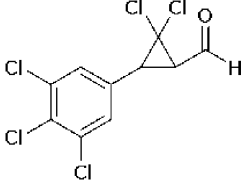
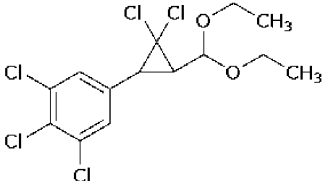
* Получено в соответствии с примером №.

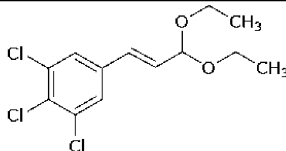
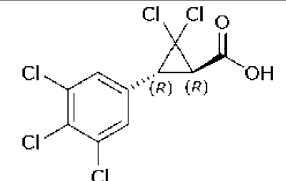
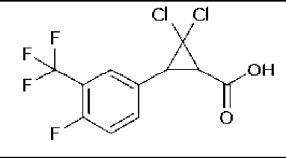
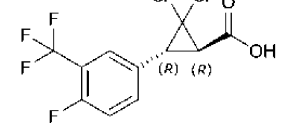
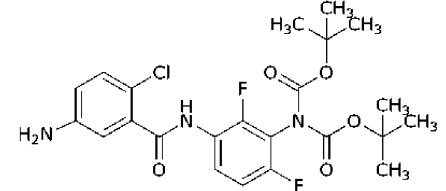
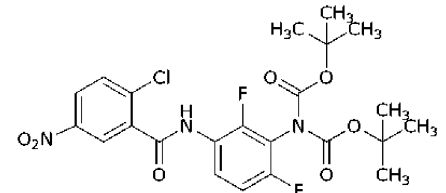
Структура и способ получения соединений ряда DP

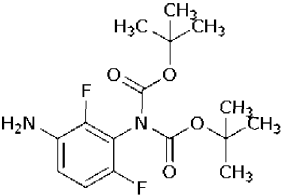
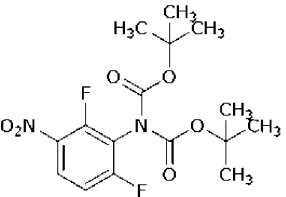
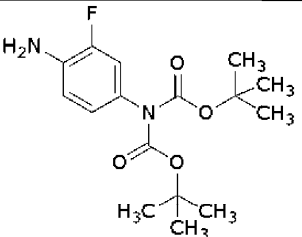
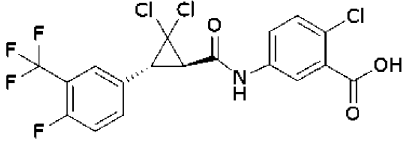
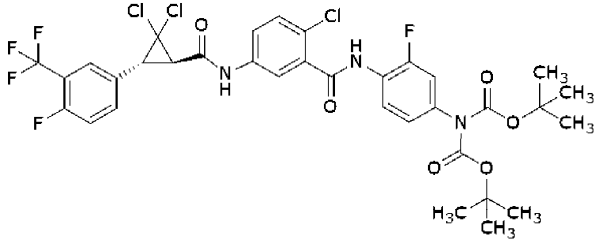
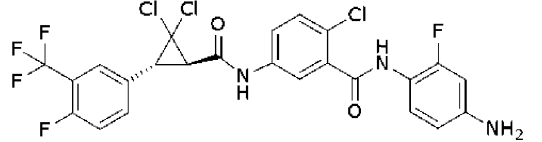
№	Структура	Получ.*
DP1		13
DP2		14
DP3		14
DP4		14
DP5		14
DP6		14
DP7		14
DP8		14

* Получено в соответствии с примером №.

Структура и способ получения соединений ряда С

№	Структура	Получ.*
C1		1, 2
C2		3
C3		4
C4		5
C5		6
C6		7

C7		8
C8		R1
C9		1
C10		R4
C11		9
C12		10

C13		11
C14		12
C15		20
C16		21
C17		22
C18		23

* Получено в соответствии с примером №.

Аналитические данные для соединений в табл. 1

Соед. №	т. пл. (°С)	Масс-спектрометрия	ЯМР (¹ H, ¹³ C, ¹⁹ F)
F1		ESIMS масса/заряд 721 [M+H] ⁺	¹ H ЯМР (400 МГц, Ацетон- <i>d</i> ₆) δ 10,18 (s, 1H), 9,80 (s, 1H), 9,55 (s, 1H), 8,19 (td, <i>J</i> =8,8, 5,7 Гц, 1H), 8,03 (d, <i>J</i> =2,7 Гц, 1H), 7,87-7,78 (m, 3H), 7,53-7,43 (m, 2H), 7,27-7,16 (m, 1H), 3,72 (d, <i>J</i> =8,3 Гц, 1H), 3,43 (d, <i>J</i> =8,3 Гц, 1H), 2,43 (d, <i>J</i> =8,5 Гц, 3H); ¹⁹ F ЯМР (376 МГц, Ацетон- <i>d</i> ₆) δ -61,88, -85,97, -117,60, -122,79, -123,33, -128,29, -128,67
F2		HRMS-ESI (масса/заряд) [M+] ⁺ рассч. значение для C ₃₁ H ₁₉ Cl ₃ F ₆ N ₄ O ₃ S, 746,0148; наблюдаемое значение 746,0156	¹ H ЯМР (400 МГц, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 10,96 (s, 1H), 10,45 (s, 1H), 10,23 (s, 1H), 8,44-8,36 (m, 2H), 7,92 (d, <i>J</i> =2,6 Гц, 1H), 7,85 (ddd, <i>J</i> =18,1, 8,1, 3,6 Гц, 2H), 7,75 (dd, <i>J</i> =8,8, 2,6 Гц, 1H), 7,69-7,54 (m, 3H), 7,37-7,31 (m, 2H), 7,21 (t, <i>J</i> =9,2 Гц, 1H), 4,10 (s, 2H), 3,70 (d, <i>J</i> =8,4 Гц, 1H), 3,51 (d, <i>J</i> =8,5 Гц, 1H); ¹⁹ F ЯМР (376 МГц, DMSO- <i>d</i> ₆) δ -59,91 (d, <i>J</i> =12,5 Гц), -116,93 (q, <i>J</i> =12,5 Гц), -120,61 (d, <i>J</i> =3,3 Гц), -124,45 (d, <i>J</i> =3,3 Гц)
F3	125-130	HRMS-ESI (масса/заряд) [M+] ⁺ рассч. значение для C ₂₉ H ₂₀ Cl ₃ F ₆ N ₃ O ₃ S, 709,0195; наблюдаемое значение 709,0188	¹ H ЯМР (400 МГц, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 10,97 (s, 1H), 10,45 (s, 1H), 9,92 (s, 1H), 7,93 (d, <i>J</i> =2,6 Гц, 1H), 7,89-7,81 (m, 2H), 7,76 (dd, <i>J</i> =8,8, 2,6 Гц, 1H), 7,69-7,54 (m, 3H), 7,20 (td, <i>J</i> =9,2, 1,8 Гц, 1H), 5,82 (ddt, <i>J</i> =17,1, 10,1, 7,2 Гц, 1H), 5,22-5,07 (m, 2H), 3,70 (d, <i>J</i> =8,4 Гц, 1H), 3,51 (d, <i>J</i> =8,4 Гц, 1H), 3,33 (s, 2H; метилен, перекрытый остаточной водой пик) 3,28 (d, <i>J</i> =7,2 Гц, 2H); ¹⁹ F ЯМР (376 МГц, DMSO- <i>d</i> ₆) δ -59,91 (d, <i>J</i> =12,4 Гц), -116,93 (q, <i>J</i> =12,4 Гц), -120,55 (d, <i>J</i> =3,6 Гц), -124,52 (d, <i>J</i> =3,5 Гц)

F4	106-110	HRMS-ESI <i>(масса/заряд)</i> $[M]^+$ расщ. значение для $C_{32}H_{19}Cl_3F_7N_3O_3$ S, 763,0101; наблюдаемое значение 763,0094	1H ЯМР (400 МГц, DMSO- d_6) δ 10,96 (s, 1H), 10,44 (s, 1H), 10,04 (s, 1H), 7,93 (d, $J=2,6$ Гц, 1H), 7,89-7,80 (m, 2H), 7,75 (dd, $J=8,8, 2,6$ Гц, 1H), 7,68-7,54 (m, 3H), 7,53-7,46 (m, 2H), 7,25-7,15 (m, 3H), 3,88 (s, 2H), 3,69 (d, $J=8,4$ Гц, 1H), 3,51 (d, $J=8,5$ Гц, 1H); ^{19}F ЯМР (376 МГц, DMSO- d_6) δ -59,91 (d, $J=12,5$ Гц), -115,71, -116,93 (q, $J=12,4$ Гц), -120,42 (d, $J=3,3$ Гц), -124,38 (d, $J=3,4$ Гц)
F5		ESIMS <i>масса/заряд</i> 767 $([M+H]^+)$	1H ЯМР (300 МГц, Ацетон- d_6) δ 10,19 (s, 1H), 9,52 (s, 1H), 9,14 (s, 1H), 8,19-7,99 (m, 2H), 7,89-7,76 (m, 3H), 7,55-7,42 (m, 2H), 7,14 (td, $J=9,3, 2,0$ Гц, 1H), 3,72 (dd, $J=8,3, 0,9$ Гц, 1H), 3,55 (s, 2H), 3,43 (d, $J=8,3$ Гц, 1H), 2,99-2,87 (m, 2H), 2,75-2,52 (m, 2H)
F6	109-115	HRMS-ESI <i>(масса/заряд)</i> $[M]^+$ расщ. значение для $C_{27}H_{16}Cl_6F_5N_3O_3$ S, 766,8964; наблюдаемое значение 766,8962	1H ЯМР (400 МГц, DMSO- d_6) δ 10,94 (s, 1H), 10,46 (s, 1H), 10,08 (s, 1H), 7,92 (d, $J=2,5$ Гц, 1H), 7,80 (s, 2H), 7,75 (dd, $J=8,8, 2,6$ Гц, 1H), 7,65 (td, $J=8,7, 5,7$ Гц, 1H), 7,56 (d, $J=8,7$ Гц, 1H), 7,22 (td, $J=9,2, 1,8$ Гц, 1H), 3,69-3,52 (m, 6H) ^{19}F ЯМР (376 МГц, DMSO- d_6) δ -64,94, -120,58 (d, $J=3,3$ Гц), -124,52 (d, $J=3,4$ Гц)
F7	167-172	HRMS-ESI <i>(масса/заряд)</i> $[M]^+$ расщ. значение для $C_{27}H_{16}Cl_6F_5N_3O_3$ S, 766,8964; наблюдаемое значение 766,8966	1H ЯМР (400 МГц, DMSO- d_6) δ 10,95 (s, 1H), 10,48 (s, 1H), 10,31 (s, 1H), 7,92 (d, $J=2,6$ Гц, 1H), 7,80 (s, 2H), 7,76 (dd, $J=8,8, 2,6$ Гц, 1H), 7,67 (td, $J=8,7, 5,7$ Гц, 1H), 7,56 (d, $J=8,8$ Гц, 1H), 7,23 (td, $J=9,3, 1,7$ Гц, 1H), 4,38 (q, $J=7,1$ Гц, 1H), 3,64 (d, $J=8,5$ Гц, 1H), 3,56 (d, $J=8,5$ Гц, 1H), 1,61 (d, $J=7,1$ Гц, 3H); ^{19}F ЯМР (376 МГц, DMSO- d_6) δ -39,11, -121,02, -124,68

