

(19)



Евразийское  
патентное  
ведомство

(21) 202490356 (13) A1

(12) ОПИСАНИЕ ИЗОБРЕТЕНИЯ К ЕВРАЗИЙСКОЙ ЗАЯВКЕ

(43) Дата публикации заявки  
2024.04.27

(51) Int. Cl. C07D 401/04 (2006.01)  
A01N 43/54 (2006.01)

(22) Дата подачи заявки  
2022.07.25

(54) (3-ХИНОЛИЛ)ХИНАЗОЛИН

(31) 21189028.0

(32) 2021.08.02

(33) EP

(86) PCT/EP2022/070787

(87) WO 2023/011957 2023.02.09

(71) Заявитель:  
БАСФ СЕ (DE)

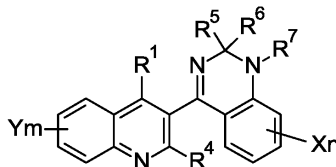
(72) Изобретатель:

Граммелос Вассилиос, Мюллер Бернд,  
Зебергер Филипп Георг Вернер,  
Мергет Бенъямин Йюрген, Штёссер  
Тим Александер, Ле Везуэ Ронан,  
Ломанн Ян Клас, Циглер Доротея  
Зофия, Минакар Амин, Ридигер  
Надине, Кох Андреас (DE)

(74) Представитель:

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

(57) Настоящее изобретение относится к соединениям формулы I



где переменные имеют значения, указанные в описании и формуле изобретения. Также изобретение относится к их применению и композиции.

A1

202490356

202490356

A1

## (3-ХИНОЛИЛ)-ХИНАЗОЛИН

5 Настоящее изобретение относится к новым соединениям хиназолина и их N-оксидам и солям в качестве фунгицидов, а также к их применению. Изобретение также относится к композиции, содержащей по меньшей мере одно соединение I, к способу борьбы с фитопатогенными грибами и к семенам, покрытым по меньшей мере одним соединением формулы I.

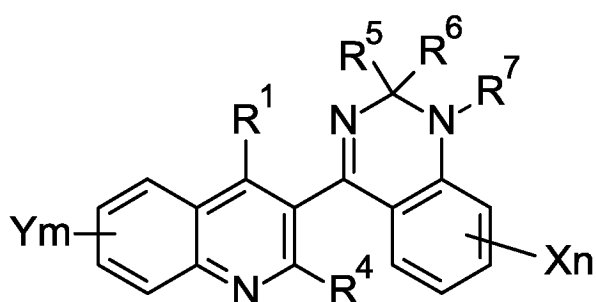
10 В JP2011148714 описаны некоторые подобные соединения. Однако, во многих случаях, в частности, при низких нормах внесения, фунгицидная активность известных соединений является неудовлетворительной. Исходя из этого, целью настоящего изобретения было предоставить соединения, обладающие улучшенной активностью и/или более широким спектром

15 активности против фитопатогенных грибов. Другой целью настоящего изобретения является создание фунгицидов с улучшенными токсикологическими свойствами или с улучшенными свойствами трансформации в окружающей среде.

Эти и другие цели достигаются за счет хинолиновых соединений формулы (I), как определено ниже, и их пригодных в сельском хозяйстве солей.

20

Соответственно, настоящее изобретение относится к соединениям формулы I



25 где

R<sup>1</sup> представляет собой H, галоген, CN, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкил, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-галогеналкил;

R<sup>4</sup> представляет собой H; галоген, CN, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкил, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-галогеналкил;

$R^5$  в каждом случае независимо выбраны из галогена, CN,  $C_1$ - $C_6$ -алкила,  $C_1$ - $C_6$ -галогеналкила,  $C_2$ - $C_6$ -алкенила,  $C_2$ - $C_6$ -галогеналкенила,  $C_2$ - $C_6$ -алкинила,  $C_2$ - $C_6$ -галогеналкинила, фенила, бензила,

5 где фенильные и бензильные фрагменты  $R^5$  являются незамещенными или замещены одной-тремя группами  $R^{5a}$ , которые независимо друг от друга выбраны из:

галогена, CN,  $C_1$ - $C_6$ -алкила,  $C_1$ - $C_6$ -галогеналкила, O- $C_1$ - $C_6$ -алкила;

10  $R^6$  в каждом случае независимо выбраны из галогена, CN,  $C_1$ - $C_6$ -алкила,  $C_1$ - $C_6$ -галогеналкила,  $C_2$ - $C_6$ -алкенила,  $C_2$ - $C_6$ -галогеналкенила,  $C_2$ - $C_6$ -алкинила,  $C_2$ - $C_6$ -галогеналкинила, фенила, бензила,

где фенильные и бензильные фрагменты  $R^6$  являются незамещенными или замещены одной-тремя группами  $R^{6a}$ , которые независимо друг от друга выбраны из:

галогена, CN,  $C_1$ - $C_6$ -алкила,  $C_1$ - $C_6$ -галогеналкила, O- $C_1$ - $C_6$ -алкила;

15 или

$R^5$  и  $R^6$  образуют вместе с C-атомами, к которым они присоединены,  $C_3$ - $C_6$ -циклоалкил или 3- - 6-членный насыщенный гетероцикл, который содержит 1, 2 или 3 гетероатома из группы, состоящей из O и S;

20  $R^7$  в каждом случае независимо выбран из водорода, CN,  $CH_2CN$ ,  $CH(CH_3)CN$ ,  $CH(=O)$ ,  $C(=O)C_1$ - $C_6$ -алкила,  $C(=O)C_2$ - $C_6$ -алкенила,  $C(=O)C_2$ - $C_6$ -алкинила,  $C(=O)C_3$ - $C_6$ -циклоалкила,  $C(=O)NH$ - $C_1$ - $C_4$ -алкила,  $C(=O)N$ -( $C_1$ - $C_4$ -алкила) $_2$ ,  $C_1$ - $C_6$ -алкила, O- $C_1$ - $C_6$ -алкила,  $C_1$ - $C_4$ -галогеналкила,  $C_3$ - $C_6$ -циклоалкила,  $C_3$ - $C_6$ -галогенциклоалкила,  $C_2$ - $C_6$ -алкенила,  $C_2$ - $C_6$ -галогеналкенил  $C_2$ - $C_6$ -алкинила,  $C_2$ - $C_6$ -галогеналкинила,  $-S(=O)_2-R^{7a}$ , пяти- или шестичленного гетероарила и арила или бензила; где гетероарил содержит один, два или три гетероатома, выбранных из N, O и S; где арильные или бензильные группы являются незамещенными или несут один, два, три, четыре или пять заместителей, выбранных из группы, состоящей из CN, галогена, OH,  $C_1$ - $C_4$ -алкила,  $C_1$ - $C_4$ -галогеналкила,  $C_1$ - $C_4$ -алкокси и  $C_1$ - $C_4$ -галогеналкокси; где

30  $R^{7a}$  выбран из  $C_1$ - $C_6$ -алкила,  $C_1$ - $C_6$ -галогеналкила,  $C_2$ - $C_6$ -алкенила,  $C_2$ - $C_6$ -галогеналкенила,  $C_2$ - $C_6$ -алкинила,  $C_2$ - $C_6$ -галогеналкинила, фенила, бензила, где фенил и бензил могут быть незамещенными или замещены галогеном,  $C_1$ - $C_6$ -алкилом,  $C_1$ - $C_6$ -галогеналкилом,  $C_2$ - $C_6$ -алкенилом,  $C_2$ - $C_6$ -галогеналкенилом,  $C_2$ - $C_6$ -алкинилом,  $C_2$ - $C_6$ -галогеналкинилом;

X в каждом случае независимо выбран из галогена, CN, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкила, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-галогеналкила, O-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкила, O-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-галогеналкила;

n представляет собой 0, 1, 2 или 3;

Y в каждом случае независимо выбран из галогена, CN, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкила, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-галогеналкила, O-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкила;

m представляет собой 1, 2 или 3;

и к их N-оксидам и приемлемым в сельском хозяйстве солям в качестве фунгицидов.

N-Оксиды могут быть получены из соединений в соответствии с изобретением согласно обычным способам окисления, например, обработкой соединения I органической надкислотой, такой как метахлорпербензойная кислота (см. WO 03/64572 или J. Med. Chem. 38(11), 1892-903, 1995); или неорганическими окислителями, такими как перекись водорода (cf. J. Heterocyc. Chem. 18(7), 1305-8, 1981) или оксон (cf. J. Am. Chem. Soc. 123(25), 5962-5973, 2001). Окисление может привести к чистым моно-N-оксидам или к смеси различных N-оксидов, которые можно разделить обычными методами, такими как хроматография.

K приемлемым в сельском хозяйстве солям соединений формулы I, в частности, относят соли тех катионов или кислотно-аддитивные соли тех кислот, катионы, соответственно анионы, которых не оказывают неблагоприятного эффекта на фунгицидную активность соединений I. Таким образом, пригодными катионами являются, в частности, ионы щелочных металлов, предпочтительно натрия и калия, щелочноземельных металлов, предпочтительно кальция, магния и бария, переходных металлов, предпочтительно марганца, меди, цинка и железа, а также ион аммония, который, при желании, может быть замещен посредством от одного до четырех C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкильных заместителей и/или одним фенильным или бензильным заместителем, предпочтительно таким как диизопропиламмоний, тетраметиламмоний, тетрабутиламмоний, триметилбензиламмоний, кроме того, ионы фосфония, ионы сульфония, предпочтительно три(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкил)сульфония, и ионы сульфоксония, предпочтительно три(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкил)сульфоксония.

Анионами пригодных кислотно-аддитивных солей в первую очередь являются хлорид, бромид, фторид, гидросульфат, сульфат, дигидрофосфат, гидрофосфат, фосфат, нитрат, бикарбонат, карбонат, гексафторсиликат,

гексафторфосфат, бензоат, а также анионы  $C_1$ - $C_4$ -алкановых кислот, предпочтительно формиат, ацетат, пропионат и бутират. Они могут быть образованы путем взаимодействия соединения I с кислотой соответствующего аниона, предпочтительно соляной кислотой, бромистоводородной кислотой, серной кислотой, фосфорной кислотой или азотной кислотой.

Соединения формулы I могут существовать в виде одного или нескольких стереоизомеров. Различные стереоизомеры включают энантиомеры, диастереомеры, атропоизомеры, возникающие в результате ограниченного вращения вокруг одинарной связи асимметрических групп и геометрических изомеров. Они также являются частью объекта в соответствии с настоящим изобретением. Специалист в данной области поймет, что один стереоизомер может быть более активным и/или может проявлять полезные эффекты при обогащении по сравнению с другим(ими) стереоизомером(ами) или при отделении от другого(их) стереоизомера(ов). Кроме того, квалифицированный специалист знает, как разделять, обогащать и/или селективно получать указанные стереоизомеры. Соединения в соответствии с изобретением могут присутствовать в виде смеси стереоизомеров, например, рацемата, индивидуальных стереоизомеров или в виде оптически активной формы.

Соединения формулы I могут присутствовать в различных кристаллических модификациях, биологическая активность которых может различаться. Они также являются частью объекта настоящего изобретения.

Что касается переменных, варианты осуществления промежуточных соединений, полученных при получении соединений I, соответствуют вариантам осуществления соединений формулы I. Термин «соединения I» относится к соединениям формулы I.

Далее описаны промежуточные соединения. Квалифицированный специалист легко поймет, что предпочтения заместителей, а также, в частности, тех, которые приведены в таблицах ниже для соответствующих заместителей, приведенных в настоящей заявке в связи с соединениями I, применимы к промежуточным соединениям соответственно. Таким образом, заместители в каждом случае независимо друг от друга или более предпочтительно в комбинации имеют значения, определенные в настоящей заявке.

Если синтез дает смеси изомеров, разделение обычно не требуется, поскольку в некоторых случаях отдельные изомеры могут взаимно превращаться

во время обработки для использования или во время применения (например, под действием света, кислот или оснований). Такие преобразования могут также происходить после применения, например, при обработке растений в обрабатываемом растении, или во вредном грибе, с которым ведут борьбу.

5 В определениях приведенных выше переменных, используют собирательные термины, которые обычно характерны для соответствующих заместителей. Термин «C<sub>n</sub>-C<sub>m</sub>» указывает возможное в каждом случае количество атомов углерода в заместителе или группе заместителей, о которых идет речь.

10 Термин «галоген» относится к фтору, хлору, бром и йоду.

Термин «C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкил» относится к неразветвленной или разветвленной насыщенной углеводородной группе с 1 - 6 атомами углерода, например, метил, этил, пропил, 1-метилэтил, бутил, 1-метилпропил, 2-метилпропил, 1,1-диметилэтил, пентил, 1-метилбутил, 2-метилбутил, 3-метилбутил,  
15 2,2-диметилпропил, 1-этилпропил, 1,1-диметилпропил, 1,2-диметилпропил, гексил, 1-метилпентил, 2-метилпентил, 3-метилпентил, 4-метилпентил, 1,1-диметилбутил, 1,2-диметилбутил, 1,3-диметилбутил, 2,2-диметилбутил, 2,3-диметилбутил, 3,3-диметилбутил, 1-этилбутил, 2-этилбутил, 1,1,2-триметилпропил, 1,2,2-триметилпропил, 1-этил-1-метилпропил и 1-этил-2-метилпропил. Равным образом, термин «C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>-алкил» относится к  
20 неразветвленной или разветвленной алкильной группе с 2 - 4 атомами углерода, такой как этил, пропил (*n*-пропил), 1-метилэтил (*изо*-пропил), бутил, 1-метилпропил (*втор.*-бутил), 2-метилпропил (*изо*-бутил), 1,1-диметилэтил (*трет.*-бутил).

25 Термин «C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-галогеналкил» относится к алкильной группе с 1 - 6 атомами углерода, как определено выше, в которой некоторые или все из атомов водорода в этих группах могут быть заменены атомами галогена, как указано выше. Примерами являются «C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-галогеналкильные» группы, такие как хлорметил, бромметил, дихлорметил, трихлорметил, фторметил, дифторметил,  
30 трифторметил, хлорфторметил, дихлорфторметил, хлордифторметил, 1-хлорэтил, 1-бромэтил, 1-фторэтил, 2-фторэтил, 2,2-дифторэтил, 2,2,2-трифторэтил, 2-хлор-2-фторэтил, 2-хлор-2,2-дифторэтил, 2,2-дихлор-2-фторэтил, 2,2,2-трихлорэтил или пентафторэтил.

Термин «С<sub>1</sub>-С<sub>6</sub>-алкокси» относится к неразветвленной или разветвленной алкильной группе с 1 - 6 атомами углерода, которая связана через кислород, в любом положении в алкильной группе. Примерами являются «С<sub>1</sub>-С<sub>4</sub>-алкокси» группы, такие как метокси, этокси, *n*-пропокси, 1-метилэтокси, бутокси, 1-метилпропокси, 2-метилпропокси или 1,1-диметилэтокси.

Термин «С<sub>1</sub>-С<sub>6</sub>-галогеналкокси» относится к С<sub>1</sub>-С<sub>6</sub>-алкокси радикалу, как определено выше, где некоторые или все из атомов водорода в этих группах могут быть заменены атомами галогена, указанными выше. Примерами являются «С<sub>1</sub>-С<sub>4</sub>-галогеналкокси» группы, такие как ОСН<sub>2</sub>F, ОСНF<sub>2</sub>, ОСF<sub>3</sub>, ОСН<sub>2</sub>Cl, ОСНCl<sub>2</sub>, ОССl<sub>3</sub>, хлорфторметокси, дихлорфторметокси, хлордифторметокси, 2-фторэтокси, 2-хлорэтокси, 2-бромэтокси, 2-йодэтокси, 2,2-дифторэтокси, 2,2,2-трифторэтокси, 2-хлор-2-фторэтокси, 2-хлор-2,2-дифторэтокси, 2,2-дихлор-2-фторэтокси, 2,2,2-трихлорэтокси, ОС<sub>2</sub>F<sub>5</sub>, 2-фторпропокси, 3-фторпропокси, 2,2-дифторпропокси, 2,3-дифторпропокси, 2 хлорпропокси, 3-хлорпропокси, 2,3-дихлорпропокси, 2-бромпропокси, 3 бромпропокси, 3,3,3-трифторпропокси, 3,3,3-трихлорпропокси, ОСН<sub>2</sub>-С<sub>2</sub>F<sub>5</sub>, ОСF<sub>2</sub>-С<sub>2</sub>F<sub>5</sub>, 1-фторметил-2-фторэтокси, 1-хлорметил-2-хлорэтокси, 1-бромметил-2-бромэтокси, 4-фторбутокси, 4-хлорбутокси, 4-бромбутокси или нафторбутокси.

Термин «С<sub>2</sub>-С<sub>6</sub>-алкенил» относится к линейному или разветвленному ненасыщенному углеводородному радикалу, содержащему от 2 до 6 атомов углерода и двойную связь в любом положении. Примерами являются «С<sub>2</sub>-С<sub>4</sub>-алкенильные» группы, такие как этенил, 1-пропенил, 2-пропенил (аллил), 1-метилэтенил, 1-бутенил, 2-бутенил, 3-бутенил, 1-метил-1-пропенил, 2-метил-1-пропенил, 1-метил-2-пропенил, 2-метил-2-пропенил.

Термин «С<sub>2</sub>-С<sub>6</sub>-галогеналкенил» относится к алкильной группе с 2 - 6 атомами углерода, как определено выше, где некоторые или все атомы водорода в этих группах могут быть заменены атомами галогена, как указано выше.

Термин «С<sub>2</sub>-С<sub>6</sub>-алкенилокси» относится к неразветвленной или разветвленной алкенильной группе с 2 - 6 атомами углерода, которая связана через кислород, в любом положении в алкенильной группе. Примерами являются «С<sub>2</sub>-С<sub>4</sub>-алкенилокси» группы.

Термин «С<sub>2</sub>-С<sub>6</sub>-алкинил» относится к неразветвленному или разветвленному ненасыщенному углеводородному радикалу, имеющему 2 - 6 атомов углерода и содержащему по меньшей мере одну тройную связь.

Примерами являются «С<sub>2</sub>-С<sub>4</sub>-алкинильные» группы, такие как этинил, проп-1-инил, проп-2-инил (пропаргил), бут-1-инил, бут-2-инил, бут-3-инил, 1-метил-проп-2-инил.

5 Термин «С<sub>2</sub>-С<sub>6</sub>-галогеналкинил» относится к алкильной группе с 2 - 6 атомами углерода, как определено выше, где некоторые или все атомы водорода в этих группах могут быть заменены атомами галогена, как указано выше.