F8	155-160	HRMS-ESI (масса/заряд) [M] ⁺ расщ. значение для C ₂₆ H ₁₄ Cl ₆ F ₅ N ₃ O ₃ S, 752,8807; наблюдаемое значение 752,8805	¹ H ЯМР (400 МГц, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 10,93 (s, 1H), 10,47 (s, 1H), 10,24 (s, 1H), 7,92 (d, <i>J</i> =2,6 Гц, 1H), 7,80 (s, 2H), 7,75 (dd, <i>J</i> =8,8, 2,6 Гц, 1H), 7,67 (td, <i>J</i> =8,7, 5,7 Гц, 1H), 7,56 (d, <i>J</i> =8,7 Гц, 1H), 7,22 (t, <i>J</i> =9,4, 1,5 Гц, 1H), 4,07 (s, 2H), 3,64 (d, <i>J</i> =8,4 Гц, 1H), 3,55 (d, <i>J</i> =8,5 Гц, 1H); ¹⁹ F ЯМР (376 МГц, DMSO- <i>d</i> ₆) δ -40,97, -120,67, -124,46
F9	101-107	HRMS-ESI (масса/заряд) [M] ⁺ расщ. значение для C ₂₇ H ₁₇ Cl ₅ F ₅ N ₃ O ₃ S, 732,9353; наблюдаемое значение 732,9340	¹ H ЯМР (400 МГц, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 10,96 (s, 1H), 10,46 (s, 1H), 10,08 (s, 1H), 7,92 (d, <i>J</i> =2,6 Гц, 1H), 7,80-7,72 (m, 2H), 7,72-7,60 (m, 2H), 7,56 (d, <i>J</i> =8,8 Гц, 1H), 7,43 (dd, <i>J</i> =8,5, 2,1 Гц, 1H), 7,21 (td, <i>J</i> =9,3, 1,7 Гц, 1H), 3,69-3,54 (m, 5H), 3,47 (d, <i>J</i> =8,5 Гц, 1H); ¹⁹ F ЯМР (376 МГц, DMSO- <i>d</i> ₆) δ -64,94, -120,58 (d, <i>J</i> =3,3 Гц), -124,52 (d, <i>J</i> =3,4 Гц)
F10	219-222	HRMS-ESI (масса/заряд) [M] ⁺ расщ. значение для C ₂₇ H ₁₇ Cl ₅ F ₅ N ₃ O ₃ S, 732,9353; наблюдаемое значение 732,9344	¹ H ЯМР (400 МГц, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 10,95 (s, 1H), 10,47 (s, 1H), 10,31 (s, 1H), 7,92 (d, <i>J</i> =2,6 Гц, 1H), 7,75 (dt, <i>J</i> =6,1, 2,8 Гц, 2H), 7,72-7,63 (m, 2H), 7,56 (d, <i>J</i> =8,7 Гц, 1H), 7,43 (dd, <i>J</i> =8,5, 2,1 Гц, 1H), 7,23 (ddd, <i>J</i> =10,6, 9,2, 1,6 Гц, 1H), 4,38 (q, <i>J</i> =7,1 Гц, 1H), 3,61 (d, <i>J</i> =8,4 Гц, 1H), 3,46 (d, <i>J</i> =8,5 Гц, 1H), 1,61 (d, <i>J</i> =7,1 Гц, 3H); ¹⁹ F ЯМР (376 МГц, DMSO- <i>d</i> ₆) δ -39,11, -121,02, -124,68
F11	213-216	HRMS-ESI (масса/заряд) [M] ⁺ расщ. значение для C ₂₆ H ₁₅ Cl ₅ F ₅ N ₃ O ₃ S, 718,9197; наблюдаемое	¹ H ЯМР (400 МГц, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 10,95 (s, 1H), 10,47 (s, 1H), 10,23 (s, 1H), 7,92 (d, <i>J</i> =2,6 Гц, 1H), 7,79-7,72 (m, 2H), 7,71-7,63 (m, 2H), 7,56 (d, <i>J</i> =8,8 Гц, 1H), 7,43 (dd, <i>J</i> =8,5, 2,1 Гц, 1H), 7,22 (t, <i>J</i> =9,2, 1,7 Гц, 1H), 4,07 (s, 2H), 3,61 (d, <i>J</i> =8,4 Гц, 1H), 3,46 (d, <i>J</i> =8,5 Гц, 1H); ¹⁹ F ЯМР (376 МГц, DMSO- <i>d</i> ₆) δ -40,97, -120,67, -124,47

		значение 718,9187	
F12	103-107	HRMS-ESI (масса/заряд) [M] ⁺ расщ. значение для C ₂₇ H ₁₇ Cl ₄ F ₆ N ₃ O ₃ S, 716,9649; наблюдаемое значение 716,9641	¹ H ЯМР (400 МГц, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 10,95 (s, 1H), 10,46 (s, 1H), 10,08 (s, 1H), 7,92 (d, <i>J</i> =2,5 Гц, 1H), 7,79-7,69 (m, 2H), 7,65 (td, <i>J</i> =8,6, 5,6 Гц, 1H), 7,56 (d, <i>J</i> =8,7 Гц, 1H), 7,51-7,43 (m, 2H), 7,21 (td, <i>J</i> =9,2, 1,7 Гц, 1H), 3,71-3,54 (m, 5H), 3,44 (d, <i>J</i> =8,5 Гц, 1H); ¹⁹ F ЯМР (376 МГц, DMSO- <i>d</i> ₆) δ -64,94, -117,28, -120,58 (d, <i>J</i> =3,2 Гц), -124,52 (d, <i>J</i> =3,4 Гц)
F13	226-229	HRMS-ESI (масса/заряд) [M] ⁺ расщ. значение для C ₂₇ H ₁₇ Cl ₄ F ₆ N ₃ O ₃ S, 716,9649; наблюдаемое значение 716,9645	¹ H ЯМР (400 МГц, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 10,95 (s, 1H), 10,48 (s, 1H), 10,31 (s, 1H), 7,93 (d, <i>J</i> =2,6 Гц, 1H), 7,76 (dd, <i>J</i> =8,8, 2,6 Гц, 1H), 7,73-7,63 (m, 2H), 7,56 (d, <i>J</i> =8,8 Гц, 1H), 7,51-7,41 (m, 2H), 7,23 (td, <i>J</i> =9,2, 1,7 Гц, 1H), 4,38 (q, <i>J</i> =7,1 Гц, 1H), 3,59 (d, <i>J</i> =8,4 Гц, 1H), 3,44 (d, <i>J</i> =8,5 Гц, 1H), 1,62 (d, <i>J</i> =7,1 Гц, 3H); ¹⁹ F ЯМР (376 МГц, DMSO- <i>d</i> ₆) δ -39,12, -117,28, -121,02, -124,67
F14	219-222	HRMS-ESI (масса/заряд) [M] ⁺ расщ. значение для C ₂₆ H ₁₅ Cl ₄ F ₆ N ₃ O ₃ S, 702,9492; наблюдаемое значение 702,9482	¹ H ЯМР (400 МГц, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 10,96 (s, 1H), 10,47 (s, 1H), 10,24 (s, 1H), 7,92 (d, <i>J</i> =2,6 Гц, 1H), 7,76 (dd, <i>J</i> =8,8, 2,6 Гц, 1H), 7,71 (dd, <i>J</i> =7,2, 2,0 Гц, 1H), 7,65 (dd, <i>J</i> =8,7, 5,7 Гц, 1H), 7,56 (d, <i>J</i> =8,7 Гц, 1H), 7,51-7,42 (m, 2H), 7,22 (td, <i>J</i> =9,3, 1,8 Гц, 1H), 4,07 (s, 2H), 3,59 (d, <i>J</i> =8,4 Гц, 1H), 3,44 (d, <i>J</i> =8,5 Гц, 1H); ¹⁹ F ЯМР (376 МГц, DMSO- <i>d</i> ₆) δ -40,97, -117,29, -120,68, -124,47
F15	100-105	HRMS-ESI (масса/заряд) [M] ⁺ расщ.	¹ H ЯМР (400 МГц, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 10,97 (s, 1H), 10,47 (s, 1H), 10,09 (s, 1H), 7,93 (d, <i>J</i> =2,6 Гц, 1H), 7,90-7,81 (m, 2H), 7,76 (dd, <i>J</i> =8,8, 2,6 Гц, 1H), 7,70-7,54 (m, 3H), 7,22

		значение для $C_{28}H_{17}Cl_3F_9N_3O_3$ S, 750,9912; наблюдаемое значение 750,9912	(t, $J=9,2$ Гц, 1H), 3,70 (d, $J=8,5$ Гц, 1H), 3,67-3,57 (m, 4H), 3,52 (d, $J=8,5$ Гц, 1H); ^{19}F ЯМР (376 МГц, DMSO- d_6) δ -59,92 (d, $J=12,6$ Гц), -64,95, -116,94 (q, $J=12,5$ Гц), -120,58 (d, $J=3,3$ Гц), -124,52 (d, $J=3,3$ Гц)
F16	210-213	HRMS-ESI (масса/заряд) [M] ⁺ рассч. значение для $C_{28}H_{17}Cl_3F_9N_3O_3$ S, 750,9912; наблюдаемое значение 750,9912	1H ЯМР (400 МГц, DMSO- d_6) δ 10,97 (s, 1H), 10,48 (s, 1H), 10,32 (s, 1H), 7,94 (d, $J=2,6$ Гц, 1H), 7,91-7,80 (m, 2H), 7,76 (dd, $J=8,8, 2,6$ Гц, 1H), 7,67 (q, $J=8,3$ Гц, 1H), 7,64-7,53 (m, 2H), 7,24 (t, $J=9,1$ Гц, 1H), 4,38 (q, $J=7,1$ Гц, 1H), 3,70 (d, $J=8,4$ Гц, 1H), 3,52 (d, $J=8,5$ Гц, 1H), 1,62 (d, $J=7,1$ Гц, 3H); ^{19}F ЯМР (376 МГц, DMSO- d_6) δ -39,12, -59,92 (d, $J=12,4$ Гц), -116,94 (q, $J=12,6$ Гц), -121,02, -124,67
F17	227-230	HRMS-ESI (масса/заряд) [M] ⁺ рассч. значение для $C_{27}H_{15}Cl_3F_9N_3O_3$ S, 736,9756; наблюдаемое значение 736,9753	1H ЯМР (400 МГц, DMSO- d_6) δ 10,96 (s, 1H), 10,47 (s, 1H), 10,23 (s, 1H), 7,93 (d, $J=2,6$ Гц, 1H), 7,90-7,79 (m, 2H), 7,76 (dd, $J=8,8, 2,6$ Гц, 1H), 7,71-7,63 (m, 1H), 7,63-7,52 (m, 2H), 7,22 (dd, $J=9,9, 8,2$ Гц, 1H), 4,07 (s, 2H), 3,69 (d, $J=8,4$ Гц, 1H), 3,51 (d, $J=8,5$ Гц, 1H); ^{19}F ЯМР (376 МГц, DMSO- d_6) δ -40,98, -59,92 (d, $J=12,7$ Гц), -116,94 (q, $J=12,6$ Гц), -120,68 (d, $J=2,9$ Гц), -124,46
F18		ESIMS масса/заряд 713 ([M+H] ⁺)	1H ЯМР (400 МГц, Ацетон- d_6) δ 10,23 (s, 1H), 9,49 (s, 1H), 9,02 (s, 1H), 8,12-7,99 (m, 2H), 7,81 (td, $J=8,4, 7,7, 2,7$ Гц, 3H), 7,52-7,42 (m, 2H), 7,11 (td, $J=9,2, 1,9$ Гц, 1H), 3,79-3,68 (m, 2H), 3,43 (d, $J=8,3$ Гц, 1H), 2,70 (qd, $J=7,4, 3,2$ Гц, 2H), 1,50 (d, $J=7,1$ Гц, 3H), 1,25 (t, $J=7,4$ Гц, 3H); ^{19}F ЯМР (376 МГц, Ацетон- d_6) δ -61,83, -117,55, -123,08, -128,65

F19		ESIMS масса/заряд 699 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (400 МГц, Ацетон- <i>d</i> ₆) δ 10,21 (s, 1H), 9,51 (s, 1H), 9,10 (s, 1H), 8,12-7,98 (m, 2H), 7,81 (ddd, <i>J</i> =11,4, 7,6, 2,4 Гц, 3H), 7,54-7,42 (m, 2H), 7,11 (td, <i>J</i> =9,2, 1,9 Гц, 1H), 3,71 (d, <i>J</i> =8,3 Гц, 1H), 3,49-3,39 (m, 3H), 2,68 (dq, <i>J</i> =20,5, 7,4 Гц, 2H), 1,31-1,21 (m, 3H); ¹⁹ F ЯМР (376 МГц, Ацетон- <i>d</i> ₆) δ -61,80, -117,46, -122,91, -128,49
F20	157-162	HRMS-ESI (масса/заряд) [M] ⁺ расщ. значение для C ₃₃ H ₂₂ Cl ₃ F ₆ N ₃ O ₃ S, 759,0352; наблюдаемое значение 759,0345	¹ H ЯМР (400 МГц, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 10,97 (s, 1H), 10,44 (s, 1H), 9,86 (s, 1H), 7,93 (d, <i>J</i> =2,6 Гц, 1H), 7,91-7,80 (m, 2H), 7,76 (dd, <i>J</i> =8,8, 2,6 Гц, 1H), 7,68-7,53 (m, 3H), 7,43-7,31 (m, 4H), 7,26-7,16 (m, 2H), 3,69 (d, <i>J</i> =8,4 Гц, 1H), 3,51 (d, <i>J</i> =8,5 Гц, 1H), 3,23 (t, <i>J</i> =7,1 Гц, 2H), 2,71 (t, <i>J</i> =7,1 Гц, 2H); ¹⁹ F ЯМР (376 МГц, DMSO- <i>d</i> ₆) δ -59,91 (d, <i>J</i> =12,5 Гц), -116,93 (q, <i>J</i> =12,5 Гц), -120,23 (d, <i>J</i> =3,4 Гц), -124,13 (d, <i>J</i> =3,9 Гц)
F21		ESIMS масса/заряд 781 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (400 МГц, Ацетон- <i>d</i> ₆) δ 10,19 (s, 1H), 9,47 (s, 1H), 8,98 (s, 1H), 8,13-7,99 (m, 2H), 7,87-7,77 (m, 3H), 7,48 (dt, <i>J</i> =9,8, 5,2 Гц, 2H), 7,11 (td, <i>J</i> =9,2, 2,0 Гц, 1H), 3,71 (d, <i>J</i> =8,3 Гц, 1H), 3,42 (d, <i>J</i> =8,3 Гц, 1H), 2,99-2,88 (m, 2H), 2,87-2,75 (m, 4H), 2,64-2,47 (m, 2H); ¹⁹ F ЯМР (376 МГц, Ацетон- <i>d</i> ₆) δ -61,86, -66,83, -117,56, -122,94, -128,40
F22		ESIMS масса/заряд 753 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (300 МГц, Ацетон- <i>d</i> ₆) δ 10,19 (s, 1H), 9,50 (s, 1H), 9,10 (s, 1H), 8,15-7,99 (m, 2H), 7,89-7,76 (m, 3H), 7,55-7,41 (m, 2H), 7,13 (td, <i>J</i> =9,3, 2,0 Гц, 1H), 3,72 (dd, <i>J</i> =8,3, 0,9 Гц, 1H), 3,43 (d, <i>J</i> =8,3 Гц, 1H), 3,30 (t, <i>J</i> =6,7 Гц, 2H), 3,02 (t, <i>J</i> =6,8 Гц, 2H)
F23		ESIMS масса/заряд 713 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (400 МГц, Ацетон- <i>d</i> ₆) δ 10,19 (s, 1H), 9,47 (s, 1H), 8,94 (s, 1H), 8,12-7,99 (m, 2H), 7,87-7,77 (m, 3H), 7,53-7,43 (m, 2H), 7,16-7,06 (m, 1H), 3,71 (d, <i>J</i> =8,3 Гц, 1H), 3,43 (d, <i>J</i> =8,3 Гц, 1H), 2,95-2,83 (m, 3H), 2,78 (d, <i>J</i> =7,1 Гц, 1H), 2,59 (q, <i>J</i> =7,4 Гц, 2H), 1,23 (t, <i>J</i> =7,4 Гц,

			3H); ¹⁹ F ЯМР (376 МГц, Ацетон- <i>d</i> ₆) δ -61,86, -117,57, -123,00, -128,42
F24		ESIMS масса/заряд 699 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (400 МГц, Ацетон- <i>d</i> ₆) δ 10,20 (s, 1H), 9,47 (s, 1H), 8,96 (s, 1H), 8,12-7,99 (m, 2H), 7,87-7,77 (m, 3H), 7,48 (dt, <i>J</i> =8,1, 5,1 Гц, 2H), 7,11 (td, <i>J</i> =9,3, 1,9 Гц, 1H), 3,71 (d, <i>J</i> =8,3 Гц, 1H), 3,43 (d, <i>J</i> =8,3 Гц, 1H), 2,82 (dt, <i>J</i> =12,1, 6,0 Гц, 4H), 2,12 (s, 3H); ¹⁹ F ЯМР (376 МГц, Ацетон- <i>d</i> ₆) δ -61,85, -117,60, -122,97, -128,39
F25		ESIMS масса/заряд 713 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (400 МГц, Ацетон- <i>d</i> ₆) δ 10,22 (s, 1H), 9,48 (s, 1H), 8,89 (s, 1H), 8,11-7,99 (m, 2H), 7,87-7,77 (m, 3H), 7,48 (dd, <i>J</i> =9,0, 5,9 Гц, 2H), 7,11 (td, <i>J</i> =9,2, 1,9 Гц, 1H), 3,71 (d, <i>J</i> =8,3 Гц, 1H), 3,43 (d, <i>J</i> =8,3 Гц, 1H), 2,59 (q, <i>J</i> =7,3, 6,9 Гц, 4H), 2,07 (s, 3H), 1,97 (q, <i>J</i> =7,2 Гц, 2H); ¹⁹ F ЯМР (376 МГц, Ацетон- <i>d</i> ₆) δ -61,86, -117,62, -123,22, -128,70
F26	156-163	HRMS-ESI (масса/заряд) [M] ⁺ рассч. значение для C ₂₆ H ₁₄ Cl ₆ F ₅ N ₃ O ₄ S, 768,8756; наблюдаемое значение 768,8745	¹ H ЯМР (500 МГц, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 10,93 (s, 1H), 10,51 (s, 1H), 10,49 (s, 1H), 7,92 (d, <i>J</i> =2,6 Гц, 1H), 7,80 (d, <i>J</i> =0,6 Гц, 2H), 7,75 (dd, <i>J</i> =8,7, 2,6 Гц, 1H), 7,69 (td, <i>J</i> =8,6, 5,6 Гц, 1H), 7,56 (d, <i>J</i> =8,7 Гц, 1H), 7,29-7,22 (m, 1H), 4,61 (d, <i>J</i> =14,5 Гц, 1H), 4,44 (d, <i>J</i> =14,5 Гц, 1H), 3,64 (d, <i>J</i> =8,5 Гц, 1H), 3,55 (d, <i>J</i> =8,5 Гц, 1H); ¹⁹ F ЯМР (471 МГц, DMSO- <i>d</i> ₆) δ -72,07, -120,22 - -120,39 (m), -123,85 (d, <i>J</i> =8,3 Гц)
F27	157-163	HRMS-ESI (масса/заряд) [M] ⁺ рассч. значение для C ₂₇ H ₁₇ Cl ₄ F ₆ N ₃ O ₄	¹ H ЯМР (500 МГц, DMSO- <i>d</i> ₆) Смесь диастереомеров δ 10,94 (s, 1H), 10,54-10,50 (m, 1H), 10,49-10,44 (m, 1H), 7,92 (d, <i>J</i> =2,5 Гц, 1H), 7,75 (dd, <i>J</i> =8,8, 2,5 Гц, 1H), 7,73-7,63 (m, 2H), 7,56 (d, <i>J</i> =8,8 Гц, 1H), 7,50-7,43 (m, 2H), 7,25 (t, <i>J</i> =9,0 Гц, 1H), 4,47 (q, <i>J</i> =7,1 Гц, 1H), 3,59

		S, 732,9598; наблюдаемое значение 732,9599	(d, $J=8,5$ Гц, 1H), 3,44 (d, $J=8,4$ Гц, 1H), 1,62 (d, $J=7,1$ Гц, 2H), 1,57-1,52 (m, 1H); ^{19}F ЯМР (471 МГц, DMSO- d_6) Смесь диастереомеров δ -67,79, -70,02, -117,28 (q, $J=7,2$, 6,7 Гц), -120,15 - -120,97 (m), -123,76 - -124,51 (m)
F28	135-140	HRMS-ESI (масса/заряд) [M] $^{+}$ расщ. значение для $\text{C}_{26}\text{H}_{15}\text{Cl}_4\text{F}_6\text{N}_3\text{O}_4$ S, 718,9442; наблюдаемое значение 718,9446	^1H ЯМР (500 МГц, DMSO- d_6) δ 10,95 (s, 1H), 10,51 (s, 1H), 10,49 (s, 1H), 7,93 (d, $J=2,6$ Гц, 1H), 7,75 (dd, $J=8,7$, 2,6 Гц, 1H), 7,70 (dt, $J=9,0$, 4,4 Гц, 2H), 7,56 (d, $J=8,8$ Гц, 1H), 7,50-7,43 (m, 2H), 7,29-7,22 (m, 1H), 4,61 (d, $J=14,5$ Гц, 1H), 4,44 (d, $J=14,5$ Гц, 1H), 3,59 (d, $J=8,4$ Гц, 1H), 3,44 (d, $J=8,5$ Гц, 1H); ^{19}F ЯМР (471 МГц, DMSO- d_6) δ -72,08, -117,28 (td, $J=8,1$, 5,4 Гц), -120,28 - -120,35 (m), -123,85 (d, $J=8,3$ Гц)
F29	122-128	HRMS-ESI (масса/заряд) [M] $^{+}$ расщ. значение для $\text{C}_{27}\text{H}_{16}\text{Cl}_6\text{F}_5\text{N}_3\text{O}_4$ S, 782,8913; наблюдаемое значение 782,8910	^1H ЯМР (400 МГц, DMSO- d_6) δ 10,93 (s, 1H), 10,48 (s, 1H), 10,38 (s, 1H), 7,92 (d, $J=2,5$ Гц, 1H), 7,80 (s, 2H), 7,75 (dd, $J=8,8$, 2,6 Гц, 1H), 7,72-7,62 (m, 1H), 7,56 (d, $J=8,7$ Гц, 1H), 7,29-7,18 (m, 1H), 4,25 (d, $J=14,0$ Гц, 1H), 4,20-4,06 (m, 3H), 3,64 (d, $J=8,5$ Гц, 1H), 3,55 (d, $J=8,5$ Гц, 1H); ^{19}F ЯМР (376 МГц, DMSO- d_6) δ -59,59, -120,20, -123,86
F30	131-137	HRMS-ESI (масса/заряд) [M] $^{+}$ расщ. значение для $\text{C}_{27}\text{H}_{17}\text{Cl}_5\text{F}_5\text{N}_3\text{O}_4$ S, 748,9303; наблюдаемое значение 748,9305	^1H ЯМР (400 МГц, DMSO- d_6) δ 10,96 (s, 1H), 10,48 (s, 1H), 10,44-10,29 (m, 1H), 7,92 (d, $J=2,5$ Гц, 1H), 7,81-7,72 (m, 2H), 7,72-7,64 (m, 2H), 7,56 (d, $J=8,7$ Гц, 1H), 7,43 (dd, $J=8,4$, 2,1 Гц, 1H), 7,29-7,19 (m, 1H), 4,25 (d, $J=14,0$ Гц, 1H), 4,20-4,06 (m, 3H), 3,61 (d, $J=8,5$ Гц, 1H), 3,46 (d, $J=8,5$ Гц, 1H); ^{19}F ЯМР (376 МГц, DMSO- d_6) δ -59,59, -120,19, -123,87