10 Термин «С<sub>2</sub>-С<sub>6</sub>-алкинилокси» относится к неразветвленной или разветвленной алкинильной группе с 2 - 6 атомами углерода, которая связана через кислород, в любом положении в алкинильной группе. Примерами являются «С<sub>2</sub>-С<sub>4</sub>-алкинилокси» группы.

15 Термин «С<sub>3</sub>-С<sub>6</sub>-циклоалкил» относится к моноциклическим насыщенным углеводородным радикалам с 3 - 6 атомами углерода в кольце, таким как циклопропил, циклобутил, циклопентил, циклогексил. Соответственно, насыщенный трех-, четырех-, пяти-, шести-, семи-, восьми-, девяти- или десятичленный карбоциклил или карбоцикл представляет собой «С<sub>3</sub>-С<sub>10</sub>-циклоалкил».

20 Термин «С<sub>3</sub>-С<sub>6</sub>-циклоалкенил» относится к моноциклическому частично ненасыщенному 3-, 4- 5- или 6-членному карбоциклу, имеющему 3 - 6 атомов углерода в кольце и по меньшей мере одну двойную связь, такому как циклопентенил, циклопентадиенил, циклогексадиенил. Соответственно, частично ненасыщенный трех-, четырех-, пяти-, шести-, семи-, восьми-, девяти- или десятичленный карбоциклил или карбоцикл представляет собой «С<sub>3</sub>-С<sub>10</sub>-циклоалкенил».

25 Термин «С<sub>3</sub>-С<sub>8</sub>-циклоалкил-С<sub>1</sub>-С<sub>4</sub>-алкил» относится к алкилу с 1 - 4 атомами углерода (как определено выше), где один атом водорода алкильного радикала заменен на циклоалкильный радикал, имеющий 3 - 8 атомов углерода (как определено выше).

30 Термин «насыщенный или частично ненасыщенный трех-, четырех-, пяти-, шести-, семи-, восьми-, девяти- или десятичленный гетероциклил или гетероцикл, где гетероциклил или гетероцикл содержит 1, 2, 3 или 4 гетероатома, выбранных из N, O и S» следует понимать как означающий и насыщенные, и частично ненасыщенные гетероциклы, где атомы-члены кольца гетероцикла включают помимо атомов углерода 1, 2, 3 или 4 гетероатома, независимо выбранных из группы, включающей O, N и S. Например:



3- или 4-членный насыщенный гетероцикл, который содержит 1 или 2 гетероатома из группы, включающей O, N и S в виде членов кольца, таких как оксиран, азиридин, тиран, оксетан, азетидин, тиетан, [1,2]диоксетан, [1,2]дитиэтан, [1,2]дiazетидин; и

- 5 5- или 6-членный насыщенный или частично ненасыщенный гетероцикл, который содержит 1, 2 или 3 гетероатома из группы, включающей O, N и S в качестве членов кольца, таких как 2-тетрагидрофуранил, 3-тетрагидрофуранил, 2-тетрагидротиенил, 3-тетрагидротиенил, 2-пирролидинил, 3-пирролидинил, 3-изоксазолидинил, 4-изоксазолидинил, 5-изоксазолидинил, 3-изотиазолидинил, 10 4-изотиазолидинил, 5-изотиазолидинил, 3-пиразолидинил, 4-пиразолидинил, 5-пиразолидинил, 2-оксазолидинил, 4-оксазолидинил, 5-оксазолидинил, 2-тиазолидинил, 4-тиазолидинил, 5-тиазолидинил, 2-имидазолидинил, 4-имидазолидинил, 1,2,4-оксадиазолидин-3-ил, 1,2,4-оксадиазолидин-5-ил, 1,2,4-15 тиadiaзолидин-3-ил, 1,2,4-тиadiaзолидин-5-ил, 1,2,4-триазолидин-3-ил, 1,3,4-оксадиазолидин-2-ил, 1,3,4-тиadiaзолидин-2-ил, 1,3,4-триазолидин-2-ил, 2,3-дигидрофур-2-ил, 2,3-дигидрофур-3-ил, 2,4-дигидрофур-2-ил, 2,4-дигидрофур-3-ил, 2,3-дигидротиен-2-ил, 2,3-дигидротиен-3-ил, 2,4-дигидротиен-2-ил, 2,4-дигидротиен-3-ил, 2-пирролин-2-ил, 2-пирролин-3-ил, 3-пирролин-2-ил, 3-пирролин-3-ил, 2-изоксазолин-3-ил, 3-изоксазолин-3-ил, 4-изоксазолин-3-ил, 2-20 изоксазолин-4-ил, 3-изоксазолин-4-ил, 4-изоксазолин-4-ил, 2-изоксазолин-5-ил, 3-изоксазолин-5-ил, 4-изоксазолин-5-ил, 2-изотиазолин-3-ил, 3-изотиазолин-3-ил, 4-изотиазолин-3-ил, 2-изотиазолин-4-ил, 3-изотиазолин-4-ил, 4-изотиазолин-4-ил, 2-изотиазолин-5-ил, 3-изотиазолин-5-ил, 4-изотиазолин-5-ил, 2,3-дигидропиразол-1-ил, 2,3-дигидропиразол-2-ил, 2,3-дигидропиразол-3-ил, 2,3-25 дигидропиразол-4-ил, 2,3-дигидропиразол-5-ил, 3,4-дигидропиразол-1-ил, 3,4-дигидропиразол-3-ил, 3,4-дигидропиразол-4-ил, 3,4-дигидропиразол-5-ил, 4,5-дигидропиразол-1-ил, 4,5-дигидропиразол-3-ил, 4,5-дигидропиразол-4-ил, 4,5-дигидропиразол-5-ил, 2,3-дигидрооксазол-2-ил, 2,3-дигидрооксазол-3-ил, 2,3-дигидрооксазол-4-ил, 2,3-дигидрооксазол-5-ил, 3,4-дигидрооксазол-2-ил, 3,4-30 дигидрооксазол-3-ил, 3,4-дигидрооксазол-4-ил, 3,4-дигидрооксазол-5-ил, 3,4-дигидрооксазол-2-ил, 3,4-дигидрооксазол-3-ил, 3,4-дигидрооксазол-4-ил, 2-пиперидинил, 3-пиперидинил, 4-пиперидинил, 1,3-диоксан-5-ил, 2-тетрагидропиранил, 4-тетрагидропиранил, 2-тетрагидротиенил, 3-гексагидропиридазинил, 4-гексагидропиридазинил, 2-гексагидропиримидинил,

4-гексагидропиримидинил, 5-гексагидропиримидинил, 2-пиперазинил, 1,3,5-гексагидротриазин-2-ил и 1,2,4-гексагидротриазин-3-ил, а также соответствующие -илиденовые радикалы; и

7-членный насыщенный или частично ненасыщенный гетероцикл, такой как  
 5 тетра- и гексагидроазепинил, такой как 2,3,4,5-тетрагидро[1H]азепин-1-, -2-, -3-, -4-, -5-, -6- или -7-ил, 3,4,5,6-тетрагидро[2H]азепин-2-, -3-, -4-, -5-, -6- или -7-ил, 2,3,4,7-тетрагидро[1H]азепин-1-, -2-, -3-, -4-, -5-, -6- или -7-ил, 2,3,6,7-тетрагидро[1H]азепин-1-, -2-, -3-, -4-, -5-, -6- или -7-ил, гексагидроазепин-1-, -2-, -3- или -4-ил, тетра- и гексагидрооксепинил, такой как 2,3,4,5-  
 10 тетрагидро[1H]оксепин-2-, -3-, -4-, -5-, -6- или -7-ил, 2,3,4,7-тетрагидро[1H]оксепин-2-, -3-, -4-, -5-, -6- или -7-ил, 2,3,6,7-тетрагидро[1H]оксепин-2-, -3-, -4-, -5-, -6- или -7-ил, гексагидроазепин-1-, -2-, -3- или -4-ил, тетра- и гексагидро-1,3-дiazепинил, тетра- и гексагидро-1,4-дiazепинил, тетра- и гексагидро-1,3-оксазепинил, тетра- и гексагидро-1,4-  
 15 оксазепинил, тетра- и гексагидро-1,3-диоксепинил, тетра- и гексагидро-1,4-диоксепинил и соответствующие -илиденовые радикалы.

Термин «замещенный» относится к замещенным посредством 1, 2, 3 или максимально возможного количества заместителей.

Термин «5- или 6-членный гетероарил» или «5- или 6-членный  
 20 гетероароматический» относится к ароматическим кольцевым системам, включающим помимо атомов углерода, 1, 2, 3 или 4 гетероатома, независимо выбранных из группы, включающей N, O и S, например,

5-членный гетероарил, такой как пиррол-1-ил, пиррол-2-ил, пиррол-3-ил, тиен-2-ил, тиен-3-ил, фуран-2-ил, фуран-3-ил, пиразол-1-ил, пиразол-3-ил,  
 25 пиразол-4-ил, пиразол-5-ил, имидазол-1-ил, имидазол-2-ил, имидазол-4-ил, имидазол-5-ил, оксазол-2-ил, оксазол-4-ил, оксазол-5-ил, изоксазол-3-ил, изоксазол-4-ил, изоксазол-5-ил, тиазол-2-ил, тиазол-4-ил, тиазол-5-ил, изотиазол-3-ил, изотиазол-4-ил, изотиазол-5-ил, 1,2,4-триазолил-1-ил, 1,2,4-триазол-3-ил, 1,2,4-триазол-5-ил, 1,2,4-оксадиазол-3-ил, 1,2,4-оксадиазол-5-ил и  
 30 1,2,4-тиадиазол-3-ил, 1,2,4-тиадиазол-5-ил; или

6-членный гетероарил, такой как пиридин-2-ил, пиридин-3-ил, пиридин-4-ил, пиридазин-3-ил, пиридазин-4-ил, пиримидин-2-ил, пиримидин-4-ил, пиримидин-5-ил, пиразин-2-ил и 1,3,5-триазин-2-ил и 1,2,4-триазин-3-ил.

Далее описаны конкретные варианты осуществления соединений в соответствии с настоящим изобретением. В этом отношении, дополнительно подробно изложены конкретные значения соответствующих заместителей, причем значения в каждом случае сами по себе, а также и в любой комбинации друг с другом, представляют собой конкретные варианты осуществления настоящего изобретения.

Кроме того, в отношении переменных, в целом, варианты осуществления соединений I также относятся и к промежуточным соединениям.

В соответствии с одним из вариантов осуществления соединения формулы I, R<sup>1</sup> представляет собой H, галоген, CN, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкил, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-галогеналкил.

В соответствии с одним из вариантов осуществления соединения формулы I, R<sup>1</sup> представляет собой H.

В соответствии с одним из вариантов осуществления соединения формулы I, R<sup>1</sup> представляет собой CH<sub>3</sub>.

В соответствии с одним из вариантов осуществления соединения формулы I, R<sup>4</sup> представляет собой H, галоген, CN, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкил, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-галогеналкил.

В соответствии с одним из вариантов осуществления соединения формулы I, R<sup>4</sup> представляет собой H.

В соответствии с одним из вариантов осуществления соединения формулы I, R<sup>4</sup> представляет собой CH<sub>3</sub>.

R<sup>5</sup> в каждом случае независимо выбран из галогена, CN, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкила, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-галогеналкила, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-алкенила, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-галогеналкенила, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-алкинила, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-галогеналкинила, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкил-O-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкила, фенила, бензила,

где фенильные и бензильные фрагменты R<sup>5</sup> являются незамещенными или замещены одной-тремя группами R<sup>5a</sup>, которые независимо друг от друга выбраны из:

галогена, CN, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкила, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-галогеналкила, O-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкила.

В соответствии с одним из вариантов осуществления соединения формулы I, R<sup>5</sup> в каждом случае независимо выбран из C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкила (вариант осуществления изобретения 5.1), C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-галогеналкила (вариант осуществления изобретения 5.2), C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкил-O-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкила (вариант осуществления изобретения 5.3), фенила, СН<sub>2</sub>-фенила (вариант осуществления изобретения 5.4), галогена (вариант осуществления изобретения 5.5), где фенил и СН<sub>2</sub>-фенил являются незамещенными или замещены одним или двумя галогенами.

В соответствии с ещё одним вариантом осуществления соединения формулы I,  $R^5$  представляет собой  $CH_3$  или  $CF_3$ .

В соответствии с ещё одним вариантом осуществления соединения формулы I,  $R^5$  представляет собой  $CH_2CH_3$ ,  $CH(CH_3)_2$ ,  $CH(CH_3)CH_2CH_3$ ,  $C(CH_3)_3$ ,  
5  $CH_2-CH(CH_3)_2$ ,  $CH_2-C(CH_3)_3$ ,  $CH_2-O-CH_3$ .

В соответствии с ещё одним вариантом осуществления соединения формулы I,  $R^5$  представляет собой фенил, 2-F-фенил, 4-F-фенил, 2,4-F<sub>2</sub>-фенил, 2-Cl-фенил, 4-Cl-фенил,  $CH_2$ -фенил,  $CH_2$ -2-F-фенил,  $CH_2$ -4-F-фенил.

В соответствии с одним из вариантов осуществления соединения формулы I,  $R^6$  в каждом случае независимо выбран из из галогена, CN, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкила, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-галогеналкила, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-алкенила, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-галогеналкенила, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-алкинила, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-галогеналкинила, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкил-O-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкила, фенила, бензила, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкил-O-фенила,  
10

где фенильные и бензильные фрагменты  $R^6$  являются незамещенными или  
15 замещены одной-тремя группами  $R^{6a}$ , которые независимо друг от друга выбраны из:

галогена, CN, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкила, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-галогеналкила, O-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкила.

В соответствии с одним из вариантов осуществления соединения формулы I,  $R^6$  в каждом случае независимо выбран из C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкила (вариант осуществления изобретения 6.1), C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкил-O-фенила (вариант осуществления изобретения 6.2), C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкил-O-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкила (вариант осуществления изобретения 6.3), галогена (вариант осуществления изобретения 6.4).  
20

В соответствии с ещё одним вариантом осуществления соединения формулы I,  $R^6$  представляет собой  $CH_3$  или  $CF_3$ .

В соответствии с ещё одним вариантом осуществления соединения формулы I,  $R^6$  представляет собой  $CH_2CH_3$ ,  $CH(CH_3)_2$ ,  $CH(CH_3)CH_2CH_3$ ,  $C(CH_3)_3$ ,  
25  $CH_2-CH(CH_3)_2$ ,  $CH_2-C(CH_3)_3$ ,  $CH_2-CH(CH_3)-C(CH_3)_3$ ,  $CH_2-CH_2-C(CH_3)_3$ ,  $CH_2-O-CH_3$ ,  $CH_2-O-(CH_3)_3$ ,  $CH_2-O$ -фенил.

В соответствии с ещё одним вариантом осуществления соединения формулы I,  $R^5$  и  $R^6$  образуют вместе с C-атомами, к которым они присоединены, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-циклоалкил или 3- - 6-членный насыщенный гетероцикл, который содержит 1, 2 или 3 гетероатома из группы, состоящей из O и S.  
30




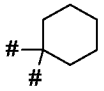

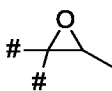


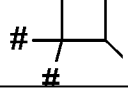
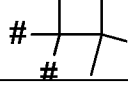
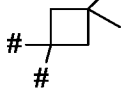

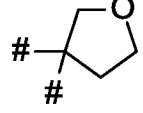
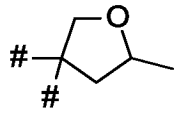
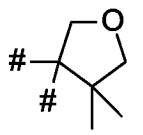
В соответствии с ещё одним вариантом осуществления соединения формулы I,  $R^5$  и  $R^6$  образуют C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-циклоалкил (вариант осуществления 6.5).

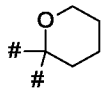
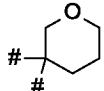
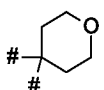
В соответствии с ещё одним вариантом осуществления соединения формулы I, R<sup>5</sup> и R<sup>6</sup> образуют 3- - 6-членный насыщенный гетероцикл, который содержит 1, 2 или 3 гетероатома из группы, состоящей из O и S.

5 В соответствии с ещё одним вариантом осуществления соединения формулы I, R<sup>5</sup> и R<sup>6</sup> образуют 3- - 6-членный насыщенный гетероцикл, который содержит один O (вариант осуществления 6.6).

10 Предпочтительные варианты осуществления R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup> в соответствии с изобретением представлены в Таблице P5 ниже, где каждая строка из строк P5-1 - P5-18 соответствует одному конкретному варианту осуществления, где P5-1 - P5-18 также в любой комбинации друг с другом представляют собой предпочтительный вариант осуществления настоящего изобретения. Точка присоединения к атому углерода, к которому присоединен R<sup>5</sup> и R<sup>6</sup>, отмечена на изображениях знаком «#».

15 **Таблица P5,6:**

№	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>
P5-1		
P5-2		
P5-3		
P5-4		
P5-5		
P5-6		
P5-7		
P5-8		
P5-9		
P5-10		
P5-11		
P5-12		
P5-13		
P5-14		
P5-15		

№	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>
P5-16		
P5-17		
P5-18		

$R^7$  в каждом случае независимо выбран из водорода, CN,  $CH_2CN$ ,  $CH(CH_3)CN$ ,  $CH(=O)$ ,  $C(=O)C_1-C_6$ -алкила,  $C(=O)C_2-C_6$ -алкенила,  $C(=O)C_2-C_6$ -алкинила,  $C(=O)C_3-C_6$ -циклоалкила,  $C(=O)NH-C_1-C_4$ -алкила,  $C(=O)N-(C_1-C_4$ -алкила) $_2$ ,  $C_1-C_6$ -алкила,  $O-C_1-C_6$ -алкила,  $C_1-C_4$ -галогеналкила,  $C_3-C_6$ -циклоалкила,  $C_3-C_6$ -галогенциклоалкила,  $C_2-C_6$ -алкенила,  $C_2-C_6$ -галогеналкенил  $C_2-C_6$ -алкинила,  $C_2-C_6$ -галогеналкинила,  $CH_2C(=O)C_2-C_6$ -алкенила,  $CH_2C(=O)C_2-C_6$ -алкинила,  $CH_2C(=O)C_3-C_6$ -циклоалкила,  $CH_2C(=O)NH-C_1-C_4$ -алкила,  $CH_2C(=O)N-(C_1-C_4$ -алкила) $_2$ ,  $-S(=O)_2-R^{7a}$ , пяти- или шестичленного гетероарила и арила; где гетероарил содержит один, два или три гетероатома, выбранных из N, O и S; где арильные группы незамещены или несут один, два, три, четыре или пять заместителей, выбранных из группы, состоящей из CN, галогена, OH,  $C_1-C_4$ -алкила,  $C_1-C_4$ -галогеналкила,  $C_1-C_4$ -алкокси и  $C_1-C_4$ -галогеналкокси; где  $R^{7a}$  выбран из  $C_1-C_6$ -алкила,  $C_1-C_6$ -галогеналкила,  $C_2-C_6$ -алкенила,  $C_2-C_6$ -галогеналкенила,  $C_2-C_6$ -алкинила,  $C_2-C_6$ -галогеналкинила, фенила, бензила, где фенил и бензил могут быть незамещенными или замещены галогеном,  $C_1-C_6$ -алкилом,  $C_1-C_6$ -галогеналкилом,  $C_2-C_6$ -алкенилом,  $C_2-C_6$ -галогеналкенилом,  $C_2-C_6$ -алкинилом,  $C_2-C_6$ -галогеналкинилом.