F31	137-142	HRMS-ESI <i>(масса/заряд)</i> $[M+H]^+$ расч. значение для $C_{27}H_{17}Cl_4F_6N_3O_4$ S, 732,9598; наблюдаемое значение 732,9611	1H ЯМР (400 МГц, DMSO- d_6) δ 10,95 (s, 1H), 10,48 (s, 1H), 10,38 (s, 1H), 7,92 (d, $J=2,5$ Гц, 1H), 7,80-7,63 (m, 3H), 7,56 (d, $J=8,8$ Гц, 1H), 7,46 (dd, $J=8,0, 4,2$ Гц, 2H), 7,24 (t, $J=9,0$ Гц, 1H), 4,25 (d, $J=14,1$ Гц, 1H), 4,20-4,06 (m, 3H), 3,59 (d, $J=8,4$ Гц, 1H), 3,44 (d, $J=8,5$ Гц, 1H); ^{19}F ЯМР (376 МГц, DMSO- d_6) δ -59,59, -117,29, -120,19 (d, $J=2,7$ Гц), -123,84
F32	136-142	HRMS-ESI <i>(масса/заряд)</i> $[M+H]^+$ расч. значение для $C_{28}H_{17}Cl_3F_9N_3O_4$ S, 766,9862; наблюдаемое значение 766,9867	1H ЯМР (400 МГц, DMSO- d_6) δ 10,96 (s, 1H), 10,48 (s, 1H), 10,38 (s, 1H), 7,93 (d, $J=2,6$ Гц, 1H), 7,90-7,79 (m, 2H), 7,76 (dd, $J=8,8, 2,6$ Гц, 1H), 7,68 (td, $J=8,6, 5,6$ Гц, 1H), 7,63-7,53 (m, 2H), 7,24 (td, $J=9,2, 1,7$ Гц, 1H), 4,26 (d, $J=14,0$ Гц, 1H), 4,21-4,03 (m, 3H), 3,70 (d, $J=8,4$ Гц, 1H), 3,51 (d, $J=8,5$ Гц, 1H); ^{19}F ЯМР (376 МГц, DMSO- d_6) δ -59,59, -59,92 (d, $J=12,7$ Гц), -116,95 (q, $J=12,5$ Гц), -120,19 (d, $J=2,8$ Гц), -123,84 (d, $J=3,2$ Гц)
F33	122-126	HRMS-ESI <i>(масса/заряд)</i> $[M+H]^+$ расч. значение для $C_{27}H_{15}Cl_3F_9N_3O_4$ S, 752,9705; наблюдаемое значение 752,9702	1H ЯМР (400 МГц, DMSO- d_6) δ 10,96 (s, 1H), 10,51 (s, 1H), 10,49 (s, 1H), 7,93 (d, $J=2,6$ Гц, 1H), 7,90-7,80 (m, 2H), 7,76 (dd, $J=8,7, 2,6$ Гц, 1H), 7,73-7,65 (m, 1H), 7,58 (dd, $J=16,4, 9,2$ Гц, 2H), 7,25 (t, $J=9,2$ Гц, 1H), 4,61 (d, $J=14,6$ Гц, 1H), 4,44 (d, $J=14,4$ Гц, 1H), 3,69 (d, $J=8,4$ Гц, 1H), 3,51 (d, $J=8,5$ Гц, 1H); ^{19}F ЯМР (376 МГц, DMSO- d_6) δ -59,91 (d, $J=12,4$ Гц), -72,08, -116,95 (q, $J=12,6$ Гц), -120,32, -123,86
F34		ESIMS <i>масса/заряд</i> 729 $([M+H]^+)$	1H ЯМР (400 МГц, Ацетон- d_6) δ 10,21 (s, 1H), 9,51 (s, 1H), 9,32-9,09 (m, 1H), 8,23-7,96 (m, 2H), 7,82 (td, $J=6,0, 3,3$ Гц, 3H), 7,47 (dt, $J=8,1, 5,1$ Гц, 2H), 7,19-7,05 (m, 1H), 4,06-3,79 (m, 1H), 3,71 (d, $J=8,3$ Гц, 1H), 3,43 (d, $J=8,3$ Гц, 1H), 2,95-2,71 (m, 2H), 1,55 (dd, $J=42,0, 7,1$ Гц, 3H), 1,34 (td, $J=7,5, 3,7$ Гц, 3H);

			¹⁹ F ЯМР (376 МГц, Ацетон- <i>d</i> ₆) δ -61,84, -117,57, -122,61, -128,05
F35	148-153	HRMS-ESI (масса/заряд) [M] ⁺ расщ. значение для C ₂₇ H ₁₆ Cl ₆ F ₅ N ₃ O ₅ S, 798,8862; наблюдаемое значение 798,8853	¹ H ЯМР (500 МГц, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 10,93 (s, 1H), 10,60 (s, 1H), 10,50 (s, 1H), 7,92 (d, <i>J</i> =2,6 Гц, 1H), 7,80 (s, 2H), 7,76 (dd, <i>J</i> =8,8, 2,6 Гц, 1H), 7,71 (td, <i>J</i> =8,6, 5,6 Гц, 1H), 7,56 (d, <i>J</i> =8,8 Гц, 1H), 7,30-7,23 (m, 1H), 5,04 (q, <i>J</i> =7,0 Гц, 1H), 3,64 (d, <i>J</i> =8,4 Гц, 1H), 3,55 (d, <i>J</i> =8,5 Гц, 1H), 1,77-1,63 (m, 3H); ¹⁹ F ЯМР (471 МГц, DMSO- <i>d</i> ₆) δ -74,47, -120,43 (d, <i>J</i> =7,3 Гц), -123,87
F36	155-159	HRMS-ESI (масса/заряд) [M] ⁺ расщ. значение для C ₂₆ H ₁₄ Cl ₆ F ₅ N ₃ O ₅ S, 784,8705; наблюдаемое значение 784,8701	¹ H ЯМР (500 МГц, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 10,93 (s, 1H), 10,52 (s, 1H), 10,50 (s, 1H), 7,92 (d, <i>J</i> =2,6 Гц, 1H), 7,83-7,67 (m, 4H), 7,56 (d, <i>J</i> =8,8 Гц, 1H), 7,29-7,23 (m, 1H), 5,14 (s, 2H), 3,64 (d, <i>J</i> =8,4 Гц, 1H), 3,55 (d, <i>J</i> =8,5 Гц, 1H); ¹⁹ F ЯМР (471 МГц, DMSO- <i>d</i> ₆) δ -77,04, -120,46 (d, <i>J</i> =7,5 Гц), -123,99 (d, <i>J</i> =8,4 Гц)
F37	146-151	HRMS-ESI (масса/заряд) [M] ⁺ расщ. значение для C ₂₇ H ₁₇ Cl ₅ F ₅ N ₃ O ₅ S, 764,9252; наблюдаемое значение 764,9246	¹ H ЯМР (500 МГц, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 10,95 (s, 1H), 10,59 (s, 1H), 10,50 (s, 1H), 7,92 (d, <i>J</i> =2,6 Гц, 1H), 7,84-7,63 (m, 4H), 7,56 (d, <i>J</i> =8,8 Гц, 1H), 7,43 (dd, <i>J</i> =8,4, 2,1 Гц, 1H), 7,29-7,22 (m, 1H), 5,04 (q, <i>J</i> =6,9 Гц, 1H), 3,61 (d, <i>J</i> =8,5 Гц, 1H), 3,46 (d, <i>J</i> =8,5 Гц, 1H), 1,71 (d, <i>J</i> =6,9 Гц, 3H); ¹⁹ F ЯМР (471 МГц, DMSO- <i>d</i> ₆) δ -74,47, -120,43, -123,87
F38	172-177	HRMS-ESI (масса/заряд) [M] ⁺ расщ.	¹ H ЯМР (500 МГц, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 10,95 (s, 1H), 10,52 (s, 1H), 10,50 (s, 1H), 7,92 (d, <i>J</i> =2,6 Гц, 1H), 7,76 (td, <i>J</i> =4,6, 4,1, 2,5 Гц, 2H), 7,70 (t, <i>J</i> =7,8 Гц, 2H), 7,56 (d,

		<p>значение для $C_{26}H_{15}Cl_3F_5N_3O_5$ S, 750,9095; наблюдаемое значение 750,9092</p>	<p>$J=8,8$ Гц, 1H), 7,43 (dd, $J=8,5$, 2,1 Гц, 1H), 7,26 (td, $J=9,2$, 1,7 Гц, 1H), 5,15 (s, 2H), 3,61 (d, $J=8,5$ Гц, 1H), 3,46 (d, $J=8,5$ Гц, 1H); ^{19}F ЯМР (471 МГц, DMSO-d_6) δ -77,04, -120,47 (d, $J=7,9$ Гц), -123,98 (d, $J=8,3$ Гц)</p>
F39	117-122	<p>HRMS-ESI (масса/заряд) [M]⁺ рассч. значение для $C_{27}H_{17}Cl_4F_6N_3O_5$ S, 748,9547; наблюдаемое значение 748,9550</p>	<p>1H ЯМР (500 МГц, DMSO-d_6) δ 10,94 (s, 1H), 10,60 (s, 1H), 10,50 (s, 1H), 7,92 (d, $J=2,6$ Гц, 1H), 7,76 (dd, $J=8,8$, 2,6 Гц, 1H), 7,73-7,66 (m, 2H), 7,56 (d, $J=8,7$ Гц, 1H), 7,51-7,41 (m, 2H), 7,26 (td, $J=9,2$, 1,6 Гц, 1H), 5,04 (q, $J=6,9$ Гц, 1H), 3,59 (d, $J=8,4$ Гц, 1H), 3,44 (d, $J=8,5$ Гц, 1H), 1,71 (d, $J=7,4$ Гц, 3H); ^{19}F ЯМР (471 МГц, DMSO-d_6) δ -74,47, -117,23 - -117,34 (m), -120,43 (t, $J=7,4$ Гц), -123,88 (d, $J=6,6$ Гц)</p>
F40	111-116	<p>HRMS-ESI (масса/заряд) [M]⁺ рассч. значение для $C_{26}H_{15}Cl_4F_6N_3O_5$ S, 734,9391; наблюдаемое значение 734,9384</p>	<p>1H ЯМР (500 МГц, DMSO-d_6) δ 10,95 (s, 1H), 10,52 (s, 1H), 10,50 (s, 1H), 7,92 (d, $J=2,6$ Гц, 1H), 7,80-7,67 (m, 3H), 7,56 (d, $J=8,7$ Гц, 1H), 7,52-7,42 (m, 2H), 7,29-7,22 (m, 1H), 5,14 (s, 2H), 3,59 (d, $J=8,4$ Гц, 1H), 3,44 (d, $J=8,4$ Гц, 1H); ^{19}F ЯМР (471 МГц, DMSO-d_6) δ -77,04, -117,26 - -117,31 (m), -120,47 (t, $J=8,0$ Гц), -123,98 (d, $J=8,2$ Гц)</p>
F41	140-145	<p>HRMS-ESI (масса/заряд) [M]⁺ рассч. значение для $C_{27}H_{16}Cl_6F_5N_3O_5$ S, 798,8862; наблюдаемое значение 798,8862</p>	<p>1H ЯМР (400 МГц, DMSO-d_6) δ 10,94 (s, 1H), 10,49 (s, 2H), 7,92 (d, $J=2,5$ Гц, 1H), 7,80 (s, 2H), 7,75 (dd, $J=8,8$, 2,6 Гц, 1H), 7,73-7,65 (m, 1H), 7,56 (d, $J=8,8$ Гц, 1H), 7,30-7,20 (m, 1H), 4,77 (q, $J=10,0$ Гц, 2H), 4,56 (s, 2H), 3,64 (d, $J=8,4$ Гц, 1H), 3,55 (d, $J=8,5$ Гц, 1H); ^{19}F ЯМР (376 МГц, DMSO-d_6) δ -59,32, -120,17 (d, $J=2,6$ Гц), -123,78 (d, $J=2,6$ Гц)</p>