В соответствии с одним из вариантов осуществления формулы I,  $R^7$  представляет собой H.

В соответствии с ещё одним вариантом осуществления формулы I,  $R^7$  представляет собой Cl, F.

В соответствии с ещё одним вариантом осуществления формулы I,  $R^7$  представляет собой CN,  $CH_2CN$  или  $CH(CH_3)CN$ .

В соответствии с дополнительным отдельным вариантом осуществления формулы I,  $R^7$  представляет собой  $CH(=O)$ .

В соответствии с дополнительным отдельным вариантом осуществления формулы I,  $R^7$  представляет собой  $OCH_3$ .

В соответствии с дополнительным отдельным вариантом осуществления формулы I,  $R^7$  представляет собой  $C(=O)C_1-C_6$ -алкил, где алкил представляет собой  $CH_3$ ,  $C_2H_5$ , н-пропил, изо-пропил, н-бутил, изо-бутил, трет-бутил, н-пентил или изо-пентил.

В соответствии с дополнительным отдельным вариантом осуществления формулы I,  $R^7$  представляет собой  $C(=O)C_2-C_6$ -алкенил, где алкенил представляет собой  $CH=CH_2$ ,  $CH_2CH=CH_2$ .

5 В соответствии с дополнительным отдельным вариантом осуществления формулы I,  $R^7$  представляет собой  $C(=O)C_2-C_6$ -алкинил, где алкинил представляет собой  $C\equiv CH$ ,  $CH_2C\equiv CH$ .

В соответствии с дополнительным отдельным вариантом осуществления формулы I,  $R^7$  представляет собой  $C(=O)C_3-C_6$ -циклоалкил, где циклоалкил представляет собой циклопропил ( $C_3H_7$ ) или циклобутил ( $C_4H_9$ ).

10 В соответствии с дополнительным отдельным вариантом осуществления формулы I,  $R^7$  представляет собой  $C(=O)NH-C_1-C_4$ -алкил или  $C(=O)N-(C_1-C_4$ -алкил) $_2$ , где алкил представляет собой  $CH_3$ ,  $C_2H_5$ , н-пропил, изо-пропил, н-бутил, изо-бутил, трет-бутил,

15 В соответствии с ещё одним вариантом осуществления формулы I,  $R^7$  представляет собой  $C_1-C_6$ -алкил, такой как  $CH_3$ ,  $C_2H_5$ , н-пропил, изо-пропил, н-бутил, изо-бутил, трет-бутил, н-пентил или изо-пентил.

В соответствии с ещё одним вариантом осуществления формулы I,  $R^7$  представляет собой  $C_1-C_6$ -алкил, в особенности  $C_1-C_4$ -алкил, такой как  $CH_3$ ,  $C_2H_5$ , н-пропил, изо-пропил.

20 В соответствии с ещё одним вариантом осуществления формулы I,  $R^7$  представляет собой  $C_1-C_6$ -галогеналкил, в особенности  $C_1-C_4$ -галогеналкил, такой как  $CF_3$ ,  $CCl_3$ ,  $FCH_2$ ,  $ClCH_2$ ,  $F_2CH$ ,  $Cl_2CH$ ,  $CF_3CH_2$ ,  $CCl_3CH_2$  или  $CF_2CHF_2$ .

В соответствии с ещё одним вариантом осуществления формулы I  $R^7$  представляет собой  $C_3-C_6$ -циклоалкил, в особенности циклопропил.

25 В соответствии с ещё одним вариантом осуществления формулы I,  $R^7$  представляет собой  $C_3-C_6$ -галогенциклоалкил. В особом варианте осуществления изобретения  $R^{5b}$  представляет собой полностью или частично галогенированный циклопропил, такой как 1-F-циклопропил, 1-Cl-циклопропил, 1,1-F $_2$ -циклопропил, 1,1-Cl $_2$ -циклопропил.

30 В соответствии с ещё одним дополнительным вариантом осуществления формулы I,  $R^7$  представляет собой  $C_2-C_6$ -алкенил, в особенности  $C_2-C_4$ -алкенил, такой как  $CH=CH_2$ ,  $C(CH_3)=CH_2$ ,  $CH_2CH=CH_2$ .

В соответствии с дополнительным отдельным вариантом осуществления формулы I,  $R^7$  представляет собой  $C_2-C_6$ -галогеналкенил, в особенности  $C_2-C_4$ -



галогеналкенил, ещё более особенно  $C_2$ - $C_3$ -галогеналкенил, такой как  $CH=CHF$ ,  $CH=CHCl$ ,  $CH=CF_2$ ,  $CH=CCl_2$ ,  $CH_2CH=CHF$ ,  $CH_2CH=CHCl$ ,  $CH_2CH=CF_2$ ,  $CH_2CH=CCl_2$ ,  $CF_2CH=CF_2$ ,  $CCl_2CH=CCl_2$ ,  $CF_2CF=CF_2$ ,  $CCl_2CCl=CCl_2$ .

5 В соответствии с ещё одним дополнительным вариантом осуществления формулы I,  $R^7$  представляет собой  $C_2$ - $C_6$ -алкинил или  $C_2$ - $C_6$ -галогеналкинил, в особенности  $C_2$ - $C_4$ -алкинил или  $C_2$ - $C_4$ -галогеналкинил, такой как  $C\equiv CH$ ,  $CH_2C\equiv CH$ .

10 В соответствии с ещё одним дополнительным вариантом осуществления формулы I,  $R^7$  представляет собой  $-S(=O)_2-R^{7a}$ , где  $R^{7a}$  представляет собой предпочтительно  $C_1$ - $C_6$ -алкил, в особенности  $C_1$ - $C_4$ -алкил, такой как  $CH_3$ ,  $C_2H_5$ , н-пропил, изо-пропил.

15 В соответствии с ещё одним вариантом осуществления формулы I,  $R^7$  представляет собой арил, в особенности фенил, где арильный или фенильный фрагмент в каждом случае является незамещенным или замещен одинаковыми или разными группами  $R^{5b}$ , которые независимо друг от друга выбраны из галогена,  $C_1$ - $C_2$ -алкила,  $C_1$ - $C_2$ -алкокси,  $C_1$ - $C_2$ -галогеналкила и  $C_1$ - $C_2$ -галогеналкокси, в особенности F, Cl, Br,  $CH_3$ ,  $OCH_3$ ,  $CF_3$  и  $OCF_3$ . В соответствии с одним из вариантов осуществления изобретения,  $R^5$  представляет собой незамещенный фенил. В соответствии с другим вариантом осуществления изобретения,  $R^5$  представляет собой фенил, который замещен одним, двумя или 20 тремя, в особенности одним, галогеном, в особенности который выбран из F, Cl и Br, ещё более особенно выбран из F и Cl.

25 В соответствии с ещё одним вариантом осуществления формулы I,  $R^7$  представляет собой 5-членный гетероарил, такой как пиррол-1-ил, пиррол-2-ил, пиррол-3-ил, тиен-2-ил, тиен-3-ил, фуран-2-ил, фуран-3-ил, пиразол-1-ил, пиразол-3-ил, пиразол-4-ил, пиразол-5-ил, имидазол-1-ил, имидазол-2-ил, имидазол-4-ил, имидазол-5-ил, оксазол-2-ил, оксазол-4-ил, оксазол-5-ил, изоксазол-3-ил, изоксазол-4-ил, изоксазол-5-ил, тиазол-2-ил, тиазол-4-ил, тиазол-5-ил, изотиазол-3-ил, изотиазол-4-ил, изотиазол-5-ил, 1,2,4-триазилил-1-ил, 1,2,4-триазол-3-ил, 1,2,4-триазол-5-ил, 1,2,4-оксадиазол-3-ил, 1,2,4-оксадиазол-5-ил и 1,2,4-тиадиазол-3-ил, 1,2,4-тиадиазол-5-ил.

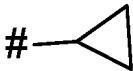
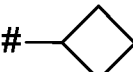
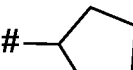
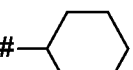
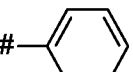
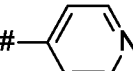
30 В соответствии с ещё одним вариантом осуществления формулы I,  $R^7$  представляет собой 6-членный гетероарил, такой как пиридин-2-ил, пиридин-3-ил, пиридин-4-ил, пиридазин-3-ил, пиридазин-4-ил, пиримидин-2-ил,

пиримидин-4-ил, пиримидин- 5-ил, пиразин-2-ил и 1,3,5-триазин-2-ил и 1,2,4-триазин-3-ил.

В соответствии с ещё одним вариантом осуществления формулы I,  $R^7$  в каждом случае независимо выбран из H, галогена, OH, CN,  $C_1-C_6$ -алкила,  $C_1-C_6$ -галогеналкила,  $C_2-C_6$ -алкенила,  $C_2-C_6$ -алкинила,  $C_1-C_6$ -алкокси,  $C_1-C_6$ -галогеналкокси,  $C_3-C_6$ -алкенилокси,  $C_3-C_6$ -алкинилокси и  $C_3-C_6$ -циклоалкила, где ациклические фрагменты  $R^5$  являются незамещенными или замещены одинаковыми или разными группами  $R^{5a}$ , как определено и предпочтительно определено в данном документе, и где карбоциклические, фенильные и гетероарильные фрагменты  $R^5$  являются незамещенными или замещены одинаковыми или разными группами  $R^{5b}$ , как определено и предпочтительно определено в данном документе.

Особенно предпочтительные варианты осуществления изобретения  $R^7$  в соответствии с изобретением представлены в Таблице P7 ниже, где каждая строка из строк P7-1 - P7-33 соответствует одному конкретному варианту осуществления изобретения, где P7-1 - P7-33 также в любой комбинации друг с другом представляют собой предпочтительный вариант осуществления настоящего изобретения. Точка присоединения к атому углерода, к которому присоединен  $R^7$  отмечена на изображениях знаком "#".

**Таблица P5:**

№	R <sup>5</sup>
P7-1	H
P7-2	CH <sub>3</sub>
P7-3	CH <sub>2</sub> F
P7-4	CHF <sub>2</sub>
P7-5	CF <sub>3</sub>
P7-6	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
P7-7	C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
P7-8	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
P7-9	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
P7-10	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
P7-11	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
P7-12	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>
P7-13	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
P7-14	CH=CH <sub>2</sub>
P7-15	CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>
P7-16	C≡CH
P7-17	CH <sub>2</sub> C≡CH
P7-18	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
P7-19	CN
P7-20	CH <sub>2</sub> CN
P7-21	CH(CH <sub>3</sub> )CN
P7-22	CH(=O)
P7-23	C(=O)CH <sub>3</sub>
P7-24	C(=O)NH-CH <sub>3</sub>
P7-25	C(=O)N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
P7-26	S(=O) <sub>2</sub> -CH <sub>3</sub>
P7-27	# 
P7-28	# 
P7-29	# 
P7-30	# 
P7-31	# 
P7-32	# 
P7-33	OCH <sub>3</sub>

В соответствии с одним из вариантов осуществления соединения формулы I, X в каждом случае независимо выбран из галогена (вариант осуществления X.1), CN, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкила (вариант осуществления X.2), C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-галогеналкила (вариант осуществления X.3), O-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкила (вариант осуществления X.4), O-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-галогеналкила (вариант осуществления X.5).

В соответствии с одним из вариантов осуществления соединения формулы I, X в каждом случае независимо выбран из галогена, O-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкила.

В соответствии с одним из вариантов осуществления соединения формулы I, X в каждом случае независимо выбран из F или Cl.

В соответствии с одним из вариантов осуществления соединения формулы I, n представляет собой 0.

В соответствии с одним из вариантов осуществления соединения формулы I, n представляет собой 1.

В соответствии с одним из вариантов осуществления соединения формулы I, n представляет собой 2.

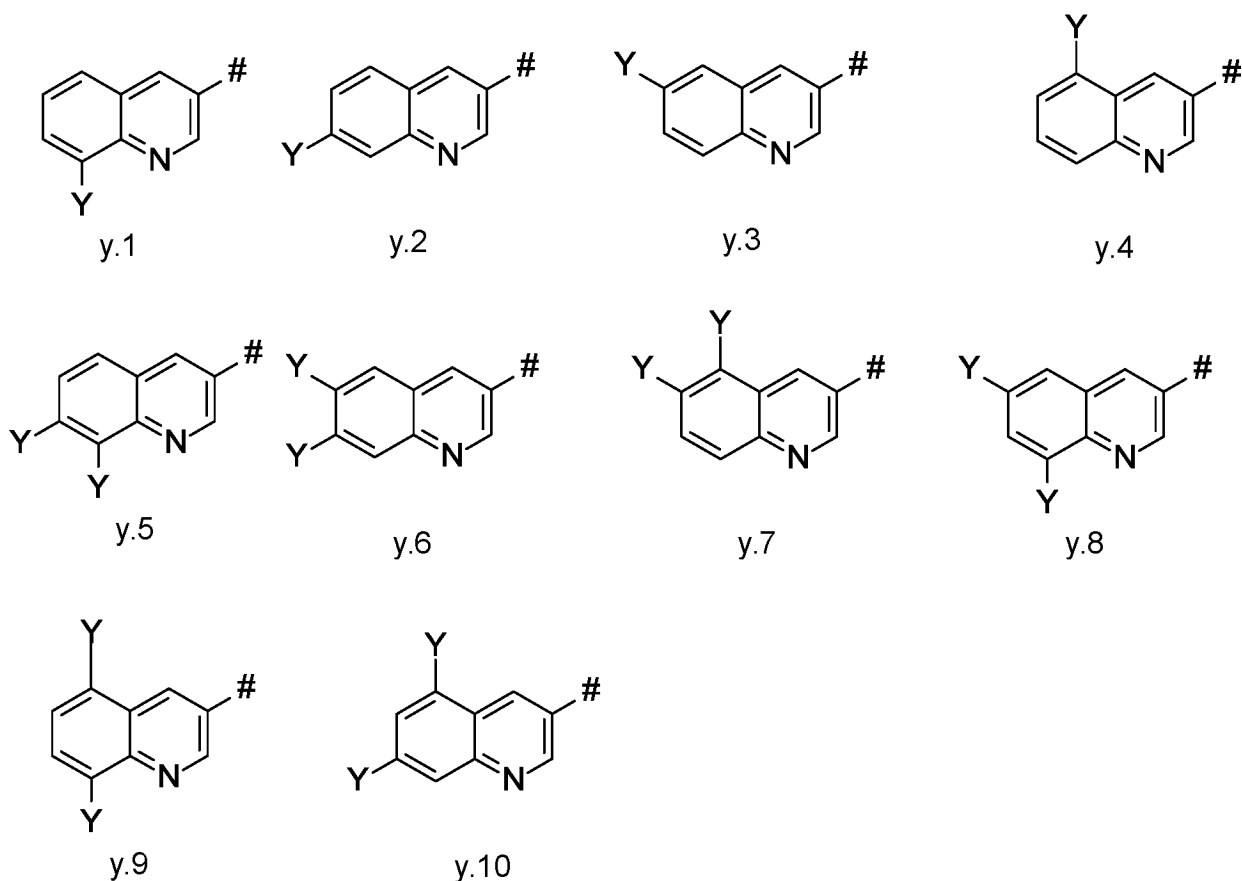
В соответствии с одним из вариантов осуществления соединения формулы I, Y представляет собой H.

В соответствии с одним из вариантов осуществления (вариант осуществления Y.1) соединения формулы I, Y в каждом случае независимо выбран из галогена, CN, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкила, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-галогеналкила, O-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкила.

В соответствии с одним из вариантов осуществления (вариант осуществления Y.2) соединения формулы I, Y в каждом случае независимо выбран из галогена.

В соответствии с одним из вариантов осуществления (вариант осуществления Y.3) соединения формулы I, Y в каждом случае независимо выбран из F1 и Cl.

В соответствии с одним из вариантов осуществления (вариант осуществления Y.4) соединения формулы I, Y определяется в подформулах (y.1 - y.10)



В соответствии с одним из вариантов осуществления соединения формулы I, m представляет собой 1.

5 В соответствии с одним из вариантов осуществления соединения формулы I, m представляет собой 2.

В соответствии с одним из вариантов осуществления, изобретение относится к соединениям формулы I, или к их N-оксидам или приемлемым в сельском хозяйстве солям, где:

$R^1$  представляет собой H;

10  $R^4$  представляет собой H;

$R^5$  в каждом случае независимо выбран из галогена, CN,  $C_2-C_6$ -алкила,  $C_2-C_6$ -галогеналкила,  $C_2-C_6$ -алкенила,  $C_2-C_6$ -галогеналкенила,  $C_2-C_6$ -алкинила,  $C_2-C_6$ -галогеналкинила,  $C_1-C_6$ -алкил-О- $C_1-C_6$ -алкила, фенила, бензила,

15 где фенильные и бензильные фрагменты  $R^5$  являются незамещенными или замещены одной-тремя группами  $R^{5a}$ , которые независимо друг от друга выбраны из:

галогена, CN,  $C_1-C_6$ -алкила,  $C_1-C_6$ -галогеналкила, О- $C_1-C_6$ -алкила;

$R^6$  в каждом случае независимо выбран из галогена, CN,  $C_1-C_6$ -алкила,  $C_1-C_6$ -галогеналкила,  $C_2-C_6$ -алкенила,  $C_2-C_6$ -галогеналкенила,  $C_2-C_6$ -алкинила,  $C_2-C_6$ -галогеналкинила,  $C_1-C_6$ -алкил-О- $C_1-C_6$ -алкила, фенила, бензила,  $C_1-C_6$ -алкил-О-фенила,

5 где фенильные и бензильные фрагменты  $R^6$  являются незамещенными или замещены одной-тремя группами  $R^{6a}$ , которые независимо друг от друга выбраны из:

галогена, CN,  $C_1-C_6$ -алкила,  $C_1-C_6$ -галогеналкила, О- $C_1-C_6$ -алкила;

или

10  $R^5$  и  $R^6$  образуют вместе с С-атомами, к которым они присоединены,  $C_3-C_6$ -циклоалкил или 3- - 6-членный насыщенный гетероцикл, который содержит 1, 2 или 3 гетероатома из группы, состоящей из О и S;

$X$  в каждом случае независимо выбран из галогена, CN,  $C_1-C_6$ -алкила,  $C_1-C_6$ -галогеналкила, О- $C_1-C_6$ -алкила, О- $C_1-C_6$ -галогеналкила;

15  $n$  представляет собой 0, 1, 2 или 3;

$Y$  в каждом случае независимо выбран из галогена, CN,  $C_1-C_6$ -алкила,  $C_1-C_6$ -галогеналкила, О- $C_1-C_6$ -алкила;

$m$  представляет собой 1, 2 или 3.

20 В дополнительных аспектах настоящее изобретение относится к вариантам осуществления Е.1 - Е.280, перечисленным в Таблице Е, которые представляют собой предпочтительные комбинации вариантов осуществления изобретения, которые определены выше для каждой из переменных  $Y$  (представленных вариантами  $Y.1 - Y.4$  и  $y.1 - y.10$ ), и  $X$  (представленных вариантами осуществления  $X.1 - X.6$ ), и  $n$  в соединениях формулы I, как определено ниже.

25

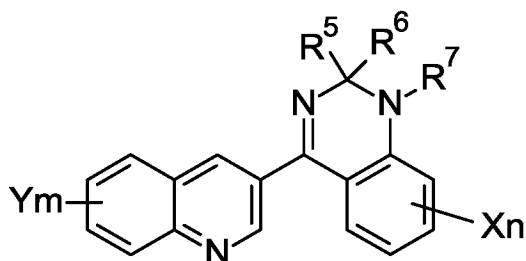


Таблица Е:

<b>Вариант осуществления</b>	<b>X</b>	<b>n</b>	<b>Y</b>
Е.1	(X.1)	0, 1, или 2	Y.1
Е.2	(X.2)	0, 1, или 2	Y.1
Е.3	(X.3)	0, 1, или 2	Y.1
Е.4	(X.4)	0, 1, или 2	Y.1
Е.5	(X.5)	0, 1, или 2	Y.1
Е.6	(X.1)	0, 1, или 2	Y.2
Е.7	(X.2)	0, 1, или 2	Y.2
Е.8	(X.3)	0, 1, или 2	Y.2
Е.9	(X.4)	0, 1, или 2	Y.2
Е.10	(X.5)	0, 1, или 2	Y.2
Е.11	(X.1)	0, 1, или 2	Y.3
Е.12	(X.2)	0, 1, или 2	Y.3
Е.13	(X.3)	0, 1, или 2	Y.3
Е.14	(X.4)	0, 1, или 2	Y.3
Е.15	(X.5)	0, 1, или 2	Y.3
Е.16	(X.1)	0, 1, или 2	Y.4
Е.17	(X.2)	0, 1, или 2	Y.4
Е.18	(X.3)	0, 1, или 2	Y.4
Е.19	(X.4)	0, 1, или 2	Y.4
Е.20	(X.5)	0, 1, или 2	Y.4
Е.21	(X.1)	0, 1, или 2	y.1
Е.22	(X.2)	0, 1, или 2	y.1
Е.23	(X.3)	0, 1, или 2	y.1
Е.24	(X.4)	0, 1, или 2	y.1
Е.25	(X.5)	0, 1, или 2	y.1
Е.26	(X.1)	0, 1, или 2	y.2
Е.27	(X.2)	0, 1, или 2	y.2
Е.28	(X.3)	0, 1, или 2	y.2
Е.29	(X.4)	0, 1, или 2	y.2
Е.30	(X.5)	0, 1, или 2	y.2
Е.31	(X.1)	0, 1, или 2	y.3
Е.32	(X.2)	0, 1, или 2	y.3
Е.33	(X.3)	0, 1, или 2	y.3
Е.34	(X.4)	0, 1, или 2	y.3
Е.35	(X.5)	0, 1, или 2	y.3
Е.36	(X.1)	0, 1, или 2	y.4
Е.37	(X.2)	0, 1, или 2	y.4
Е.38	(X.3)	0, 1, или 2	y.4
Е.39	(X.4)	0, 1, или 2	y.4
Е.40	(X.5)	0, 1, или 2	y.4
Е.41	(X.1)	0, 1, или 2	y.5
Е.42	(X.2)	0, 1, или 2	y.5
Е.43	(X.3)	0, 1, или 2	y.5
Е.44	(X.4)	0, 1, или 2	y.5

<b>Вариант осуществления</b>	<b>X</b>	<b>n</b>	<b>Y</b>
E.45	(X.5)	0, 1, или 2	y.5
E.46	(X.1)	0, 1, или 2	y.6
E.47	(X.2)	0, 1, или 2	y.6
E.48	(X.3)	0, 1, или 2	y.6
E.49	(X.4)	0, 1, или 2	y.6
E.50	(X.5)	0, 1, или 2	y.6
E.51	(X.1)	0, 1, или 2	y.7
E.52	(X.2)	0, 1, или 2	y.7
E.53	(X.3)	0, 1, или 2	y.7
E.54	(X.4)	0, 1, или 2	y.7
E.55	(X.5)	0, 1, или 2	y.7
E.56	(X.1)	0, 1, или 2	y.8
E.57	(X.2)	0, 1, или 2	y.8
E.58	(X.3)	0, 1, или 2	y.8
E.59	(X.4)	0, 1, или 2	y.8
E.60	(X.5)	0, 1, или 2	y.8
E.61	(X.1)	0, 1, или 2	y.9
E.62	(X.2)	0, 1, или 2	y.9
E.63	(X.3)	0, 1, или 2	y.9
E.64	(X.4)	0, 1, или 2	y.9
E.65	(X.5)	0, 1, или 2	y.9
E.66	(X.1)	0, 1, или 2	y.10
E.67	(X.2)	0, 1, или 2	y.10
E.68	(X.3)	0, 1, или 2	y.10
E.69	(X.4)	0, 1, или 2	y.10
E.70	(X.5)	0, 1, или 2	y.10
E.71	(X.1)	0, 1, или 2	Y.1
E.72	(X.2)	0, 1, или 2	Y.1
E.73	(X.3)	0, 1, или 2	Y.1
E.74	(X.4)	0, 1, или 2	Y.1
E.75	(X.5)	0, 1, или 2	Y.1
E.76	(X.1)	0, 1, или 2	Y.2
E.77	(X.2)	0, 1, или 2	Y.2
E.78	(X.3)	0, 1, или 2	Y.2
E.79	(X.4)	0, 1, или 2	Y.2
E.80	(X.5)	0, 1, или 2	Y.2
E.81	(X.1)	0, 1, или 2	Y.3
E.82	(X.2)	0, 1, или 2	Y.3
E.83	(X.3)	0, 1, или 2	Y.3
E.84	(X.4)	0, 1, или 2	Y.3
E.85	(X.5)	0, 1, или 2	Y.3
E.86	(X.1)	0, 1, или 2	Y.4
E.87	(X.2)	0, 1, или 2	Y.4
E.88	(X.3)	0, 1, или 2	Y.4
E.89	(X.4)	0, 1, или 2	Y.4



<b>Вариант осуществления</b>	<b>X</b>	<b>n</b>	<b>Y</b>
E.90	(X.5)	0, 1, или 2	Y.4
E.91	(X.1)	0, 1, или 2	y.1
E.92	(X.2)	0, 1, или 2	y.1
E.93	(X.3)	0, 1, или 2	y.1
E.94	(X.4)	0, 1, или 2	y.1
E.95	(X.5)	0, 1, или 2	y.1
E.96	(X.1)	0, 1, или 2	y.2
E.97	(X.2)	0, 1, или 2	y.2
E.98	(X.3)	0, 1, или 2	y.2
E.99	(X.4)	0, 1, или 2	y.2
E.100	(X.5)	0, 1, или 2	y.2
E.101	(X.1)	0, 1, или 2	y.3
E.102	(X.2)	0, 1, или 2	y.3
E.103	(X.3)	0, 1, или 2	y.3
E.104	(X.4)	0, 1, или 2	y.3
E.105	(X.5)	0, 1, или 2	y.3
E.106	(X.1)	0, 1, или 2	y.4
E.107	(X.2)	0, 1, или 2	y.4
E.108	(X.3)	0, 1, или 2	y.4
E.109	(X.4)	0, 1, или 2	y.4
E.110	(X.5)	0, 1, или 2	y.4
E.111	(X.1)	0, 1, или 2	y.5
E.112	(X.2)	0, 1, или 2	y.5
E.113	(X.3)	0, 1, или 2	y.5
E.114	(X.4)	0, 1, или 2	y.5
E.115	(X.5)	0, 1, или 2	y.5
E.116	(X.1)	0, 1, или 2	y.6
E.117	(X.2)	0, 1, или 2	y.6
E.118	(X.3)	0, 1, или 2	y.6
E.119	(X.4)	0, 1, или 2	y.6
E.120	(X.5)	0, 1, или 2	y.6
E.121	(X.1)	0, 1, или 2	y.7
E.122	(X.2)	0, 1, или 2	y.7
E.123	(X.3)	0, 1, или 2	y.7
E.124	(X.4)	0, 1, или 2	y.7
E.125	(X.5)	0, 1, или 2	y.7
E.126	(X.1)	0, 1, или 2	y.8
E.127	(X.2)	0, 1, или 2	y.8
E.128	(X.3)	0, 1, или 2	y.8
E.129	(X.4)	0, 1, или 2	y.8
E.130	(X.5)	0, 1, или 2	y.8
E.131	(X.1)	0, 1, или 2	y.9
E.132	(X.2)	0, 1, или 2	y.9
E.133	(X.3)	0, 1, или 2	y.9
E.134	(X.4)	0, 1, или 2	y.9

<b>Вариант осуществления</b>	<b>X</b>	<b>n</b>	<b>Y</b>
E.135	(X.5)	0, 1, или 2	y.9
E.136	(X.1)	0, 1, или 2	y.10
E.137	(X.2)	0, 1, или 2	y.10
E.138	(X.3)	0, 1, или 2	y.10
E.139	(X.4)	0, 1, или 2	y.10
E.140	(X.5)	0, 1, или 2	y.10
E.141	(X.1)	0, 1, или 2	Y.1
E.142	(X.2)	0, 1, или 2	Y.1
E.143	(X.3)	0, 1, или 2	Y.1
E.144	(X.4)	0, 1, или 2	Y.1
E.145	(X.5)	0, 1, или 2	Y.1
E.146	(X.1)	0, 1, или 2	Y.2
E.147	(X.2)	0, 1, или 2	Y.2
E.148	(X.3)	0, 1, или 2	Y.2
E.149	(X.4)	0, 1, или 2	Y.2
E.150	(X.5)	0, 1, или 2	Y.2
E.151	(X.1)	0, 1, или 2	Y.3
E.152	(X.2)	0, 1, или 2	Y.3
E.153	(X.3)	0, 1, или 2	Y.3
E.154	(X.4)	0, 1, или 2	Y.3
E.155	(X.5)	0, 1, или 2	Y.3
E.156	(X.1)	0, 1, или 2	Y.4
E.157	(X.2)	0, 1, или 2	Y.4
E.158	(X.3)	0, 1, или 2	Y.4
E.159	(X.4)	0, 1, или 2	Y.4
E.160	(X.5)	0, 1, или 2	Y.4
E.161	(X.1)	0, 1, или 2	y.1
E.162	(X.2)	0, 1, или 2	y.1
E.163	(X.3)	0, 1, или 2	y.1
E.164	(X.4)	0, 1, или 2	y.1
E.165	(X.5)	0, 1, или 2	y.1
E.166	(X.1)	0, 1, или 2	y.2
E.167	(X.2)	0, 1, или 2	y.2
E.168	(X.3)	0, 1, или 2	y.2
E.169	(X.4)	0, 1, или 2	y.2
E.170	(X.5)	0, 1, или 2	y.2
E.171	(X.1)	0, 1, или 2	y.3
E.172	(X.2)	0, 1, или 2	y.3
E.173	(X.3)	0, 1, или 2	y.3
E.174	(X.4)	0, 1, или 2	y.3
E.175	(X.5)	0, 1, или 2	y.3
E.176	(X.1)	0, 1, или 2	y.4
E.177	(X.2)	0, 1, или 2	y.4
E.178	(X.3)	0, 1, или 2	y.4
E.179	(X.4)	0, 1, или 2	y.4

<b>Вариант осуществления</b>	<b>X</b>	<b>n</b>	<b>Y</b>
E.180	(X.5)	0, 1, или 2	y.4
E.181	(X.1)	0, 1, или 2	y.5
E.182	(X.2)	0, 1, или 2	y.5
E.183	(X.3)	0, 1, или 2	y.5
E.184	(X.4)	0, 1, или 2	y.5
E.185	(X.5)	0, 1, или 2	y.5
E.186	(X.1)	0, 1, или 2	y.6
E.187	(X.2)	0, 1, или 2	y.6
E.188	(X.3)	0, 1, или 2	y.6
E.189	(X.4)	0, 1, или 2	y.6
E.190	(X.5)	0, 1, или 2	y.6
E.191	(X.1)	0, 1, или 2	y.7
E.192	(X.2)	0, 1, или 2	y.7
E.193	(X.3)	0, 1, или 2	y.7
E.194	(X.4)	0, 1, или 2	y.7
E.195	(X.5)	0, 1, или 2	y.7
E.196	(X.1)	0, 1, или 2	y.8
E.197	(X.2)	0, 1, или 2	y.8
E.198	(X.3)	0, 1, или 2	y.8
E.199	(X.4)	0, 1, или 2	y.8
E.200	(X.5)	0, 1, или 2	y.8
E.201	(X.1)	0, 1, или 2	y.9
E.202	(X.2)	0, 1, или 2	y.9
E.203	(X.3)	0, 1, или 2	y.9
E.204	(X.4)	0, 1, или 2	y.9
E.205	(X.5)	0, 1, или 2	y.9
E.206	(X.1)	0, 1, или 2	y.10
E.207	(X.2)	0, 1, или 2	y.10
E.208	(X.3)	0, 1, или 2	y.10
E.209	(X.4)	0, 1, или 2	y.10
E.210	(X.5)	0, 1, или 2	y.10
E.211	(X.1)	0, 1, или 2	Y.1
E.212	(X.2)	0, 1, или 2	Y.1
E.213	(X.3)	0, 1, или 2	Y.1
E.214	(X.4)	0, 1, или 2	Y.1
E.215	(X.5)	0, 1, или 2	Y.1
E.216	(X.1)	0, 1, или 2	Y.2
E.217	(X.2)	0, 1, или 2	Y.2
E.218	(X.3)	0, 1, или 2	Y.2
E.219	(X.4)	0, 1, или 2	Y.2
E.220	(X.5)	0, 1, или 2	Y.2
E.221	(X.1)	0, 1, или 2	Y.3
E.222	(X.2)	0, 1, или 2	Y.3
E.223	(X.3)	0, 1, или 2	Y.3
E.224	(X.4)	0, 1, или 2	Y.3

<b>Вариант осуществления</b>	<b>X</b>	<b>n</b>	<b>Y</b>
E.225	(X.5)	0, 1, или 2	Y.3
E.226	(X.1)	0, 1, или 2	Y.4
E.227	(X.2)	0, 1, или 2	Y.4
E.228	(X.3)	0, 1, или 2	Y.4
E.229	(X.4)	0, 1, или 2	Y.4
E.230	(X.5)	0, 1, или 2	Y.4
E.231	(X.1)	0, 1, или 2	y.1
E.232	(X.2)	0, 1, или 2	y.1
E.233	(X.3)	0, 1, или 2	y.1
E.234	(X.4)	0, 1, или 2	y.1
E.235	(X.5)	0, 1, или 2	y.1
E.236	(X.1)	0, 1, или 2	y.2
E.237	(X.2)	0, 1, или 2	y.2
E.238	(X.3)	0, 1, или 2	y.2
E.239	(X.4)	0, 1, или 2	y.2
E.240	(X.5)	0, 1, или 2	y.2
E.241	(X.1)	0, 1, или 2	y.3
E.242	(X.2)	0, 1, или 2	y.3
E.243	(X.3)	0, 1, или 2	y.3
E.244	(X.4)	0, 1, или 2	y.3
E.245	(X.5)	0, 1, или 2	y.3
E.246	(X.1)	0, 1, или 2	y.4
E.247	(X.2)	0, 1, или 2	y.4
E.248	(X.3)	0, 1, или 2	y.4
E.249	(X.4)	0, 1, или 2	y.4
E.250	(X.5)	0, 1, или 2	y.4
E.251	(X.1)	0, 1, или 2	y.5
E.252	(X.2)	0, 1, или 2	y.5
E.253	(X.3)	0, 1, или 2	y.5
E.254	(X.4)	0, 1, или 2	y.5
E.255	(X.5)	0, 1, или 2	y.5
E.256	(X.1)	0, 1, или 2	y.6
E.257	(X.2)	0, 1, или 2	y.6
E.258	(X.3)	0, 1, или 2	y.6
E.259	(X.4)	0, 1, или 2	y.6
E.260	(X.5)	0, 1, или 2	y.6
E.261	(X.1)	0, 1, или 2	y.7
E.262	(X.2)	0, 1, или 2	y.7
E.263	(X.3)	0, 1, или 2	y.7
E.264	(X.4)	0, 1, или 2	y.7
E.265	(X.5)	0, 1, или 2	y.7
E.266	(X.1)	0, 1, или 2	y.8
E.267	(X.2)	0, 1, или 2	y.8
E.268	(X.3)	0, 1, или 2	y.8
E.269	(X.4)	0, 1, или 2	y.8

Вариант осуществления	X	n	Y
E.270	(X.5)	0, 1, или 2	y.8
E.271	(X.1)	0, 1, или 2	y.9
E.272	(X.2)	0, 1, или 2	y.9
E.273	(X.3)	0, 1, или 2	y.9
E.274	(X.4)	0, 1, или 2	y.9
E.275	(X.5)	0, 1, или 2	y.9
E.276	(X.1)	0, 1, или 2	y.10
E.277	(X.2)	0, 1, или 2	y.10
E.278	(X.3)	0, 1, или 2	y.10
E.279	(X.4)	0, 1, или 2	y.10
E.280	(X.5)	0, 1, или 2	y.10

В дополнительных аспектах настоящее изобретение относится к вариантам осуществления E.1 – E.280, перечисленным в Таблице E, где R<sup>5</sup> представлен вариантом осуществления 5.1, и R<sup>6</sup> представлен вариантом осуществления 6.1.