F42	142-146	HRMS-ESI (масса/заряд) [M+] ⁺ расч. значение для C ₂₇ H ₁₇ Cl ₃ F ₅ N ₃ O ₅ S, 764,9252; наблюдаемое значение 764,9242	¹ H ЯМР (400 МГц, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 10,95 (s, 1H), 10,49 (s, 2H), 7,92 (d, <i>J</i> =2,5 Гц, 1H), 7,75 (dd, <i>J</i> =6,3, 2,3 Гц, 2H), 7,69 (d, <i>J</i> =8,2 Гц, 2H), 7,56 (d, <i>J</i> =8,7 Гц, 1H), 7,43 (dd, <i>J</i> =8,4, 2,1 Гц, 1H), 7,30-7,20 (m, 1H), 4,77 (q, <i>J</i> =10,1 Гц, 2H), 4,56 (s, 2H), 3,61 (d, <i>J</i> =8,4 Гц, 1H), 3,46 (d, <i>J</i> =8,5 Гц, 1H); ¹⁹ F ЯМР (376 МГц, DMSO- <i>d</i> ₆) δ -59,32, -120,17 (d, <i>J</i> =2,7 Гц), -123,77 (d, <i>J</i> =2,7 Гц)
F43	126-131	HRMS-ESI (масса/заряд) [M+] ⁺ расч. значение для C ₂₇ H ₁₇ Cl ₄ F ₆ N ₃ O ₅ S, 748,9547; наблюдаемое значение 748,9549	¹ H ЯМР (400 МГц, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 10,95 (s, 1H), 10,49 (br s, 2H), 7,93 (d, <i>J</i> =2,6 Гц, 1H), 7,81-7,64 (m, 3H), 7,56 (d, <i>J</i> =8,8 Гц, 1H), 7,51-7,42 (m, 2H), 7,25 (dd, <i>J</i> =10,1, 8,4 Гц, 1H), 4,77 (q, <i>J</i> =10,0 Гц, 2H), 4,56 (s, 2H), 3,59 (d, <i>J</i> =8,4 Гц, 1H), 3,44 (d, <i>J</i> =8,5 Гц, 1H); ¹⁹ F ЯМР (376 МГц, DMSO- <i>d</i> ₆) δ -59,32, -117,29, -120,17 (d, <i>J</i> =2,6 Гц), -123,77 (d, <i>J</i> =3,1 Гц)
F44	132-136	HRMS-ESI (масса/заряд) [M+H] ⁺ расч. значение для C ₂₈ H ₁₇ Cl ₃ F ₉ N ₃ O ₅ S, 782,9811; наблюдаемое значение 782,9803	¹ H ЯМР (400 МГц, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 10,96 (s, 1H), 10,49 (s, 2H), 7,93 (d, <i>J</i> =2,6 Гц, 1H), 7,89-7,79 (m, 2H), 7,76 (dd, <i>J</i> =8,8, 2,6 Гц, 1H), 7,70 (td, <i>J</i> =8,7, 5,7 Гц, 1H), 7,64-7,53 (m, 2H), 7,25 (td, <i>J</i> =9,2, 1,7 Гц, 1H), 4,80 (d, <i>J</i> =10,1 Гц, 1H), 4,75 (d, <i>J</i> =10,1 Гц, 1H), 4,56 (s, 2H), 3,69 (d, <i>J</i> =8,4 Гц, 1H), 3,51 (d, <i>J</i> =8,5 Гц, 1H); ¹⁹ F ЯМР (376 МГц, DMSO- <i>d</i> ₆) δ -59,33, -59,92 (d, <i>J</i> =12,6 Гц), -116,94 (q, <i>J</i> =12,4 Гц), -120,18 (d, <i>J</i> =2,7 Гц), -123,77 (d, <i>J</i> =2,7 Гц)
F45		ESIMS масса/заряд 745 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (400 МГц, Ацетон- <i>d</i> ₆) δ 10,19 (s, 1H), 9,50 (s, 1H), 9,28 (s, 1H), 8,11 (td, <i>J</i> =8,7, 5,6 Гц, 1H), 8,03 (d, <i>J</i> =2,6 Гц, 1H), 7,87-7,78 (m, 3H), 7,53-7,43 (m, 2H), 7,15 (td, <i>J</i> =9,2, 2,0 Гц, 1H), 4,28 (q, <i>J</i> =7,1 Гц, 1H), 3,72 (d, <i>J</i> =8,3 Гц, 1H), 3,43 (d, <i>J</i> =8,3 Гц, 1H), 3,24 (qd, <i>J</i> =7,4, 2,4 Гц, 2H), 1,69 (d, <i>J</i> =7,1 Гц, 3H), 1,35 (t, <i>J</i> =7,5 Гц,

			3H); ¹⁹ F ЯМР (376 МГц, Ацетон- <i>d</i> ₆) δ -61,85, -117,59, -122,62, -128,07
F46		ESIMS масса/заряд 785 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (400 МГц, Ацетон- <i>d</i> ₆) δ 10,21 (s, 1H), 9,49 (s, 1H), 9,22 (s, 1H), 8,18-8,01 (m, 2H), 7,87-7,77 (m, 3H), 7,48 (dd, <i>J</i> =9,2, 6,9 Гц, 2H), 7,19-7,09 (m, 1H), 4,00 (t, <i>J</i> =7,2 Гц, 2H), 3,72 (d, <i>J</i> =8,3 Гц, 1H), 3,44 (d, <i>J</i> =8,3 Гц, 1H), 3,21 (t, <i>J</i> =7,2 Гц, 2H); ¹⁹ F ЯМР (376 МГц, Ацетон- <i>d</i> ₆) δ -61,88, -79,64, -117,63, -123,07, -128,35
F47		ESIMS масса/заряд 721 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (400 МГц, Ацетон- <i>d</i> ₆) δ 10,20 (s, 1H), 9,51 (s, 1H), 9,32 (s, 1H), 8,11 (td, <i>J</i> =8,7, 5,5 Гц, 1H), 8,04 (d, <i>J</i> =2,6 Гц, 1H), 7,86-7,71 (m, 3H), 7,74-7,62 (m, 2H), 7,48 (d, <i>J</i> =8,7 Гц, 1H), 7,14 (td, <i>J</i> =9,2, 1,9 Гц, 1H), 4,13 (s, 2H), 3,73 (d, <i>J</i> =8,3 Гц, 1H), 3,45 (d, <i>J</i> =8,3 Гц, 1H); ¹⁹ F ЯМР (376 МГц, Ацетон- <i>d</i> ₆) δ -42,82, -63,06, -123,20, -128,53
F48		ESIMS масса/заряд 786 ([M+H] ⁻)	¹ H ЯМР (400 МГц, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 10,96 (s, 1H), 10,48 (s, 1H), 10,24 (s, 1H), 8,22 (s, 2H), 8,13 (s, 1H), 7,94 (d, <i>J</i> =2,6 Гц, 1H), 7,77 (dd, <i>J</i> =8,8, 2,6 Гц, 1H), 7,68 (td, <i>J</i> =8,7, 5,6 Гц, 1H), 7,57 (d, <i>J</i> =8,7 Гц, 1H), 7,23 (td, <i>J</i> =9,2, 1,8 Гц, 1H), 4,07 (s, 2H), 3,86 (d, <i>J</i> =8,5 Гц, 1H), 3,70 (d, <i>J</i> =8,5 Гц, 1H); ¹⁹ F ЯМР (376 МГц, DMSO- <i>d</i> ₆) δ -40,99, -61,20, -120,67, -124,46
F49	204-207	HRMS-ESI (масса/заряд) [M] ⁺ рассч. значение для C ₂₇ H ₁₅ Cl ₃ F ₉ N ₃ O ₃ S, 736,9756; наблюдаемое значение	¹ H ЯМР (400 МГц, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 10,96 (s, 1H), 10,48 (s, 1H), 10,24 (s, 1H), 7,93 (d, <i>J</i> =2,6 Гц, 1H), 7,79-7,63 (m, 5H), 7,56 (d, <i>J</i> =8,8 Гц, 1H), 7,28-7,17 (m, 1H), 4,07 (s, 2H), 3,74 (d, <i>J</i> =8,5 Гц, 1H), 3,59 (d, <i>J</i> =8,5 Гц, 1H); ¹⁹ F ЯМР (376 МГц, DMSO- <i>d</i> ₆) δ -40,97, -61,09, -110,49, -120,66, -124,45

		736,9770	
F50	206-210	HRMS-ESI (масса/заряд) [M] ⁺ расщ. значение для C ₂₇ H ₁₉ Cl ₃ F ₅ N ₃ O ₃ S, 665,0133; наблюдаемое значение 665,0133	¹ H ЯМР (400 МГц, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 10,96 (s, 1H), 10,37-10,25 (m, 2H), 7,96-7,80 (m, 3H), 7,75 (dd, <i>J</i> =8,8, 2,6 Гц, 1H), 7,71 (dd, <i>J</i> =12,9, 2,3 Гц, 1H), 7,69-7,57 (m, 2H), 7,55 (d, <i>J</i> =8,8 Гц, 1H), 7,34-7,25 (m, 1H), 3,69 (d, <i>J</i> =8,4 Гц, 1H), 3,51 (d, <i>J</i> =8,5 Гц, 1H), 3,28 (s, 2H), 2,17 (s, 3H); ¹⁹ F ЯМР (376 МГц, DMSO- <i>d</i> ₆) δ -59,91 (d, <i>J</i> =12,5 Гц), -116,94 (q, <i>J</i> =12,4 Гц), -120,41
F51		HRMS-ESI (масса/заряд) [M] ⁺ расщ. значение для C ₂₇ H ₁₆ Cl ₃ F ₈ N ₃ O ₃ S, 718,9850; наблюдаемое значение 718,9848	¹ H ЯМР (400 МГц, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 10,97 (s, 1H), 10,60 (s, 1H), 10,34 (s, 1H), 7,91 (d, <i>J</i> =2,6 Гц, 1H), 7,87 (d, <i>J</i> =6,8 Гц, 2H), 7,75 (dd, <i>J</i> =8,8, 2,6 Гц, 1H), 7,73-7,64 (m, 2H), 7,63-7,52 (m, 2H), 7,28 (dd, <i>J</i> =8,6, 2,4 Гц, 1H), 4,04 (s, 2H), 3,69 (d, <i>J</i> =8,4 Гц, 1H), 3,51 (d, <i>J</i> =8,5 Гц, 1H); ¹⁹ F ЯМР (376 МГц, DMSO- <i>d</i> ₆) δ -40,81, -59,91 (d, <i>J</i> =12,3 Гц), -116,94 (q, <i>J</i> =12,5 Гц), -120,16
F52		HRMS-ESI (масса/заряд) [M] ⁺ расщ. значение для C ₂₈ H ₁₈ Cl ₃ F ₈ N ₃ O ₃ S, 733,0007; наблюдаемое значение 733,0005	¹ H ЯМР (400 МГц, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 10,96 (s, 1H), 10,43 (s, 1H), 10,32 (s, 1H), 7,91 (d, <i>J</i> =2,6 Гц, 1H), 7,89-7,81 (m, 2H), 7,75 (dd, <i>J</i> =8,8, 2,6 Гц, 1H), 7,72-7,65 (m, 2H), 7,62-7,54 (m, 2H), 7,31-7,26 (m, 1H), 3,69 (d, <i>J</i> =8,5 Гц, 1H), 3,63 (q, <i>J</i> =10,7 Гц, 2H), 3,55-3,50 (m, 3H); ¹⁹ F ЯМР (376 МГц, DMSO- <i>d</i> ₆) δ -59,91 (d, <i>J</i> =12,3 Гц), -65,01, -116,94 (q, <i>J</i> =12,5 Гц), -120,35

Аналитические данные для соединений в табл. 2

Соед. №	Масс-спектрометрия	ЯМР (^1H , ^{13}C , ^{19}F)
DP1	ESIMS 813 ([M-H] ⁻)	^1H ЯМР (300 МГц, DMSO- d_6) δ 10,96 (s, 1H), 10,52 (s, 1H), 7,93 (d, $J=2,6$ Гц, 1H), 7,81 (s, 2H), 7,79-7,69 (m, 2H), 7,57 (d, $J=8,8$ Гц, 1H), 7,28 (td, $J=9,2, 1,6$ Гц, 1H), 3,64 (d, $J=8,5$ Гц, 1H), 3,56 (d, $J=8,5$ Гц, 1H), 1,40 (s, 18H); ^{19}F ЯМР (376 МГц, DMSO- d_6) δ -123,50 (d, $J=2,0$ Гц), -126,50 (d, $J=2,0$ Гц)
DP2	ESIMS 614 ([M+H] ⁺)	^1H ЯМР (400 МГц, DMSO- d_6) δ 10,94 (s, 1H), 10,18 (s, 1H), 7,90 (d, $J=2,5$ Гц, 1H), 7,80 (s, 2H), 7,75 (dd, $J=8,8, 2,6$ Гц, 1H), 7,54 (d, $J=8,7$ Гц, 1H), 6,91 (ddd, $J=10,6, 8,8, 1,8$ Гц, 1H), 6,80 (td, $J=8,5, 5,6$ Гц, 1H), 5,31 (s, 2H), 3,64 (d, $J=8,5$ Гц, 1H), 3,56 (d, $J=9,4$ Гц, 1H); ^{19}F ЯМР (376 МГц, DMSO- d_6) δ -133,96 (d, $J=14,0$ Гц), -138,08 (d, $J=13,9$ Гц)
DP3	ESIMS 580 ([M+H] ⁺)	^1H ЯМР (400 МГц, DMSO- d_6) δ 10,96 (s, 1H), 10,18 (s, 1H), 7,89 (d, $J=2,6$ Гц, 1H), 7,75 (dd, $J=9,7, 2,3$ Гц, 2H), 7,69 (d, $J=8,3$ Гц, 1H), 7,54 (d, $J=8,7$ Гц, 1H), 7,43 (dd, $J=8,4, 2,1$ Гц, 1H), 6,91 (ddd, $J=10,6, 8,8, 1,8$ Гц, 1H), 6,80 (td, $J=8,4, 5,5$ Гц, 1H), 5,31 (s, 2H), 3,61 (d, $J=8,5$ Гц, 1H), 3,47 (d, $J=8,5$ Гц, 1H); ^{19}F ЯМР (376 МГц, DMSO- d_6) δ -133,96 (d, $J=14,0$ Гц), -138,07 (d, $J=13,9$ Гц)
DP4	ESIMS 564 ([M+H] ⁺)	^1H ЯМР (400 МГц, DMSO- d_6) δ 10,97 (s, 1H), 10,17 (s, 1H), 7,90 (d, $J=2,6$ Гц, 1H), 7,73 (ddd, $J=13,9, 7,9, 2,2$ Гц, 2H), 7,54 (d, $J=8,7$ Гц, 1H), 7,51-7,42 (m, 2H), 6,91 (ddd, $J=10,6, 8,9, 1,8$ Гц, 1H), 6,80 (td, $J=8,5, 5,6$ Гц, 1H), 5,30 (s, 2H), 3,59 (d, $J=8,5$ Гц, 1H), 3,45 (d, $J=8,5$ Гц, 1H); ^{19}F ЯМР (376 МГц, DMSO- d_6) δ -117,28, -133,95 (d, $J=13,8$ Гц), -138,07 (d, $J=13,8$ Гц)
DP5	ESIMS масса/заряд 597 ([M+H] ⁺)	^1H ЯМР (400 МГц, Ацетон- d_6) δ 10,19 (s, 1H), 9,28 (s, 1H), 8,01 (d, $J=2,6$ Гц, 1H), 7,82 (dq, $J=9,1, 2,7$ Гц, 3H), 7,52-7,43 (m, 2H), 7,37 (td, $J=8,6, 5,5$ Гц, 1H), 6,94-6,84 (m, 1H), 4,77 (d, $J=8,5$ Гц, 2H), 3,72 (d, $J=8,3$ Гц, 1H), 3,43

		(d, $J=8,3$ Гц, 1H); ^{19}F ЯМР (376 МГц, Ацетон- d_6) δ -61,82, -117,59, -137,17, -144,17
DP6	ESIMS масса/заряд 579 ([M+H] ⁺)	^1H ЯМР (400 МГц, CDCl_3) δ 9,33 (s, 1H), 8,30 (d, $J=2,1$ Гц, 1H), 7,96 (dd, $J=8,8, 2,7$ Гц, 1H), 7,66 (d, $J=2,7$ Гц, 1H), 7,59 (d, $J=7,7$ Гц, 1H), 7,52-7,41 (m, 3H), 7,37 (dd, $J=18,7, 8,3$ Гц, 2H), 6,82-6,72 (m, 1H), 3,74 (s, 2H), 3,60 (d, $J=8,2$ Гц, 1H), 2,96 (d, $J=8,2$ Гц, 1H); ^{19}F ЯМР (376 МГц, CDCl_3) δ -62,63, -134,53, -145,15
DP7	ESIMS масса/заряд 648 ([M+H] ⁺)	^1H ЯМР (400 МГц, $\text{DMSO}-d_6$) δ 10,94 (s, 1H), 10,18 (s, 1H), 8,22 (s, 2H), 8,13 (s, 1H), 7,91 (d, $J=2,6$ Гц, 1H), 7,76 (dd, $J=8,8, 2,6$ Гц, 1H), 7,55 (d, $J=8,8$ Гц, 1H), 6,91 (ddd, $J=10,6, 8,9, 1,8$ Гц, 1H), 6,81 (td, $J=8,4, 5,6$ Гц, 1H), 5,31 (s, 2H), 3,86 (d, $J=8,5$ Гц, 1H), 3,70 (d, $J=8,5$ Гц, 1H); ^{19}F ЯМР (376 МГц, $\text{DMSO}-d_6$) δ -61,19, -133,97 (d, $J=13,8$ Гц), -138,09 (d, $J=14,0$ Гц)
DP8	ESIMS масса/заряд 597 ([M+H] ⁺)	^1H ЯМР (400 МГц, ацетон- d_6) δ 10,17 (s, 1H), 9,25 (s, 1H), 8,01 (d, $J=2,6$ Гц, 1H), 7,81 (dd, $J=8,7, 2,6$ Гц, 1H), 7,73-7,67 (m, 1H), 7,61 (dt, $J=9,5, 1,9$ Гц, 1H), 7,55 (dt, $J=8,7, 1,9$ Гц, 1H), 7,48 (d, $J=8,7$ Гц, 1H), 7,38 (td, $J=8,6, 5,5$ Гц, 1H), 6,89 (ddd, $J=10,9, 9,1, 2,0$ Гц, 1H), 4,77 (s, 2H), 3,77 (d, $J=8,3$ Гц, 1H), 3,50 (d, $J=8,4$ Гц, 1H); ^{19}F ЯМР (376 МГц, ацетон- d_6) δ -63,19, -111,80, -137,23, -144,25

Оценочная таблица BAW для и CL

% контроля (или смертности)	Оценка
50-100	A
Более 0 - менее 50	B
Не тестировали	C
В данном биоанализе не отмечали никакой активности	D

Оценочная таблица для GPA и YFM

% контроля (или смертности)	Оценка
80-100	A
Более 0 - менее 80	B
Не тестировали	C
В данном биоанализе не отмечали никакой активности	D

Биологические результаты

№	Вид организмов			
	BAW	CL	GPA	YFM
F1	A	A	C	C
F2	A	A	C	C
F3	A	A	B	C
F4	A	A	C	C
F5	A	A	C	D
F6	A	A	C	C
F7	A	A	C	C
F8	A	A	C	C
F9	A	A	C	C
F10	A	A	C	C
F11	A	A	C	C
F12	A	A	C	C
F13	A	A	C	C
F14	A	A	C	C
F15	A	A	C	A
F16	A	A	C	A
F17	A	A	C	A

F18	A	A	C	A
F19	A	A	C	A
F20	A	A	C	C
F21	A	A	C	A
F22	A	A	C	D
F23	A	A	C	A
F24	A	A	C	A
F25	A	A	C	A
F26	A	A	C	C
F27	A	A	C	C
F28	A	A	C	C
F29	A	A	C	C
F30	A	A	C	C
F31	A	A	C	C
F32	A	A	C	A
F33	A	A	C	C
F34	A	A	B	A
F35	A	A	C	C
F36	A	A	C	C
F37	A	A	C	C
F38	A	A	C	C
F39	A	A	C	C
F40	A	A	C	C
F41	A	A	C	C
F42	A	A	C	C
F43	A	A	C	C
F44	A	A	C	C
F45	A	A	C	D
F46	A	A	C	A
F47	A	A	C	C
F48	A	A	C	C
F49	A	A	C	C
F50	A	A	C	C
F51	A	A	C	C
F52	A	A	C	C

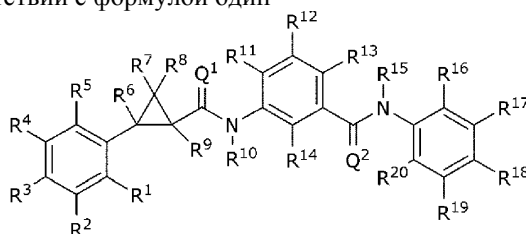
Таблица ABC-DP

Биологические результаты

№	Вид организмов			
	BAW	CL	GPA	YFM
DP1	B	D	C	D
DP2	A	A	C	A
DP3	A	A	C	A
DP4	A	A	C	A
DP5	A	A	C	A
DP6	A	A	A	B
DP7	A	A	C	A
DP8	A	A	C	A