5 В дополнительных аспектах настоящее изобретение относится к вариантам осуществления E.1 – E.280, перечисленным в Таблице E, где R<sup>5</sup> представлен вариантом осуществления 5.2, и R<sup>6</sup> представлен вариантом осуществления 6.1.

10 В дополнительных аспектах настоящее изобретение относится к вариантам осуществления E.1 – E.280, перечисленным в Таблице E, где R<sup>5</sup> представлен вариантом осуществления 5.3, и R<sup>6</sup> представлен вариантом осуществления 6.1.

В дополнительных аспектах настоящее изобретение относится к вариантам осуществления E.1 – E.280, перечисленным в Таблице E, где R<sup>5</sup> представлен вариантом осуществления 5.4, и R<sup>6</sup> представлен вариантом осуществления 6.1.

15 В дополнительных аспектах настоящее изобретение относится к вариантам осуществления E.1 – E.280, перечисленным в Таблице E, где R<sup>5</sup> представлен вариантом осуществления 5.5, и R<sup>6</sup> представлен вариантом осуществления 6.1.

В дополнительных аспектах настоящее изобретение относится к вариантам осуществления E.1 – E.280, перечисленным в Таблице E, где R<sup>5</sup> представлен вариантом осуществления 5.1, и R<sup>6</sup> представлен вариантом осуществления 6.2.

20 В дополнительных аспектах настоящее изобретение относится к вариантам осуществления E.1 – E.280, перечисленным в Таблице E, где R<sup>5</sup> представлен вариантом осуществления 5.2, и R<sup>6</sup> представлен вариантом осуществления 6.2.



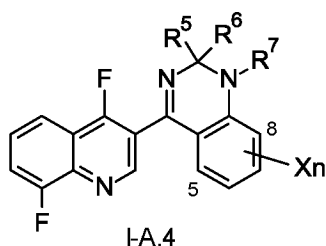
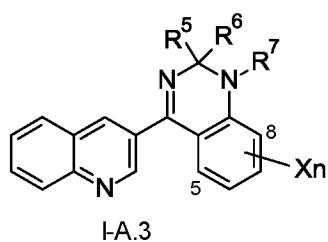
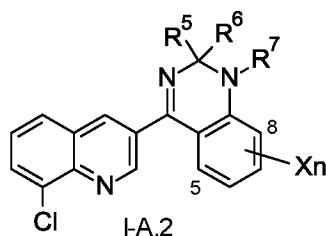
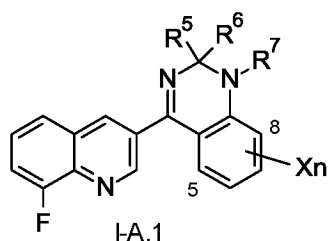
В дополнительных аспектах настоящее изобретение относится к вариантам осуществления E.1 – E.280, перечисленным в Таблице E, где R<sup>5</sup> представлен вариантом осуществления 5.4, и R<sup>6</sup> представлен вариантом осуществления 6.4.

5 В дополнительных аспектах настоящее изобретение относится к вариантам осуществления E.1 – E.280, перечисленным в Таблице E, где R<sup>5</sup> представлен вариантом осуществления 5.5, и R<sup>6</sup> представлен вариантом осуществления 6.4.

В дополнительных аспектах настоящее изобретение относится к вариантам осуществления E.1 – E.280, перечисленным в Таблице E, где R<sup>5</sup> и R<sup>6</sup> представлены вариантом осуществления 6.5.

10 В дополнительных аспектах настоящее изобретение относится к вариантам осуществления E.1 – E.280, перечисленным в Таблице E, где R<sup>5</sup> и R<sup>6</sup> представлены вариантом осуществления 6.6.

Предпочтительными вариантами осуществления настоящего изобретения являются следующие соединения I.A-1, I.A-2, I.A-3, I.A-4. В этих формулах, заместители R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup> и X<sub>n</sub> независимо имеют значения, указанные выше, или предпочтительно определены в данном документе:



20 В особенности, с точки зрения их применения, в соответствии с одним из вариантов осуществления предпочтение отдается соединениям I.A-1, I.A-2, I.A-3, I.A-4; которые собраны в Таблицах 1a–7a. Кроме того, каждая из групп, указанных для заместителя в таблицах, сама по себе, независимо от комбинации, в которой она указана, представляет собой особенно предпочтительный аспект

25 рассматриваемого заместителя.

Таблица 1а Соединения формулы I.A-1, I.A-2, I.A-3, I.A-4, в которых Xп представляет собой H, и значение для комбинации R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup> и R<sup>7</sup> для каждого отдельного соединения соответствует в каждом случае одной строке Таблицы В (соединения I.A-1.1а.В-1 – I.A-1.1а.В-100, I.A-2.1а.В-1 – I.A-2.1а.В-100, I.A-3.1а.В-1 – I.A-3.1а.В-100, I.A-4.1а.В-1 – I.A-4.1а.В-100).

Таблица 2а Соединения формулы I.A-1, I.A-2, I.A-3, I.A-4; в которых Xп представляет собой 8-F, и значение для комбинации R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup> и R<sup>7</sup> для каждого отдельного соединения соответствует в каждом случае одной строке Таблицы В (соединения I.A-1.2а.В-1 – I.A-1.2а.В-100, I.A-2.2а.В-1 – I.A-2.2а.В-100, I.A-3.2а.В-1 – I.A-3.2а.В-100, I.A-4.2а.В-1 – I.A-4.2а.В-100).

Таблица 3а Соединения формулы I.A-1, I.A-2, I.A-3, I.A-4; в которых Xп представляет собой 8-Cl, и значение для комбинации R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup> и R<sup>7</sup> для каждого отдельного соединения соответствует в каждом случае одной строке Таблицы В (соединения I.A-1.3а.В-1 – I.A-1.3а.В-100, I.A-2.3а.В-1 – I.A-2.3а.В-100, I.A-3.3а.В-1 – I.A-3.3а.В-100, I.A-4.3а.В-1 – I.A-4.3а.В-100).

Таблица 4а Соединения формулы I.A-1, I.A-2, I.A-3, I.A-4; в которых Xп представляет собой 8-CH<sub>3</sub>, и значение для комбинации R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup> и R<sup>7</sup> для каждого отдельного соединения соответствует в каждом случае одной строке Таблицы В (соединения I.A-1.4а.В-1 – I.A-1.4а.В-100, I.A-2.4а.В-1 – I.A-2.4а.В-100, I.A-3.4а.В-1 – I.A-3.4а.В-100, I.A-4.4а.В-1 – I.A-4.4а.В-100).

Таблица 5а Соединения формулы I.A-1, I.A-2, I.A-3, I.A-4; в которых Xп представляет собой 7,8-F<sub>2</sub>, и значение для комбинации R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup> и R<sup>7</sup> для каждого отдельного соединения соответствует в каждом случае одной строке Таблицы В (соединения I.A-1.5а.В-1 – I.A-1.5а.В-100, I.A-2.5а.В-1 – I.A-2.5а.В-100, I.A-3.5а.В-1 – I.A-3.5а.В-100, I.A-4.5а.В-1 – I.A-4.5а.В-100).

Таблица 6а Соединения формулы I.A-1, I.A-2, I.A-3, I.A-4; в которых Xп представляет собой 8-OCH<sub>3</sub>, и значение для комбинации R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup> и R<sup>7</sup> для каждого отдельного соединения соответствует в каждом случае одной строке Таблицы В (соединения I.A-1.6а.В-1 – I.A-1.6а.В-100, I.A-2.6а.В-1 – I.A-2.6а.В-100, I.A-3.6а.В-1 – I.A-3.6а.В-100, I.A-4.6а.В-1 – I.A-45.6а.В-100).

Таблица 7а Соединения формулы I.A-1, I.A-2, I.A-3, I.A-4; в которых Xп представляет собой 7-F-8-OCH<sub>3</sub>, и значение для комбинации R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup> и R<sup>7</sup> для каждого отдельного соединения соответствует в каждом случае одной строке



Таблицы В (соединения I.A-1.7a.B-1 – I.A-1.7a.B-100, I.A-2.7a.B-1 – I.A-2.7a.B-100, I.A-3.7a.B-1 – I.A-3.7a.B-100, I.A-4.7a.B-1 – I.A-4.7a.B-100).

Таблица В

№	R <sup>7</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>
B-1	H	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
B-2	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
B-3	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
B-4	CN	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
B-5	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
B-6	CH <sub>2</sub> CN	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
B-7	CHO	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
B-8	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
B-9	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
B-10	CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
B-11	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>3</sub>
B-12	CH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>3</sub>
B-13	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>3</sub>
B-14	CN	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>3</sub>
B-15	OCH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>3</sub>
B-16	CH <sub>2</sub> CN	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>3</sub>
B-17	CHO	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>3</sub>
B-18	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>3</sub>
B-19	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>3</sub>
B-20	CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>3</sub>
B-21	H	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
B-22	CH <sub>3</sub>	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
B-23	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
B-24	CN	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
B-25	OCH <sub>3</sub>	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
B-26	CH <sub>2</sub> CN	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
B-27	CHO	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
B-28	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
B-29	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
B-30	CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
B-31	H	CH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
B-32	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
B-33	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
B-34	CN	CH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
B-35	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
B-36	CH <sub>2</sub> CN	CH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
B-37	CHO	CH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
B-38	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
B-39	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
B-40	CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
B-41	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
B-42	CH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
B-43	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>

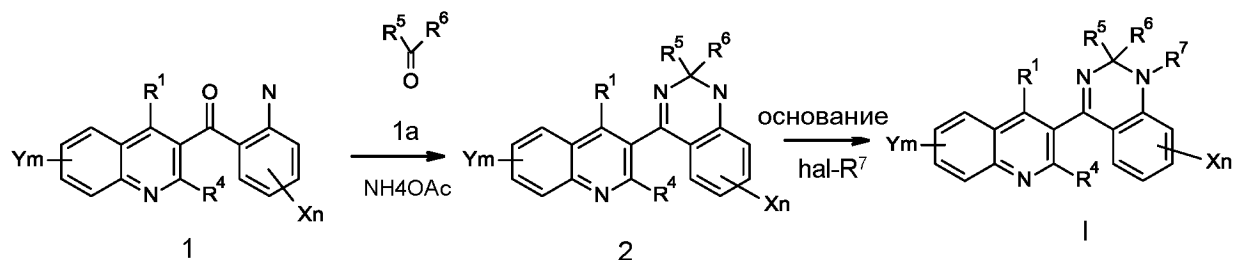
№	R <sup>7</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>
B-44	CN	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
B-45	OCH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
B-46	CH <sub>2</sub> CN	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
B-47	CHO	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
B-48	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
B-49	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
B-50	CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
B-51	H	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
B-52	CH <sub>3</sub>	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
B-53	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
B-54	CN	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
B-55	OCH <sub>3</sub>	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
B-56	CH <sub>2</sub> CN	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
B-57	CHO	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
B-58	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
B-59	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
B-60	CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
B-61	H	CH <sub>3</sub>	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>
B-62	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>
B-63	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>3</sub>	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>
B-64	CN	CH <sub>3</sub>	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>
B-65	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>
B-66	CH <sub>2</sub> CN	CH <sub>3</sub>	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>
B-67	CHO	CH <sub>3</sub>	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>
B-68	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>
B-69	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>
B-70	CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>
B-71	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>
B-72	CH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>
B-73	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>
B-74	CN	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>
B-75	OCH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>
B-76	CH <sub>2</sub> CN	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>
B-77	CHO	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>
B-78	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>
B-79	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>
B-80	CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>
B-81	H	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>
B-82	CH <sub>3</sub>	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>
B-83	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>
B-84	CN	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>
B-85	OCH <sub>3</sub>	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>
B-86	CH <sub>2</sub> CN	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>
B-87	CHO	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>
B-88	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>
B-89	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>
B-90	CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>

№	R <sup>7</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>
B-91	H	-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -	
B-92	CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -	
B-93	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -	
B-94	CN	-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -	
B-95	OCH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -	
B-96	CH <sub>2</sub> CN	-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -	
B-97	CHO	-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -	
B-98	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -	
B-99	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -	
B-100	CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -	

Соединения настоящего изобретения могут быть получены, как показано на следующих схемах, в которых, если не указано иначе, определение каждой переменной такое, как определено выше для соединения формулы I. Соединения формулы I могут быть получены в соответствии со способами или по аналогии со способами, которые описаны в уровне техники. В синтезе используются исходные вещества, которые являются коммерчески доступными или могут быть получены в соответствии с традиционными методиками, исходя из легкодоступных соединений.

Например, образование соединения I из соединения формулы 2 подходящим образом проводят путем алкилирования или ацилирования в присутствии основания, такого как низший алкоксид или гидрид калия или натрия. Динизшие алкилсульфаты также можно использовать для осуществления указанного алкилирования или ацилирования, как описано в патенте US 3,625,959.

Циклические соединения формулы 2 могут быть получены из кетоаминного соединения 1 путем реакции с кетоном или альдегидом формулы 1a в присутствии ацетата аммония. В некоторых случаях присутствие такой кислоты, как п-толуолсульфокислота (p-TsOH), п-толуолсульфонат пиридиния, серная кислота или уксусная кислота, повышает выходы (прецеденты см., например, в Chemistry Select (2018), 3(32), 9388- 9392 и Organic & Biomolecular Chemistry (2003), 1(2), 367-372).

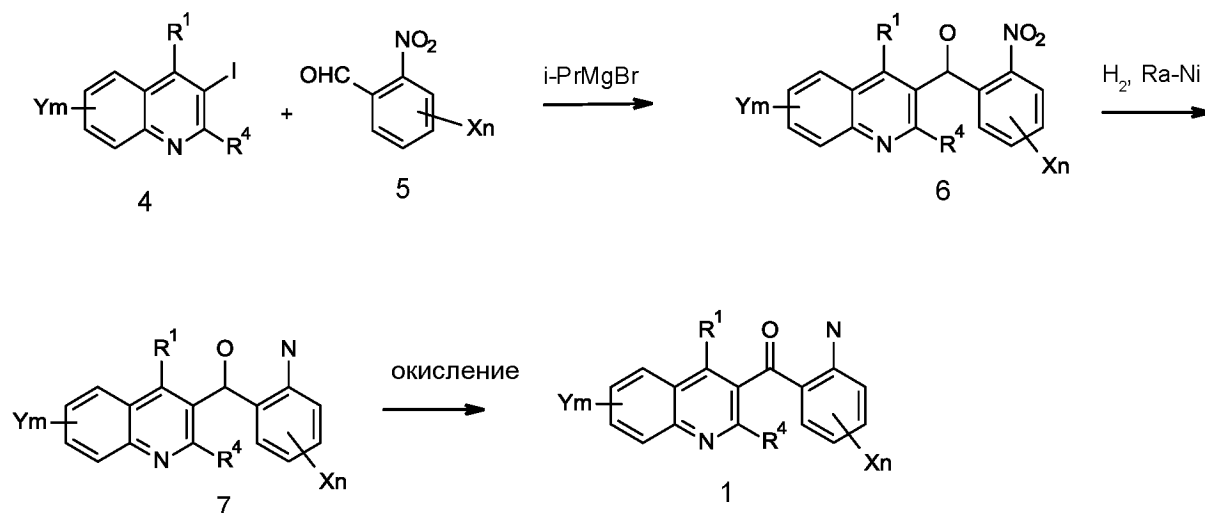


Соединения 1 являются коммерчески доступными или могут быть получены по общему пути, описанному на следующей схеме 1, путем окисления аминспирта 7 с использованием, например, диоксида марганца, как описано в *Inorganica Chimica Acta* (2012), 382, 72-78, WO2000038618, CN107879989 A, Chinese Science Bulletin (2010), 55(25), 2817-2819.

Соединения формулы 7 могут быть получены посредством каталитического гидрирования соответствующего нитроспирта 6 с использованием никеля RNEY®, как описано в WO2000038618, *Inorganica Chimica Acta* (2012), 382, 72-78.