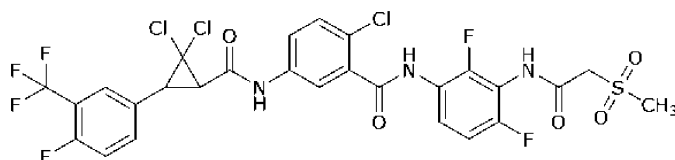
ФОРМУЛА ИЗОБРЕТЕНИЯ

1. Соединение в соответствии с формулой один



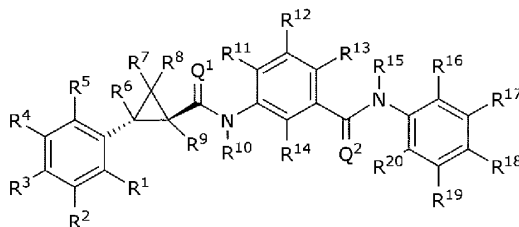
Формула один

- где (a) R^1 представляет собой H;
- (b) R^2 выбирают из группы, состоящей из H, F, Cl, Br, I и (C_1-C_3) галогеналкила;
- (c) R^3 выбирают из группы, состоящей из H, F, Cl, Br и I;
- (d) R^4 выбирают из группы, состоящей из H, F, Cl, Br, I и (C_1-C_3) галогеналкила;
- (e) R^5 представляет собой H;
- (f) R^6 представляет собой H;
- (g) R^7 выбирают из группы, состоящей из F, Cl и Br;
- (h) R^8 выбирают из группы, состоящей из F, Cl и Br;
- (i) R^9 представляет собой H;
- (j) Q^1 представляет собой O;
- (k) Q^2 представляет собой O;
- (l) R^{10} представляет собой H;
- (m) R^{11} представляет собой H;
- (n) R^{12} представляет собой H;
- (o) R^{13} выбирают из группы, состоящей из H, F, Cl, Br и I;
- (p) R^{14} представляет собой H;
- (q) R^{15} представляет собой H;
- (r) R^{16} , R^{17} , R^{18} , R^{19} и R^{20} независимо выбирают из группы, состоящей из H, F, Cl, Br, I и $N(R^{21})C(=O)(R^{22})$, где по меньшей мере один, но не более двух из R^{16} , R^{17} , R^{18} , R^{19} и R^{20} представляют собой $N(R^{21})C(=O)(R^{22})$;
- (s) R^{21} представляет собой из H;
- (t) R^{22} выбирают из группы, состоящей из (C_1-C_6) алкил-S(=O) $_n$ -(C_1-C_6)алкила, (C_1-C_6) алкил-S(=O) $_n$ -(C_2-C_6)алкенила, (C_1-C_6) алкил-S(=O) $_n$ арила и (C_1-C_6) алкил-S(=O) $_n$ пиридила, где $n=0, 1$ или 2 , каждый указанный алкил и арил может быть замещен одним или несколькими заместителями, выбранными из группы, состоящей из F, Cl, Br и I и "арил" означает циклический, ароматический заместитель, состоящий из водорода и углерода, такой как фенил, нафтил и бифенил; и
- его приемлемые с точки зрения сельского хозяйства соли и разделенные стереоизомеры при условии исключения следующего соединения:



соединение F1299.

2. Соединение по п.1, где указанное соединение характеризуется структурой, соответствующей формуле два



Формула два

3. Соединение по любому из предыдущих пунктов,

где R^1 представляет собой H;

R^2 выбирают из группы, состоящей из H, F, Cl, Br и CF_3 ;

R^3 выбирают из группы, состоящей из H, F, Cl, Br и CF_3 ;

R^4 выбирают из группы, состоящей из H, F, Cl, Br и CF_3 ;

R^5 представляет собой H;

R^7 представляет собой Cl;

R^8 представляет собой Cl;

Q^1 представляет собой O;

Q^2 представляет собой O;

R^{11} представляет собой H;

R^{12} представляет собой H;

R^{13} выбирают из группы, состоящей из F и Cl;

R^{14} представляет собой H;

(a) R^{16} , R^{18} , R^{19} и R^{20} независимо выбирают из группы, состоящей из H, F, Cl, Br и I, а R^{17} представляет собой $N(R^{21})C(=O)(R^{22})$; или

(b) R^{16} , R^{17} , R^{19} и R^{20} независимо выбирают из группы, состоящей из H, F, Cl, Br и I, а R^{18} представляет собой $N(R^{21})C(=O)(R^{22})$;

R^{21} представляет собой H; и

R^{22} выбирают из группы, состоящей из (C_1-C_6) алкил- $S(=O)_n$ -(C_1-C_6)алкила, (C_1-C_6) алкил- $S(=O)_n$ -(C_2-C_6)алкенила, (C_1-C_6) алкил- $S(=O)_n$ -арила, (C_1-C_6) алкил- $S(=O)_n$ -пиридила, где $n=0, 1$ или 2 и каждый указанный алкил и арил может быть замещен одним или несколькими заместителями, выбранными из группы, состоящей из F, Cl, Br и I.

4. Соединение по любому из п.1 или 2, где R^7 и R^8 не являются одинаковыми заместителями и R^{22} выбирают из группы, состоящей из (C_1-C_6) алкил- $S(=O)_n$ -(C_1-C_6)алкила, (C_1-C_6) алкил- $S(=O)_n$ -(C_2-C_6)алкенила, (C_1-C_6) алкил- $S(=O)_n$ -фенила, (C_1-C_6) алкил- $S(=O)_n$ -пиридила, где $n=0, 1$ или 2 и каждый указанный алкил и фенил может быть замещен одним или несколькими заместителями, выбранными из группы, состоящей из F, Cl, Br и I.

5. Соединение по п.1 или 2,

где R^1 представляет собой H;

R^2 выбирают из группы, состоящей из H, F, Cl и CF_3 ;

R^3 выбирают из группы, состоящей из H, F и Cl;

R^4 выбирают из группы, состоящей из H, F, Cl и CF_3 ;

R^5 представляет собой H;

R^7 представляет собой Cl;

R^8 представляет собой Cl;

Q^1 представляет собой O;

Q^2 представляет собой O;

R^{11} представляет собой H;

R^{12} представляет собой H;

R^{13} представляет собой Cl;

R^{14} представляет собой H;

R^{16} представляет собой F;

R^{17} представляет собой $N(R^{21})C(=O)(R^{22})$;

R^{18} представляет собой F;

R¹⁹ представляет собой H;

R²⁰ представляет собой H;

R²¹ представляет собой H; и

R²² выбирают из группы, состоящей из (C₁-C₆)алкил-S(=O)_n-(C₁-C₆)алкила, (C₁-C₆)алкил-S(=O)_n-(C₂-C₆)алкенила, (C₁-C₆)алкил-S(=O)_nфенила, (C₁-C₆)алкил-S(=O)_nпиридила, где n=0, 1 или 2 и каждый указанный алкил и фенил может быть замещен одним или несколькими заместителями, выбранными из группы, состоящей из F и Cl.

6. Соединение по п.1 или 2,

где R¹ представляет собой H;

R² выбирают из группы, состоящей из H, F, Cl и CF₃;

R³ выбирают из группы, состоящей из H, F и Cl;

R⁴ выбирают из группы, состоящей из H, F, Cl и CF₃;

R⁵ представляет собой H;

R⁷ представляет собой Cl;

R⁸ представляет собой Cl;

Q¹ представляет собой O;

Q² представляет собой O;

R¹¹ представляет собой H;

R¹² представляет собой H;

R¹³ представляет собой Cl;

R¹⁴ представляет собой H;

R¹⁶ представляет собой F;

R¹⁷ представляет собой H;

R¹⁸ представляет собой N(R²¹)C(=O)(R²²);

R¹⁹ представляет собой H;

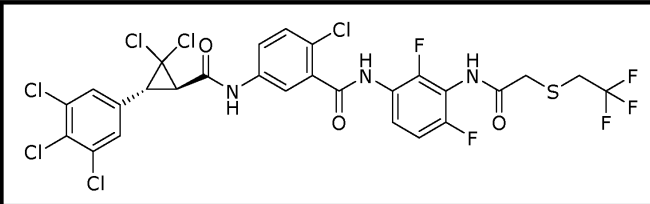
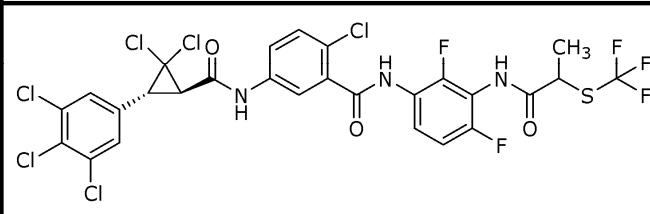
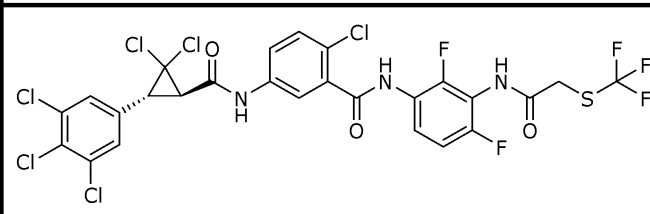
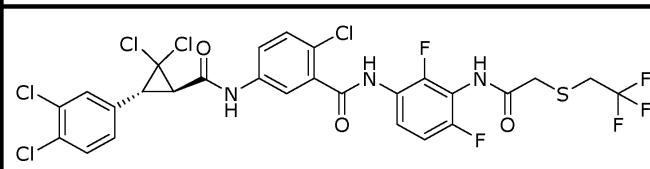
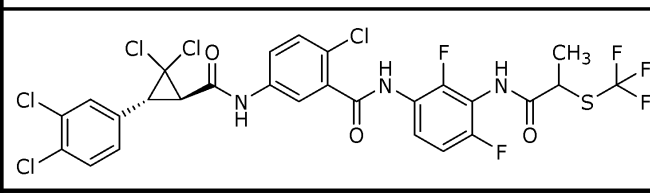
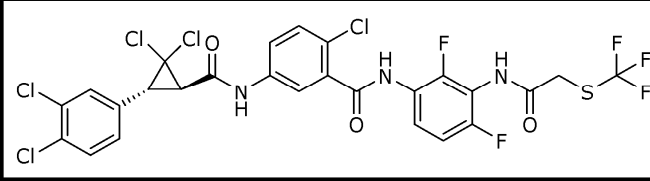
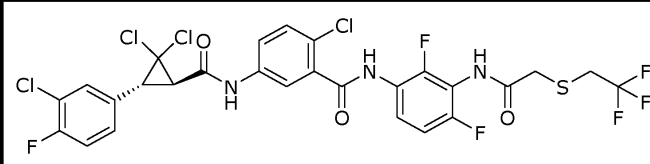
R²⁰ представляет собой H;