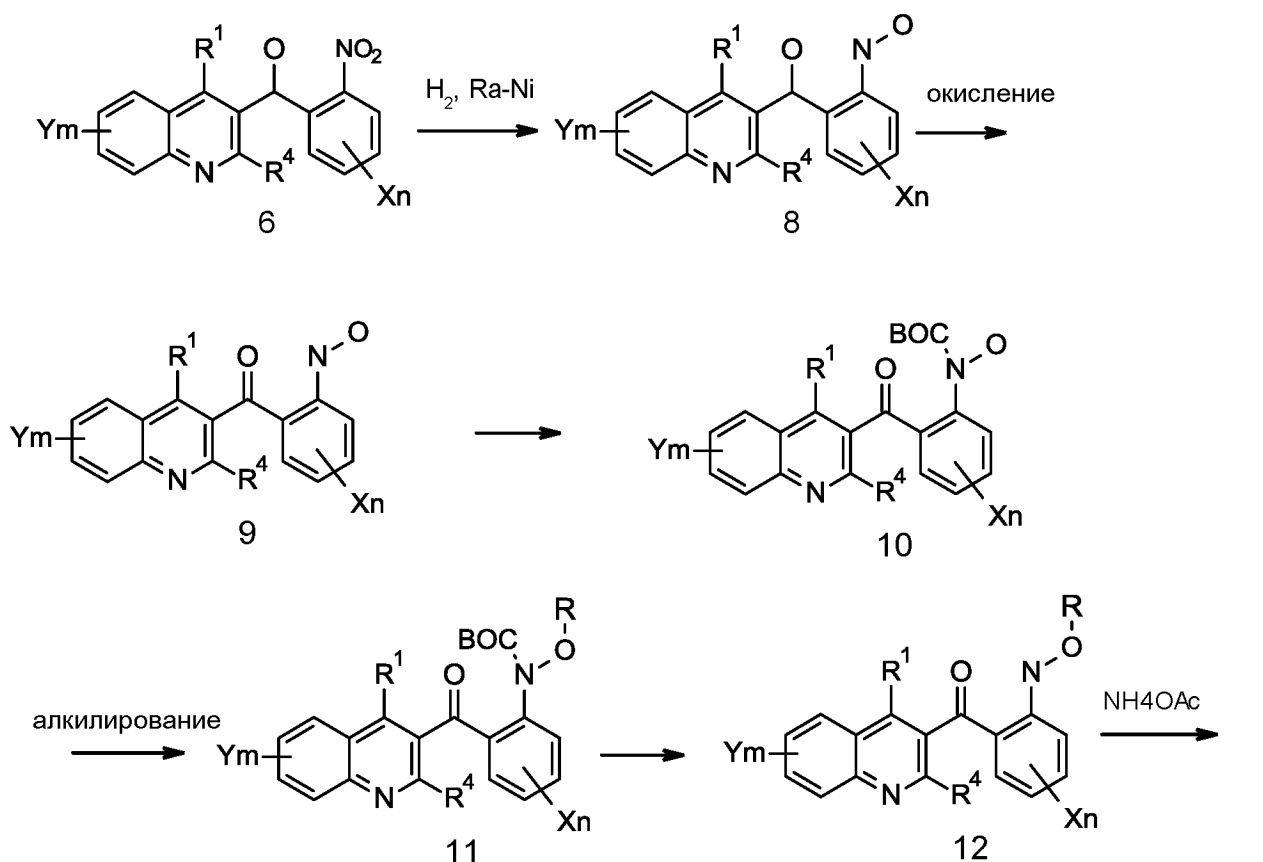
2-Нитроспирт 6 может быть получен из соединения 4 путем йод-магниевого обмена, опосредованного изопропилфенилмагниибромидом, как описано Кночел и соавторами (*Angew. Chem., Int. Ed.*, 2002, 41, 1610), и последующего добавления к коммерчески доступному производному нитробензальдегида 5.

#### Схема 1



Соединения формулы I, где R<sup>7</sup> представляет собой алкокси, можно получить из соединения 6 следующим путем синтеза, который характеризуется селективным каталитическим гидрированием нитроспирта 6 до соответствующих N-арилгидроксиламинов 8 с использованием пассивированного никеля RNEY®, который обрабатывали объединенной

жидкостью водного аммиака и ДМСО, как описано в RSC Advances (2020), 28585-28594, или с использованием платины на угле (тип F 103 RS/W от Degussa), как описано в IN1996CH00112.



5 Соединения формулы 9 могут быть получены путем окисления гидроксиламинового спирта 8 с использованием, например, диоксида марганца, как описано в Inorganica Chimica Acta (2012), 382, 72-78 и в WO2000038618.

10 Защищенный гидроксилмин 10 можно получить методами, хорошо известными в литературе для аминозащитных групп, как описано в Theodora W. Greene's book "Protective Groups in Organic Synthesis", например N-Бос, с использованием ди-трет-бутилдикарбоната в подходящем растворителе, таком как ДМСО.

15 Соединения 10 можно алкилировать с использованием стандартных оснований, таких как LDA, NaH или NaHMDS, для депротонирования гидроксилмина с последующим добавлением алкилирующего агента с подходящей уходящей группой, как например, галогенид, мезилат или трифлат, в подходящем растворителе для получения соединений 11 (прецеденты см. Например, в CN207973751).

Защитную группу N-Вос можно удалить любым количеством способов, хорошо известных в литературе, таких как ТФУ в метилхлориде, с получением соединения 12 (прецеденты см., например, в WO2000038618).

5 Наконец, соединения I, где R<sup>7</sup> представляет собой алкокси, могут быть получены из соединения 12 путем обработки с помощью NH<sub>4</sub>OAc, как описано в Chemistry Select (2018), 3(32), 9388-9392 и Organic & Biomolecular Chemistry (2003), 1(2), 367-372.

10 Соединения I и их композиции, соответственно, являются пригодными в качестве фунгицидов, эффективных против широкого спектра фитопатогенных грибов, включая почвенные грибы, в частности из классов Plasmodiophoromycetes, Peronosporomycetes (син. Oomycetes), Chytridiomycetes, Zygomycetes, Ascomycetes, Basidiomycetes, и Deuteromycetes (син. Fungi imperfecti). Их можно использовать для защиты растений в качестве  
15 внекорневых фунгицидов, фунгицидов для протравливания семян и почвенных фунгицидов.

Соединения I и их композиции являются предпочтительно пригодными для борьбы с фитопатогенными грибами на различных выращиваемых растениях, таких как зерновые культуры, например, пшеница, рожь, ячмень, тритикале, овёс или рис; свёкла, например, сахарная свёкла или кормовая свёкла; фруктовые  
20 растения, например, семечковые (яблони, груши и т.д.), косточковые (например, сливы, персики, миндаль, вишни) и ягодные плоды, также называемые ягодами (клубника, малина, ежевика, крыжовник и т. д.); бобовые растения, например, чечевица, горох, люцерна или соевые бобы; масличные растения, такие как, масличный рапс, горчица, оливы, подсолнечник, кокосовый орех, бобы какао,  
25 клещевина, пальмы масличные, земляные орехи или соевые бобы; тыквенные, например, тыква крупноплодная, огурцы или дыни; волокнистые растения, например, хлопчатник, лен, конопля или джут; цитрусовые плоды, например, апельсины, лимоны, грейпфруты или мандарины; овощные растения, например, шпинат, салат-латук, спаржа, капустные растения, морковь, лук, томаты,  
30 картофель, тыква или стручковый перец; лавровые растения, например, авокадо, корица или камфора; энергетические и сырьевые растения, например, кукуруза, соя, масличный рапс, сахарный тростник или пальма масличная; кукуруза; табак; орехи; кофе; чай; бананы; виноград (столовый виноград и для сока, винный виноград); хмель; дерн; сладкая трава (также называемая стевией); растения

природного каучука или декоративные и лесные растения, например цветы, кустарники, лиственные деревья или вечнозеленые растения (хвойные деревья, эвкалипты и т. д.); на материале для размножения растений, таком как, семена; и на сельскохозяйственном материале этих растений.

5 Более предпочтительно соединения I и соответственно их композиции применяют для борьбы с грибами на полевых культурах, таких как, картофель, сахарная свёкла, табак, пшеница, рожь, ячмень, овес, рис, кукуруза, хлопчатник, соя, масличный рапс, бобовые, подсолнечник, кофе или сахарный тростник; плодовых культурах, виноградных лозах; декоративных растениях;  
10 или овощных культурах, таких как, огурцы, томаты, бобы или тыква крупноплодная.

Термин «материал для размножения растений» следует понимать, как означающий все генеративные части растения, такие как, семена и вегетативные части растений, такие как черенки и клубни (например, картофель), которые  
15 могут быть использованы для размножения растения. К ним относят семена, корни, плоды, клубни, луковицы, корневища, побеги и другие части растений, включая саженцы и молодые растения, которые необходимо после прорастания или всхода пересаживают.

Предпочтительно обработку материала для размножения растений соединениями I и соответственно их композициями используют для борьбы с грибами на зерновых культурах, таких как пшеница, рожь, ячмень и овес; рис, кукуруза, хлопчатник и соевые бобы.

В соответствии с изобретением все вышеперечисленные культурные растения понимаются как включающие все виды, подвиды, варианты, сорта  
25 и/или гибриды, которые принадлежат соответствующим культурным растениям, включая, но не ограничиваясь ими, озимые и яровые сорта, в особенности зерновые культуры, такие как пшеница и ячмень, а также масличный рапс, например, озимая пшеница, яровая пшеница, озимый ячмень и т.д.

Кукуруза также известна как индийская кукуруза или маис (*Zea mays*),  
30 которая включает в себя все виды кукурузы, такие как полевая кукуруза и сахарная кукуруза. В соответствии с изобретением все подвиды и/или сорта маиса или кукурузы включают, в частности, кукурузу мучнистую (*Zea mays var. amylacea*), кукурузу лопающуюся (*Zea mays var. everta*), кукурузу зубовидную (*Zea mays var. indentata*), кукурузу кремнистую (*Zea mays var. indurata*),

сахарную кукурузу (*Zea mays* var. *saccharata* и var. *Rugosa*), восковидную кукурузу (*Zea mays* var. *ceratina*), амиломаис (сорта *Zea mays* с высоким содержанием амилозы), кукурузу чешуйчатую или дикую кукурузу (*Zea mays* var. *tunicata*) и кукурузу полосатую (*Zea mays* var. *japonica*).

5            Большинство сортов сои можно разделить на индетерминантный и детерминантный тип роста, тогда как *Glycine soja*, дикий прародитель сои, является индетерминантным (PNAS 2010, 107 (19) 8563-856). Индетерминантный тип роста (Группа спелости, MG 00 - MG 4,9) характеризуется продолжением вегетативного роста после начала цветения, тогда как детерминированные сорта сои (MG 5–MG 8) обычно заканчивают большую часть своего вегетативного  
10 роста к моменту начала цветения. В соответствии с изобретением включены все культивары или сорта сои, в частности индетерминантные и детерминантные культивары или сорта.

             Термин «культурные растения» следует понимать как включающий  
15 растения, которые были модифицированы путем мутагенеза или генной инженерии, чтобы придать растению новый признак или модифицировать уже существующий признак. Мутагенез включает методы случайного мутагенеза с использованием рентгеновских или мутагенных химических веществ, а также методы направленного мутагенеза для создания мутаций в определенном локусе  
20 генома растения. В направленном мутагенезе часто используют олигонуклеотиды или белки, такие как CRISPR/Cas, нуклеазы с цинковыми пальцами, TALEN или мегануклеазы. В генной инженерии обычно используют методы рекомбинантной ДНК для создания модификаций в геноме растений, которые в естественных условиях не могут быть легко получены путем  
25 скрещивания, мутагенеза или естественной рекомбинации. Как правило, один или несколько генов интегрированы в геном растения, чтобы добавить признак, или улучшить или модифицировать признак. Эти интегрированные гены также называют трансгенами, при этом растения, содержащие такие трансгены, называют трансгенными растениями. Процесс трансформации растений обычно  
30 приводит к нескольким трансформационным событиям, которые отличаются геномным локусом, в который интегрирован трансген. Растения, содержащие конкретный трансген в определенном геномном локусе, обычно описаны как включающие конкретное «событие», которое известно под конкретным названием события. Признаки, которые были введены в растения или



модифицированы, включают, в частности, устойчивость к гербицидам, устойчивость к насекомым, повышенную урожайность и устойчивость к абиотическим условиям, таким как засуха.

Устойчивость к гербицидам была создана с помощью мутагенеза и генетической инженерии. Растениями, которым с помощью методов мутагенеза и селекции придали устойчивости к гербицидам-ингибиторам ацетолактатсинтазы (ALS), являются, например, растения, доступные под названием Clearfield®. За счет использования трансгенов была создана гербицидная устойчивость к глифосату, глюфосинату, 2,4-D, дикамба, оксиниловым гербицидам, таким как бромоксинил и иоксинил, гербицидам сульфонилмочевины, гербицидам-ингибиторам ALS и ингибиторам 4-гидроксифенилпируватдиоксигеназы (HPPD), таким как изоксафлутол и мезотрион.

Трансгены для обеспечения признаков устойчивости к гербицидам, включают: для устойчивости к глифосату: *cp4 epsps*, *epsps grg23ace5*, *mepps*, *2mepps*, *gat4601*, *gat4621* и *goxv247*, для устойчивости к глюфосинату: *pat* и *bar*, для устойчивости к 2,4-D: *aad-1* и *aad-12*, для устойчивости к дикамба: *dmo*, для устойчивости к оксиниловым гербицидам: *bxp*, для устойчивости к гербицидам сульфонилмочевины: *zm-hra*, *csr1-2*, *gm-hra*, *S4-HrA*, для устойчивости к гербицидам-ингибиторам ALS: *csr1-2*, для устойчивости к гербицидам-ингибиторам HPPD: *hppdPF*, *W336* и *avhppd-03*

События трансгенной кукурузы, содержащие гены устойчивости к гербицидам, представляют собой, например, но не ограничены ими, DAS40278, MON801, MON802, MON809, MON810, MON832, MON87411, MON87419, MON87427, MON88017, MON89034, NK603, GA21, MZHG0JG, HCEM485, VCO-Ø1981-5, 676, 678, 680, 33121, 4114, 59122, 98140, Bt10, Bt176, СВН-351, DBT418, DLL25, MS3, MS6, MZIR098, T25, TC1507 и TC6275. События трансгенных соевых бобов, содержащие гены устойчивости к гербицидам, представляют собой, например, но не ограничены ими, GTS 40-3-2, MON87705, MON87708, MON87712, MON87769, MON89788, A2704-12, A2704-21, A5547-127, A5547-35, DP356043, DAS44406-6, DAS68416-4, DAS-81419-2, GU262, СYHTØН2, W62, W98, FG72 и CV127. События трансгенного хлопчатника, содержащие гены устойчивости к гербицидам, представляют собой, например, но не ограничены ими, 19-51a, 31707, 42317, 81910, 281-24-236, 3006-210-23,

BXN10211, BXN10215, BXN10222, BXN10224, MON1445, MON1698, MON88701, MON88913, GHB119, GHB614, LLCotton25, T303-3 и T304-40. События трансгенной канолы, содержащие гены устойчивости к гербицидам, представляют собой, например, но не ограничены ими, MON88302, HCR-1, HCN10, HCN28, HCN92, MS1, MS8, PHY14, PHY23, PHY35, PHY36, RF1, RF2 и RF3.

Трансгенами для обеспечения устойчивости к насекомым предпочтительно являются гены токсинов *Bacillus* spp. и их синтетические варианты, такие как cry1A, cry1Ab, cry1Ab-Ас, cry1Ac, cry1A.105, cry1F, cry1Fa2, cry2Ab2, cry2Ae, mcry3A, ecry3.1Ab, cry3Bb1, cry34Ab1, cry35Ab1, cry9C, vip3A(a), vip3Aa20. Кроме того, также можно использовать трансгены растительного происхождения, такие как гены, кодирующие ингибиторы протеаз, такие как CrPI и pinII. В другом подходе используют трансгены, такие как dvsnf7, для получения двуцепочечной РНК в растениях.

События трансгенной кукурузы, содержащие гены инсектицидных белков или двуцепочечной РНК, включают, например, но не ограничены ими, Bt10, Bt11, Bt176, MON801, MON802, MON809, MON810, MON863, MON87411, MON88017, MON89034, 33121, 4114, 5307, 59122, TC1507, TC6275, СВН-351, MIR162, DBT418 и MZIR098. События трансгенных соевых бобов, содержащие гены инсектицидных белков, включают, но не ограничены ими, MON87701, MON87751 и DAS-81419. События трансгенного хлопчатника, содержащие гены инсектицидных белков включают, но не ограничены ими, SGK321, MON531, MON757, MON1076, MON15985, 31707, 31803, 31807, 31808, 42317, BNLA-601, Event1, COT67B, COT102, T303-3, T304-40, GFM Cry1A, GK12, MLS 9124, 281-24-236, 3006-210-23, GHB119 и SGK321.

Культурные растения с повышенной урожайностью были созданы с использованием трансгена *athb17* (например, событие кукурузы MON87403) или *bbx32* (например, событие сои MON87712).

Культурные растения с модифицированным содержанием масла были созданы с использованием трансгенов: *gm-fad2-1*, Pj.D6D, Nc.Fad3, *fad2-1A* и *fatb1-A* (например, события сои 260-05, MON87705 и MON87769).

Толерантность к абиотическим условиям, таким как засуха, была создана с помощью трансгена *cspB* (событие кукурузы MON87460) и *Нahb-4* (событие сои IND-00410-5).

Признаки часто сочетают путем комбинирования генов в трансформационном событии или путем комбинирования различных событий в процессе размножения. Предпочтительной комбинацией признаков является гербицидная устойчивость к разным группам гербицидов, устойчивость к различным видам насекомых, в частности, устойчивость к чешуекрылым и жесткокрылым насекомым, гербицидная устойчивость с одним или несколькими типами устойчивости к насекомым, гербицидная устойчивость вместе с повышенным урожаем, а также комбинация гербицидной устойчивости и устойчивости к абиотическим условиям.

10 Растения, обладающие сингулярными или пирамидированными друг на друга признаками, а также гены и события, обеспечивающие эти признаки, хорошо известны в данной области. Например, подробная информация о мутагенизированных или интегрированных генах и соответствующих событиях доступна на веб-сайтах организаций «International Service for the Acquisition of Agri-biotech Applications (ISAAA)» (<http://www.isaaa.org/gmaprovaldatabase>) и «Center for Environmental Risk Assessment (CERA)» (<http://cera-gmc.org/GMCropDatabase>). Дополнительную информацию о конкретных событиях и способах их обнаружения можно найти для событий канолы MS1, MS8, RF3, GT73, MON88302, KK179 в WO01/031042, WO01/041558, WO01/041558, WO02/036831, WO11/153186, WO13/003558, для событий хлопчатника MON1445, MON15985, MON531 (MON15985), LLCotton25, MON88913, COT102, 281-24-236, 3006-210-23, COT67B, GH614, T304-40, GH619, MON88701, 81910 в WO02/034946, WO02/100163, WO02/100163, WO03/013224, WO04/072235, WO04/039986, WO05/103266, WO05/103266, WO06/128573, WO07/017186, WO08/122406, WO08/151000, WO12/134808, WO13/112527; для событий кукурузы GA21, MON810, DLL25, TC1507, MON863, MIR604, LY038, MON88017, 3272, 59122, NK603, MIR162, MON89034, 98140, 32138, MON87460, 5307, 4114, MON87427, DAS40278, MON87411, 33121, MON87403, MON87419 в WO98/044140, US02/102582, US03/126634, WO04/099447, WO04/011601, WO05/103301, WO05/061720, WO05/059103, WO06/098952, WO06/039376, US2007/292854, WO07/142840, WO07/140256, WO08/112019, WO09/103049, WO09/111263, WO10/077816, WO11/084621, WO11/062904, WO11/022469, WO13/169923, WO14/116854, WO15/053998, WO15/142571; для событий картофеля E12, F10, J3, J55, V11, X17, Y9 в

WO14/100910, WO14/100913, WO14/100941, WO14/179276, WO16/183445, WO17/062831, WO17/062825; для событий риса LLRICE06, LLRICE601, LLRICE62 в WO00/026345, WO00/026356, WO00/026345; и для событий соевых бобов H7-1, MON89788, A2704-12, A5547-127, DP305423, DP356043, MON87701, MON87769, CV127, MON87705, DAS68416-4, MON87708, MON87712, SYHT0H2, DAS81419, DAS81419 x DAS44406-6, MON87751 в WO04/074492, WO06/130436, WO06/108674, WO06/108675, WO08/054747, WO08/002872, WO09/064652, WO09/102873, WO10/080829, WO10/037016, WO11/066384, WO11/034704, WO12/051199, WO12/082548, WO13/016527, WO13/016516, WO14/201235.