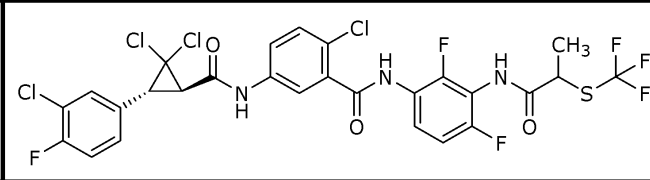
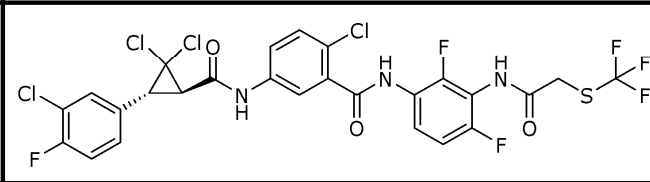
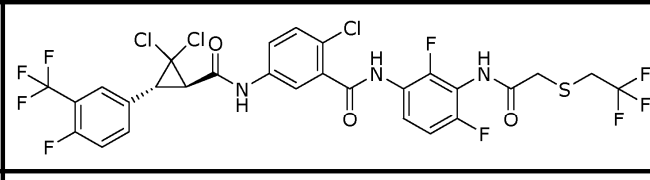
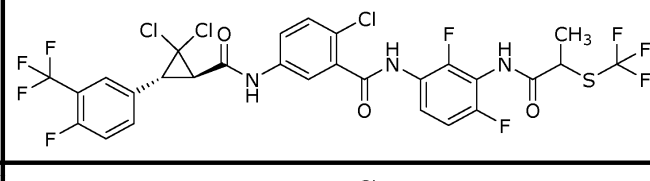
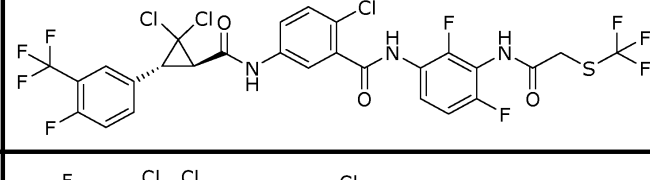
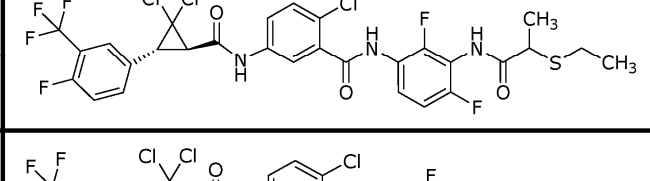
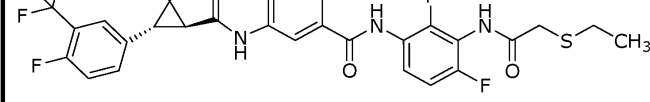
R²¹ представляет собой H; и

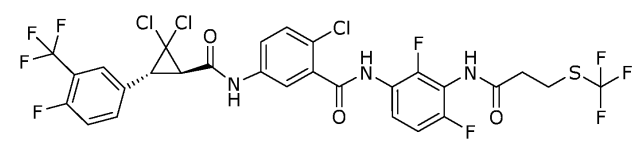
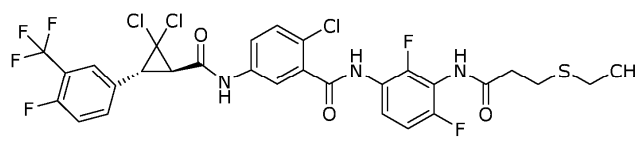
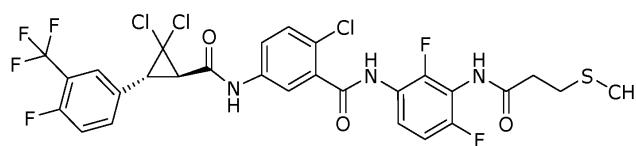
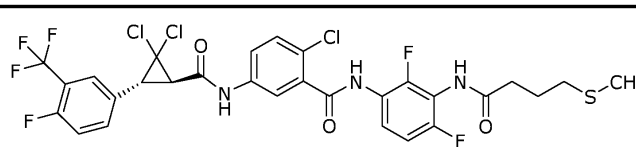
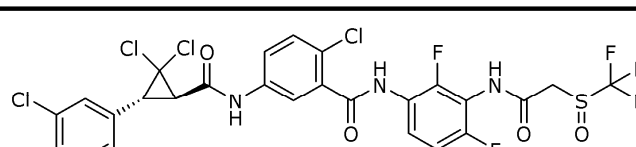
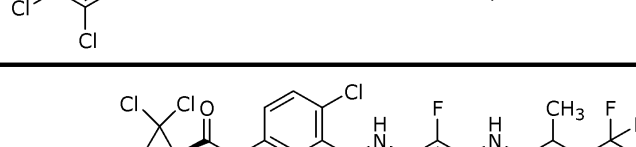
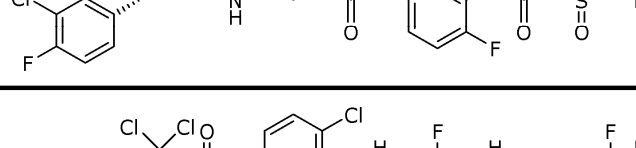
R²² представляет собой (C₁-C₆)алкил-S(=O)_n-(C₁-C₆)алкил, где n=0 и каждый указанный алкил может быть замещен одним или несколькими заместителями, выбранными из группы, состоящей из F и Cl.

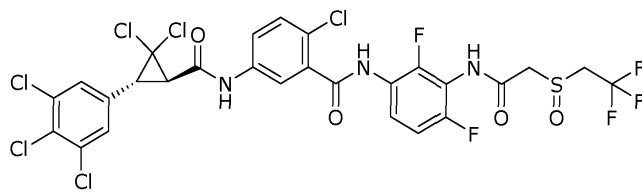
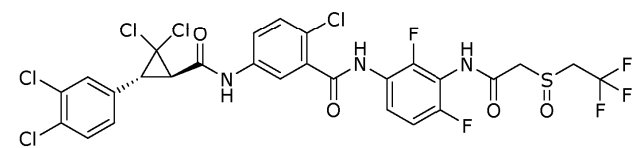
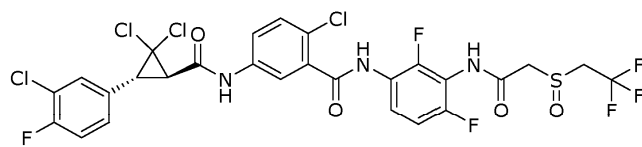
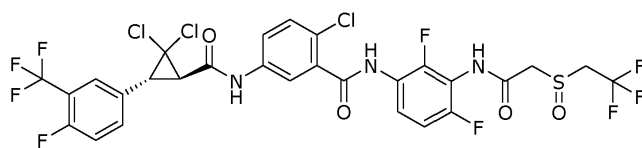
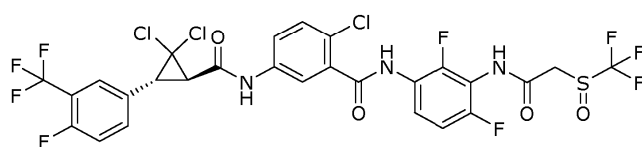
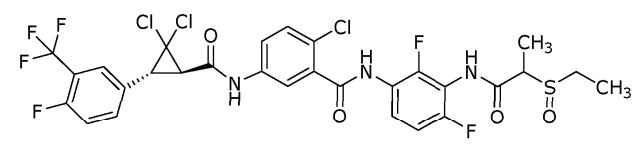
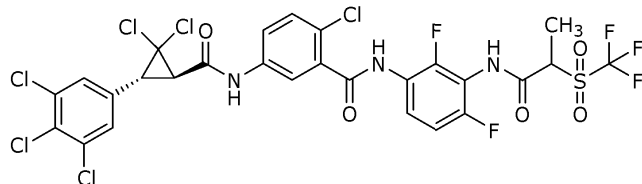
7. Соединение по п.1, где указанное соединение выбирают из следующих соединений в таблице:

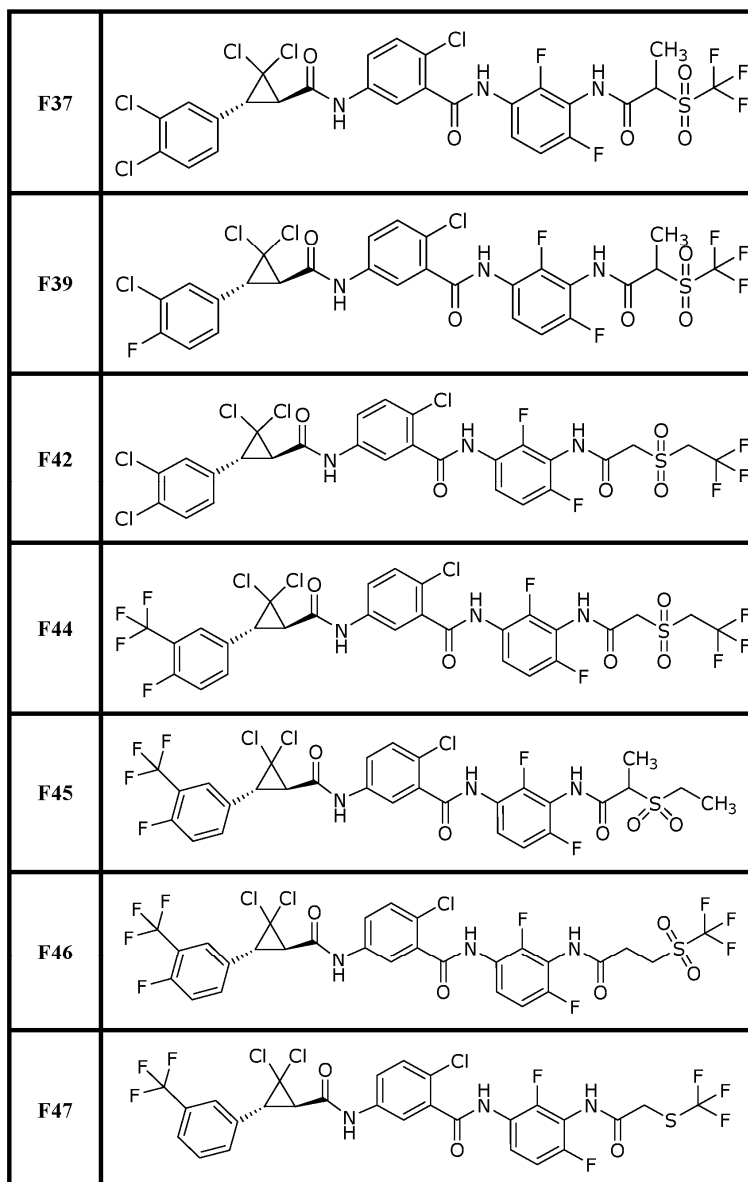
No.	Структура
F2	
F3	
F4	
F5	

F6	
F7	
F8	
F9	
F10	
F11	
F12	

F13	
F14	
F15	
F16	
F17	
F18	
F19	

F22	
F23	
F24	
F25	
F26	
F27	
F28	

F29	
F30	
F31	
F32	
F33	
F34	
F35	



F48	
F49	
F50	
F51	
F52	

8. Соединение по п.1, где указанное соединение выбирают из следующих соединений в таблице:

No.	Структура
F3	
F5	
F6	

F10	
F12	
F13	
F14	
F15	
F16	
F17	
F18	
F19	
F23	
F27	

F28	
F29	
F31	
F32	
F37	
F39	
F46	
F47	
F49	

9. Соединение по п.1, где указанное соединение выбирают из следующих соединений в таблице:

No.	Структура
F15	
F16	
F17	
F18	
F19	
F21	
F23	
F24	
F25	

F32	
F34	
F46	

10. Композиция для борьбы с вредителем, содержащая соединение по любому из предыдущих пунктов и носитель.

11. Способ борьбы с вредителем, при этом указанный способ включает нанесение на места обитания пестицидно эффективного количества композиции по п.10.



Евразийская патентная организация, ЕАПВ

Россия, 109012, Москва, Малый Черкасский пер., 2