10            Применение соединений I и, соответственно, их композиций на культурных растениях может приводить к эффектам, специфичным для культурного растения, содержащего определенный трансген или событие. Эти эффекты могут включать изменения в поведении роста или изменение устойчивости к факторам биотического или абиотического стресса. Такие эффекты могут, в частности, включать в себя повышенную урожайность, повышенную устойчивость или толерантность к насекомым, нематодам, грибковым, бактериальным, микоплазменным, вирусным или вириодным патогенам, а также раннюю силу, раннее или замедленное созревание, устойчивость к холоду или жаре, а также измененный спектр или содержание аминокислот или жирных кислот.

20            Соединения I и, соответственно, их композиции в особенности пригодны для борьбы со следующими возбудителями заболеваний растений:

              виды *Albugo* (белая ржавчина) на декоративных растениях, овощных культурах (например, *A. candida*) и подсолнечнике (например, *A. tragopogonis*); виды *Alternaria* (альтернариозная пятнистость листьев) на овощных культурах, рапсе (*A. brassicola* или *brassicae*), сахарной свекле (*A. tenuis*), плодах, рисе, соевых бобах, картофеле (например, *A. solani* или *A. alternata*), томатах (например, *A. solani* или *A. alternata*) и пшенице; виды *Aphanomyces* на сахарной свекле и овощных культурах; виды *Ascochyta* на зерновых и овощных культурах, например, *A. tritici* (антракноз) на пшенице и *A. hordei* на ячмене; виды *Bipolaris* и *Drechslera* (телеоморф: виды *Cochliobolus*), например, глазковая пятнистость листьев кукурузы (например, *D. maydis*), или гельминтоспориоз листьев (*B. zeicola*) на кукурузе, например, гельминтоспориозная корневая гниль (*B. sorokiniana*) на зерновых и, например, *B. oryzae* на рисе и дернине; *Blumeria* (ранее *Erysiphe*) *graminis* (настоящая мучнистая роса) на зерновых (например, на

пшенице или ячмене); *Botrytis cinerea* (телеоморф: *Botryotinia fuckeliana*: серая плесень) на плодах и ягодах (например, клубнике), овощных культурах (например, латуке, моркови, сельдерее и капусте), рапсе, цветах, виноградных лозах, лесных культурах и пшенице; *Bremia lactucae* (ложная мучнистая роса) на латуке; виды *Ceratocystis* (син. *Ophiostoma*) (гниль или увядание) на лиственных и вечнозеленых деревьях, например, *C. ulmi* (голландская болезнь ильмовых пород) на вязах; *Cercospora* виды (церкоспоровая пятнистость листьев) на кукурузе (например, серая пятнистость листьев: *C. zeae-maydis*), рисе, сахарной свекле (например, *C. beticola*), сахарном тростнике, овощных культурах, кофе, соевых бобах (например, *C. sojae* или *C. kikuchii*) и рисе; *Cladobotryum* (син. *Dactylium*) виды (например, *C. mycophilum* (ранее *Dactylium dendroides*, телеоморф: *Nectria albertinii*, *Nectria rosella* син. *Hymenysces rosellus*) на грибах; *Cladosporium* виды на томатах (например, *C. fulvum*: плесень листьев) и зерновых, например, *C. herbarum* (оливковая плесень) на пшенице; *Claviceps purpurea* (спорынья) на зерновых; виды *Cochliobolus* (анаморф: *Helminthosporium* от *Bipolaris*) (пятнистость листьев) на кукурузе (*C. carbonum*), зерновых (например, *C. sativus*, анаморф: *B. sorokiniana*) и рисе (например, *C. miyabeanus*, анаморф: *H. oryzae*); виды *Colletotrichum* (телеоморф: *Glomerella*) (антракноз) на хлопчатнике (например, *C. gossypii*), кукурузе (например, *C. graminicola*: антракноз гниль стебля), ягодах, картофеле (например, *C. coccoodes*: антракноз картофеля и томатов), бобах (например, *C. lindemuthianum*) и соевых бобах (например, виды *C. truncatum* или *C. gloeosporioides*); *Corticium*, например, *C. sasakii* (ризоктониоз стеблей и влагалищ) на рисе; *Corynespora cassiicola* (черная пятнистость) на соевых бобах и декоративных растениях; виды *Cyclospium*, например, *C. oleaginum* на оливковых деревьях; виды *Cylindrocarpum* (например, некроз плодовых деревьев или виноградной лозы, телеоморф: *Nectria* или *Neonectria* виды) на плодовых деревьях, виноградных лозах (например, *C. liriodendri*, телеоморф: *Neonectria liriodendri*: заболевание черная ножка) и декоративных растениях; *Dematophora necatrix* (телеоморф: *Rosellinia*) (корневая и стеблевая гниль) на соевых бобах; виды *Diaporthe*, например, *D. phaseolorum* (черная ножка) на соевых бобах; виды *Drechslera* (син. *Helminthosporium*, телеоморф: *Puccinophora*) на кукурузе, зерновых, таких как ячмене (например, *D. teres*, сетчатая пятнистость) и пшенице (например, *D. tritici-repentis*: пиренофороз), рисе и дёрне; *Esca* (отмирание, апоплексия) на виноградных

лозах, вызванное *Formitiporia* (син. *Phellinus*) *punctata*, *F. mediterranea*,  
*Phaeomoniella chlamydospora* (ранее *Phaeoacremonium chlamydosporum*),  
*Phaeoacremonium aleophilum* и/или *Botryosphaeria obtusa*; виды *Elsinoe* на  
 семечковых плодах (*E. pyri*), ягодных (*E. veneta*: антракноз) и виноградных лозах  
 5 (*E. ampelina*: антракноз); *Entyloma ogyzae* (головня листьев) на рисе; *Ericossum*  
 виды (черная плесень) на пшенице; виды *Erysiphe* (настоящая мучнистая роса)  
 на сахарной свекле (*E. betae*), овощных культурах (например, *E. pisi*), таких как  
 тыквенные (например, *E. cichoracearum*), капусте, рапсе (например, *E.*  
*cruciferarum*); *Eutypa lata* (эутипоз, рак или отмирание, анорморф: *Cytosporina lata*,  
 10 син. *Libertella blepharis*) на плодовых деревьях, виноградных лозах и  
 декоративных кустарниках; виды *Exserohilum* (син. *Helminthosporium*) на  
 кукурузе (например, *E. turcicum*); виды *Fusarium* (телеоморф: *Gibberella*)  
 (увядание, корневая или стеблевая гниль) на различных растениях, такие как *F.*  
*graminaeum* или *F. culmorum* (корневая гниль, парша или фузариоз) на зерновых  
 15 (например, пшенице или ячмене), *F. oxysporum* на томатах, *F. solani* (ранее вид  
 глицины сейчас син. *F. virguliforme*) и *F. tucumaniae* и *F. brasiliense* каждый  
 вызывающий синдром внезапной гибели на соевых бобах, и *F. verticillioides* на  
 кукурузе; *Gaeumannomyces graminis* (выпревание) на зерновых (например,  
 пшенице или ячмене) и кукурузе; *Gibberella* виды на зерновых (например, *G.*  
 20 *zeae*) и рисе (например, *G. fujikuroi*: болезнь Баканае); *Glomerella cingulata* на  
 виноградных лозах, семечковых плодах и других растениях и *G. gossypii* на  
 хлопчатнике; комплекс окрашивания зерна на рисе; *Guignardia bidwellii* (черная  
 гниль) на виноградных лозах; виды *Gymnosporangium* на розоцветных растениях  
 и можжевельных, например, *G. sabinae* (ржавчина) на грушах; *Helminthosporium*  
 25 виды (син. *Drechslera*, телеоморф: *Cochliobolus*) на кукурузе, зерновых,  
 картофеле и рисе; *Hemileia* виды, например, *H. vastatrix* (ржавчина кофейных  
 листьев) на кофе; *Isariopsis clavispora* (син. *Cladosporium vitis*) на виноградных  
 лозах; *Macrophomina phaseolina* (син. *phaseoli*) (корневая и стеблевая гниль) на  
 соевых бобах и хлопчатнике; *Microdochium* (син. *Fusarium*) *nivale* (розовая  
 30 снежная плесень) на зерновых (например, пшенице или ячмене); *Microsphaera*  
*diffusa* (настоящая мучнистая роса) на соевых бобах; *Monilinia* виды, например,  
*M. laxa*, *M. fructicola* и *M. fructigena* (син. *Monilia* виды: сухость цветков и  
 кончиков листьев, бурая гниль) на косточковых плодах и других розоцветных  
 растениях; виды *Mycosphaerella* на зерновых, бананах, ягодных и земляном

орехе, такие как, например, *M. graminicola* (анаморф: *Septoria tritici*, септориозная пятнистость) на пшенице или *M. fijiensis* (болезнь черная Сигатока) и *M. musicola* на бананах, *M. arachidicola* (син. *M. arachidis* или *Cercospora arachidis*), *M. berkeleyi* на земляном орехе, *M. pisi* на горохе и *M.*

5 *brassicicola* на *brassica*; *Peronospora* виды (ложная мучнистая роса) на капусте (например, *P. brassicae*), масличном рапсе (например, *P. parasitica*), луковичных растениях (например, *P. destructor*), табаке (*P. tabacina*) и соевых бобах (например, *P. manshurica*); *Phakopsora pachyrhizi* и *P. meibomia* (ржавчина соевых бобов) на соевых бобах; виды *Phialophora*, например, на виноградных

10 лозах (например, *P. tracheiphila* и *P. tetraspora*) и соевых бобах (например, *P. gregata*: стеблевая гниль); *Phoma lingam* (корневая и стеблевая гниль) на рапсе и капусте, *P. betae* (корневая гниль, черная пятнистость и черная ножка) на сахарной свекле; виды *Phomopsis* на подсолнечнике, виноградных лозах (например, *P. viticola*: черная пятнистость) и соевых бобах (например, стеблевая

15 гниль: *P. phaseoli*, телеоморф: *Diaporthe phaseolorum*); *Physoderma maydis* (бурая пятнистость) на кукурузе; виды *Phytophthora* (увядание, гниль корня, листьев, плодов и стебля) на различных растениях, таких как паприка и тыквенные (например, *P. capsici*), соевых бобах (например, *P. megasperma*, син. *P. sojae*), картофеле и томатах (например, *P. infestans*: фитофтороз) и деревьях лиственных

20 пород (например, *P. ramorum*: внезапная гибель дуба); *Plasmodiophora brassicae* (кила) на капусте, рапсе, редисе и других растениях; виды *Plasmopora*, например, *P. viticola* (ложная мучнистая роса виноградной лозы) на виноградных лозах и *P. halstedii* на подсолнечнике; виды *Podosphaera* (настоящая мучнистая роса) на розоцветных растениях, хмеле, семечковых плодах и ягодных, например, *P.*

25 *leucotricha* на яблонях; виды *Polymyxa*, например, на зерновых, таких как ячмене и пшенице (*P. graminis*) и сахарной свекле (*P. betae*) и перенесенные вследствие этого вирусные заболевания; *Pseudocercospora herpotrichoides* (глазковая пятнистость, телеоморф: *Tapesia yallundae*) на зерновых, например, пшенице или ячмене; *Pseudoperonospora* (ложная мучнистая роса) на различных растениях,

30 например, *P. cubensis* на тыквенных или *P. humili* на хмеле; *Pseudopezizicola tracheiphila* (краснуха листьев винограда или «краснуха листьев», анаморф: *Phialophora*) на виноградных лозах; виды *Russinia* (ржавчина) на различных растениях, например, *P. triticina* (бурая или листовая ржавчина), *P. striiformis* (полосатость или желтая ржавчина), *P. hordei* (карликовая ржавчина), *P. graminis*

(стеблевая или черная ржавчина) или *P. recondita* (бурая или листовая ржавчина) на зерновых, таких как, например, пшенице, ячмене или ржи, *P. kuehni* (оранжевая ржавчина) на сахарном тростнике и *P. asparagi* на спарже; виды *Puccinopeltis*, например, *P. brassicae* на масличном рапсе; *Puccinophora* (анаморф: *Drechslera*) *tritici-repentis* (пиренофороз) на пшенице или *P. teres* (сетчатая пятнистость) на ячмене; виды *Puccinularia*, например, *P. oryzae* (телеоморф: *Magnaporthe grisea*: пирикулярриоз риса) на рисе и *P. grisea* на дерне и зерновых; виды *Pythium* (черная ножка) на дерне, рисе, кукурузе, пшенице, хлопчатнике, рапсе, подсолнечнике, соевых бобах, сахарной свекле, овощных культурах и других растениях (например, *P. ultimum* или *P. aphanidermatum*) и *P. oligandrum* на грибах; виды *Ramularia*, например, *R. collo-cygni* (рамуляриозная черная пятнистость, физиологическая черная пятнистость) на ячмене, и *R. beticola* на сахарной свекле; виды *Rhizoctonia* на хлопчатнике, рисе, картофеле, дерне, кукурузе, рапсе, томатах, сахарной свекле, овощных культурах и других различных растениях, например, *R. solani* (корневая и стеблевая гниль) на соевых бобах, *R. solani* (ризоктониоз стеблей и влагалищ) на рисе или *R. cerealis* (ризоктониоз) на пшенице или ячмене; *Rhizopus stolonifer* (черная плесень, мягкая гниль) на клубнике, моркови, капусте, виноградных лозах и томатах; *Rhynchosporium secalis*, и *R. commune* (ринхоспорозный ожог) на ячмене, ржи и тритикале; *Sarocladium oryzae* и *S. attenuatum* (гниль влагалищ) на рисе; виды *Sclerotinia* (стеблевая гниль или белая гниль) на овощных культурах и полевых культурах, таких как рапсе, подсолнечнике (например, *S. sclerotiorum*) и соевых бобах, *S. rolfsii* (син. *Athelia rolfsii*) на соевых бобах, земляном орехе, кукурузе, зерновых и декоративных растениях; виды *Septoria* на различных растениях, например, *S. glycines* (бурая пятнистость) на соевых бобах, *S. tritici* (син. *Zymoseptoria tritici*, септориозная пятнистость) на пшенице и *S. nodorum* (син. *Stagonospora*) (стагоноспорная пятнистость) на зерновых; *Uncinula necator* (син. *Erysiphe*) (настоящая мучнистая роса, анаморф: *Oidium tuckeri*) на виноградных лозах; виды *Setosphaeria* (пятнистость листьев) на кукурузе (например, *S. turcicum*, син. *Helminthosporium turcicum*) и дерне; виды *Sphaelotheca* (головня) на кукурузе, (например, *S. reiliana*, син. *Ustilago reiliana*: вонючая головня), сорго и сахарном тростнике; *Sphaerothera fuliginea* (син. *Podosphaera xanthii*: настоящая мучнистая роса) на тыквенных; *Spongospora subterranea* (порошистая парша) на картофеле и перенесенные вследствие этого вирусные заболевания;



виды *Stagonospora* на зерновых, например, *S. nodorum* (стагоноспорная пятнистость, телеоморф: *Leptosphaeria* [син. *Phaeosphaeria*] *nodorum*, син. *Septoria nodorum*) на пшенице; *Synchytrium endobioticum* на картофеле (рак картофеля); виды *Tarphrina*, например, *T. deformans* (курчавость листьев) на персиках и *T. pruni* (кармашки сливы) на сливах; виды *Thielaviopsis* (черная корневая гниль) на табаке, семечковых плодах, овощных культурах, соевых бобах и хлопчатнике, например, *T. basicola* (син. *Chalara elegans*); виды *Tilletia* (твердая или вонючая головня) на зерновых, такие как, например, *T. tritici* (син. *T. caries*, твердая головня пшеницы) и *T. controversa* (карликовая головня) на пшенице; *Trichoderma harzianum* на грибах; *Typhula incarnata* (серая снежная плесень) на ячмене или пшенице; виды *Urocystis*, например, *U. occulta* (стеблевая головня) на ржи; виды *Uromyces* (ржавчина) на овощных культурах, таких как бобы (например, *U. appendiculatus*, син. *U. phaseoli*), сахарная свекла (например, *U. betae* или *U. beticola*) на бобовых культурах (например, *U. vignae*, *U. pisi*, *U. viciae-fabae* и *U. fabae*); виды *Ustilago* (пыльная головня) на зерновых (например, *U. nuda* и *U. avenae*), кукурузе (например, *U. maydis*: пузырчатая головня) и сахарном тростнике; виды *Venturia* (парша) на яблонях (например, *V. inaequalis*) и грушах; и виды *Verticillium* (увядание) на различных растениях, таких как плодовые и декоративные растения, виноградных лозах, ягодных, овощных культурах и полевых культурах, например, *V. longisporum* на масличном рапсе, *V. dahliae* на клубнике, масличном рапсе, картофеле и томатах, и *V. fungicola* на грибах; *Zymoseptoria tritici* на зерновых.

Соединения I и их композиции, соответственно, являются особенно пригодными для борьбы со следующими возбудителями болезней растений:

ржавчина соевых бобов и злаков (например, *Phakopsora pachyrhizi* и *P. meibomia* на сое; *Puccinia tritici* и *P. striiformis* на пшенице); плесени на культурах специального назначения, сое, рапсе и подсолнечнике (например, *Botrytis cinerea* на клубнике и винограде, *Sclerotinia sclerotiorum*, *S. minor* и *S. rolfsii* на рапсе, подсолнечнике и сое); фузариозные заболевания зерновых культур (например, *Fusarium culmorum* и *F. graminearum* пшеницы); ложная мучнистая роса на культурах специального назначения (например, *Plasmopara viticola* на винограде, *Phytophthora infestans* на картофеле); мучнистая роса на культурах специального назначения и злаках (например, *Uncinula necator* на виноградных лозах, виды *Erysiphe* на различных культурах специального

назначения, *Blumeria graminis* на зерновых); и пятнистость листьев на зерновых, сое и кукурузе (например, *Septoria tritici* и *S. nodorum* на зерновых, *S. glycines* на сое, *Cercospora* spp. на кукурузе и сое).

5 Соединения I и, соответственно, их композиции также пригодны для борьбы с вредными микроорганизмами при защите хранящихся продуктов или урожая и для защиты материалов.

10 Термин «хранящиеся продукты или урожай» следует понимать как природные вещества растительного или животного происхождения и их обработанные формы, которым необходима долгосрочная защита. Хранящиеся продукты растительного происхождения, например, стебли, листья, клубни, семена, плоды или зерна, можно подвергать защите в свежесобранном состоянии или в обработанном виде, как например, предварительно подсушенными, увлажненными, измельченными, размолотыми, спрессованными или поджаренными, такой процесс также известен как послеуборочная обработка.

15 Также под термин хранящихся продуктов подпадает лесоматериал, или в виде сырого лесоматериала, такого как строительный лесоматериал, электрические столбы и шлагбаумы, так и в виде готовых изделий, таких как мебель или предметы, сделанные из древесины. Хранящимися продуктами животного происхождения являются кожевенное сырье, кожа, мех, шерсть и т.п..

20 Предпочтительно «хранящиеся продукты» представляют собой природные вещества растительного происхождения и их обработанные формы, более предпочтительно плоды и их обработанные формы, такие как семечковые, косточковые, мягкие фрукты и цитрусовые фрукты, и их обработанные формы, где применение соединений I и их композиций также может предотвратить  
25 неблагоприятные эффекты, такие как гниение, обесцвечивание или плесень.

Под термином «защита материалов» следует понимать защиту технических и неживых материалов, таких как, например, клеящие вещества, клеи, древесина, бумага и картон, текстильные изделия, кожа, дисперсии для окрашивания, синтетические материалы, смазочно-охлаждающие жидкости, волокна и ткани,  
30 от заражения и разрушения вредными микроорганизмами, такими как грибы и бактерии.

При использовании для защиты материалов или продуктов хранения количество применимого активного вещества зависит от вида области применения и желаемого эффекта. Количества, обычно применяемые для защиты

материалов, составляют от 0,001 г до 2 кг, предпочтительно от 0,005 г до 1 кг активного вещества на кубический метр обрабатываемого материала.

Соединения I и, соответственно, их композиции можно применять для улучшения жизнеспособности растения. Изобретение также относится к способу  
5 улучшения жизнеспособности растения посредством обработки растения, его материала для размножения и/или места, где растение растет или должно расти, эффективным количеством соединений I и, соответственно, их композиций.

Понятие «жизнеспособность растения» следует понимать как состояние растения и/или его продуктов, которое определяется различными индикаторами  
10 отдельно или в комбинации друг с другом, такими как, например, урожайность (например, увеличенная биомасса и/или повышенное содержание ценных компонентов), сила растения (например, улучшенный рост растения и/или более зеленые листья («эффект позеленения»)), качество (например, повышенное содержание или состав определенных компонентов) и устойчивость к  
15 абиотическому и/или биотическому стрессу. Приведенные выше индикаторы для одного состояния жизнеспособности растения могут быть взаимозависимыми или могут быть следствием друг друга.

Соединения I применяют как таковые или в виде композиций путем обработки грибов или подлежащих защите от поражения грибами растений,  
20 растительных материалов для размножения, таких как семена, почвы, поверхностей, материалов или помещений фунгицидно эффективным количеством активных веществ. Применение можно осуществлять как перед, так и после инфицирования грибами растений, материалов для размножения растений, таких как, семена, почвы, поверхностей, материалов или помещений.

Агрохимическая композиция содержит фунгицидно эффективное количество соединения I. Термин «фунгицидно эффективное количество»  
25 означает количество композиции или соединений I, которое является достаточным для борьбы с вредными грибами на культивируемых растениях или для защиты хранящихся продуктов, урожая или материалов, и которое не  
30 приводит к существенному повреждению обработанных растений, обработанных хранящихся продуктов или урожая, или обработанных материалов. Такое количество может варьироваться в широком диапазоне и зависит от различных факторов, таких как виды грибов, подлежащие борьбе, обрабатываемое

культурное растение, хранимый продукт, урожай или материал, климатические условия и конкретное используемое соединение I.

5 Материалы для размножения растений можно обрабатывать соединениями I как таковыми или композицией, содержащей по меньшей мере одно соединение I, профилактически либо во время, либо перед посадкой или пересадкой.

При применении для защиты растений количества вносимых действующих веществ составляют, в зависимости от желаемого эффекта, от 0,001 до 2 кг/га, предпочтительно от 0,005 до 2 кг/га, более предпочтительно от 0,05 до 0,9 кг/га и в особенности от 0,1 до 0,75 кг/га.

10 При обработке материалов для размножения растений, таких как семена, например, путем опудривания, нанесения покрытия или пропитки, количества активного вещества обычно составляют от 0,1 до 1000 г, предпочтительно от 1 до 1000 г, более предпочтительно от 1 до 100 г и наиболее предпочтительно от 5 до 100 г на 100 кг материала для размножения растений (предпочтительно  
15 семян).

Пользователь наносит агрохимическую композицию обычно из устройства предварительного дозирования, ранцевого опрыскивателя, опрыскивателя, распылителя или ирригационной системы. Как правило, агрохимическую композицию готовят из воды, буфера и/или дополнительных вспомогательных  
20 веществ до желаемой концентрации применения, и таким образом получают готовый к использованию раствор для опрыскивания или агрохимическую композицию в соответствии с изобретением. Как правило, на гектар сельскохозяйственной полезной площади используют от 20 до 2000 литров, предпочтительно от 50 до 400 литров готового к употреблению раствора для  
25 опрыскивания.

Соединения I, их N-оксиды и соли могут быть превращены в обычные типы агрохимических композиций, например, растворы, эмульсии, суспензии, тонкие порошки, порошки, пасты, гранулы, спрессованные продукты, капсулы и их смеси. Примерами типов композиций (см. также “Catalogue of pesticide  
30 formulation types and international coding system”, Technical Monograph No. 2, 6<sup>th</sup> Ed. May 2008, CropLife International) являются суспензии (например, SC, OD, FS), эмульгируемые концентраты (например, EC), эмульсии (например, EW, EO, ES, ME), капсулы (например, CS, ZC), пасты, пастилки, смачиваемые порошки или тонкие порошки (например, WP, SP, WS, DP, DS), спрессованные продукты

(например, BR, TB, DT), гранулы (например, WG, SG, GR, FG, GG, MG), инсектицидные изделия (например, LN), а также гелевые составы для обработки материалов для размножения растений, таких как семена (например, GF).

Композиции получают известным образом, как описано у Mollet and Grube-mann, 5 Formulation technology, Wiley VCH, Weinheim, 2001; или Knowles, New developments in crop protection product formulation, Agrow Reports DS243, T&F Informa, Лондон, 2005. Изобретение также относится к агрохимическим композициям, содержащим вспомогательное вещество и по меньшей мере одно соединение I.

10 Пригодными вспомогательными веществами являются растворители, жидкие носители, твердые носители или наполнители, поверхностно-активные вещества, диспергаторы, эмульгаторы, смачивающие агенты, адъюванты, солюбилизаторы, вещества, способствующие проникновению, защитные коллоиды, вещества улучшающие адгезию, загустители, увлажнители, 15 репелленты, аттрактанты, стимуляторы поедания, улучшающие совместимость агенты, бактерициды, антифризы, антивспениватели, красители, вещества для повышения клейкости и связующие вещества.

Пригодными растворителями и жидкими носителями являются вода и органические растворители, такие как фракции минеральных масел от средней 20 до высокой точек кипения, такие как керосин, дизельное масло; масла растительного или животного происхождения, алифатические, циклические и ароматические углеводороды, например, толуол, парафин, тетрагидронафталин, алкилированные нафталины; спирты, например, этанол, пропанол, бутанол, бензиловый спирт, циклогексанол; гликоли; ДМСО; кетоны, например, 25 циклогексанон; сложные эфиры, например, лактаты, карбонаты, сложные эфиры жирной кислоты, гамма-бутиролактон; жирные кислоты; фосфонаты; амины; амиды, например, N-метилпирролидон, диметиламиды жирных кислот; и их смеси.

Пригодные твердые носители или наполнители представляют собой 30 минеральные земли, например, силикаты, силикагели, тальк, каолины, известняк, известь, мел, глины, доломит, диатомовую землю, бентонит, сульфат кальция, сульфат магния, оксид магния; полисахаридные порошки, например, целлюлозу, крахмал; удобрения, например, сульфат аммония, фосфат аммония, нитрат аммония, мочевины; продукты растительного происхождения, такие как

мука зерновых культур, мука древесной коры, древесная мука, мука ореховой скорлупы и их смеси.

Пригодными поверхностно-активными веществами являются поверхностно-активные соединения, такие как анионные, катионные, неионогенные и амфотерные поверхностно-активные вещества, блок-полимеры, полиэлектролиты и их смеси. Такие поверхностно-активные вещества можно применять в качестве эмульгатора, диспергатора, солюбилизатора, смачивающего агента, вещества, способствующего проникновению, защитного коллоида или адъюванта. Примеры поверхностно-активных веществ приведены в McCutcheon's, том 1: Emulsifiers & Detergents, McCutcheon's Directories, Glen Rock, США, 2008 (Международное изд. или Североамериканское изд.).

Пригодными анионными поверхностно-активными веществами являются щелочные, щелочноземельные или аммониевые соли сульфонатов, сульфатов, фосфатов, карбоксилатов и их смеси. Примерами сульфонатов являются алкиларилсульфонаты, дифенилсульфонаты, альфа-олефиновые сульфаты, лигнинсульфонаты, сульфаты кислот жирного ряда и масел, сульфаты этоксилированных алкилфенолов, сульфаты алкоксилированных арилфенолов, сульфаты конденсированных нафталинов, сульфаты додецил- и тридецилбензолов, сульфаты нафталинов и алкилнафталинов, сульфосукцинаты или сульфосукцинаматы. Примерами сульфатов являются сульфаты жирных кислот и масел, этоксилированных алкилфенолов, спиртов, этоксилированных спиртов или сложных эфиров жирных кислот. Примерами фосфатов являются сложные эфиры фосфатов. Примерами карбоксилатов являются алкилкарбоксилаты и карбоксилированные этоксилаты спирта или алкилфенола.

Пригодными неионогенными поверхностно-активными веществами являются алкоксилаты, N-замещенные амиды кислот жирного ряда, аминоксиды, сложные эфиры, поверхностно-активные вещества на основе сахара, полимерные поверхностно-активные вещества и их смеси. Примерами алкоксилатов являются соединения, такие как спирты, алкилфенолы, амины, амиды, арилфенолы, жирные кислоты или эфиры жирных кислот, которые были алкоксилированы посредством от 1 до 50 эквивалентов. Для алкоксилирования можно использовать этиленоксид и/или пропиленоксид, предпочтительно этиленоксид. Примерами N-замещенных амидов кислот жирного ряда являются глюкамиды

кислот жирного ряда или алканоламидами кислот жирного ряда. Примерами сложных эфиров являются эфиры кислот жирного ряда, сложные эфиры глицерина или моноглицериды. Примерами поверхностно-активных веществ на основе сахара являются сорбитаны, сложные эфиры сахарозы и глюкозы или алкилполиглюкозиды. Примеры полимерных поверхностно-активных веществ являются гомо- или сополимеры винилпирролидона, виниловые спирты или винулацетат.

Пригодными катионными поверхностно-активными веществами являются четвертичные поверхностно-активные вещества, например, четвертичные аммониевые соединения с одной или двумя гидрофобными группами или соли длинноцепочечных первичных аминов. Пригодными амфотерными поверхностно-активными веществами являются алкилбетаины и имидазолины. Пригодными блок-полимерами являются блок-полимеры типа А-В или А-В-А, содержащие блоки из полиэтиленоксида и полипропиленоксида или типа А-В-С, содержащие алканол, полиэтиленоксид и полипропиленоксид. Пригодными полиэлектролитами являются поликислоты или полиоснования. Примерами поликислот являются щелочные соли полиакриловой кислоты или поликислотные гребенчатые полимеры. Примерами полиоснований являются поливиниламины или полиэтиленамины.

Пригодными адъювантами являются соединения, которые сами по себе обладают весьма незначительной или даже не обладают пестицидной активностью, и которые улучшают биологическую эффективность целевого соединения. Примерами являются поверхностно-активные вещества, минеральные или растительные масла и другие вспомогательные вещества. Дополнительные примеры перечислены у Knowles, Adjuvants and additives, Agrow Reports DS256, T&F Informa UK, 2006, глава 5.

Пригодные загустители представляют собой полисахариды (например, ксантановая смола, карбоксиметилцеллюлоза), неорганические глины (органически модифицированные или немодифицированные), поликарбоксилаты и силикаты.

Пригодные бактерициды представляют собой бронопол и производные изотиазолинона, такие как алкилизотиазолиноны и бензизотиазолиноны.

Пригодные антифризы представляют собой этиленгликоль, пропиленгликоль, мочевины и глицерин.

Пригодные антивспениватели представляют собой силиконы, длинноцепочечные спирты и соли кислот жирного ряда.

Пригодные красители (например, красного, синего или зеленого цвета) представляют собой пигменты с низкой растворимостью в воде и водорастворимые красители. Примерами являются неорганические красители (например, оксид железа, оксид титана, гексацианоферрат железа) и органические красители (например, ализариновые, азокрасители и фталоцианиновые красители).

Пригодными веществами для повышения клейкости или связующими веществами являются поливинилпирролидоны, поливинилацетаты, поливиниловые спирты, полиакрилаты, биологические или синтетические воски и простые эфиры целлюлозы.

Как правило, агрохимические композиции содержат между 0.01 и 95 масс.%, предпочтительно между 0.1 и 90 масс.%, более предпочтительно между 1 и 70 масс.%, и в особенности между 10 и 60 масс.% активного вещества (например, по меньшей мере одно соединение I). Как правило, агрохимические композиции содержат между 5 и 99.9 масс.%, предпочтительно между 10 и 99.9 масс.%, более предпочтительно между 30 и 99 масс.%, и в особенности между 40 и 90 масс.% по меньшей мере одного вспомогательного вещества. Активные вещества (например, соединения I) применяют с чистотой от 90 % до 100 %, предпочтительно от 95 % до 100 % (по спектру ЯМР).

С целью обработки материалов для размножения растений, особенно семян, обычно применяют растворы для обработки семян (LS), суспензии (SE), жидкие концентраты (FS), порошки для сухой обработки (DS), диспергируемые в воде порошки для суспензионной обработки (WS), растворимые в воде порошки (SS), эмульсии (ES), эмульгируемые концентраты (EC) и гели (GF). Рассматриваемые композиции после от двух- до десятикратного разбавления, дают концентрации активного вещества от 0,01 до 60 масс.%, предпочтительно от 0,1 до 40 масс.% в готовых к применению препаратах. Применение может быть осуществлено как перед, так и во время посева. Способы нанесения смесей в соответствии с изобретением и соответственно их композиций на материал для размножения растений, в особенности семена, включают в себя протравливание, покрытие, дражирование, опудривание, замачивание и внесение в борозду материала для размножения. Предпочтительно, смеси в соответствии с



изобретением или соответственно их композиции, наносят на материал для размножения растений таким способом, что не вызывается прорастание, например, путем протравливания семян, дражирования, покрытия и опудривания.

5 К соединениям I или к их композициям могут быть добавлены различные типы масел, смачивающие средства, адъюванты, удобрения или питательные микроэлементы и другие пестициды (например, фунгициды, регуляторы роста, гербициды, инсектициды, сафенеры) в качестве премикса или непосредственно перед использованием (баковая смесь). Такие средства могут быть примешаны к  
10 композициям согласно изобретению в массовом соотношении от 1:100 до 100:1, предпочтительно 1:10 до 10:1.

Как правило, пестицид представляет собой химическое или биологическое средство (вирус, бактерия, антимикробное или дезинфицирующее средство), которое вследствие его воздействия отпугивает, делает недееспособным, убивает  
15 или по-иному обезвреживает вредителей. К целевым вредителям относят насекомых, патогенов растений, сорные травы, моллюсков, птиц, млекопитающих, рыбу, нематод (круглые черви) и микробов, которые уничтожают имущество, причиняют неудобства, распространяют заболевания или являются переносчиками заболевания. Термин «пестициды» также  
20 охватывает регуляторы роста растений, которые изменяют ожидаемый рост, цветение или скорость воспроизведения растений; дефолианты, которые вызывают опадание листьев или другой листы в растения, как правило, чтобы облегчить сбор урожая; десиканты, которые ускоряют высушивание живых тканей, таких как нежелательные верхушки растений; активаторы растений,  
25 активирующие физиологию растений для защиты от некоторых вредителей; сафенеры, которые снижают нежелательное гербицидное воздействие пестицидов на сельскохозяйственные культуры; и стимуляторы роста растений, влияющие на физиологию растений, чтобы увеличить рост растений, биомассу, урожай или любой другой параметр качества продуктов сельскохозяйственных  
30 растений, пригодных для сбора.

Биопестициды определены как форма пестицидов на основе микроорганизмов (бактерий, грибов, вирусов, нематод и т. д.) или натуральных продуктов (соединений, таких как метаболиты, белки или экстракты из биологических или других природных источников) (Агентство по охране

окружающей среды США): <http://www.epa.gov/pesticides/biopesticides/>).

Биопестициды делятся на два основных класса: микробные и биохимические пестициды:

(1) Микробные пестициды состоят из бактерий, грибов или вирусов (и часто включают метаболиты, которые производят бактерии и грибы).  
Энтомопатогенные нематоды также классифицируются как микробные пестициды, хотя они и многоклеточные.

(2) Биохимические пестициды представляют собой вещества природного происхождения, с помощью которых борются с вредителями или обеспечивают другие способы защиты сельскохозяйственных культур, как определено ниже, но являются относительно нетоксичными для млекопитающих.

Смешивание соединений I или содержащих их композиций в форме применения в качестве фунгицидов с другими фунгицидами во многих случаях приводит к расширению получаемого фунгицидного спектра активности или к предотвращению развития устойчивости к фунгицидам. Кроме того, во многих случаях достигаются синергетические эффекты (синергетические смеси).

Следующий список пестицидов II в сочетании с которыми можно использовать соединения I, предназначен для иллюстрации возможных комбинаций, но не ограничивается ими:

А) Ингибиторы дыхания

- Ингибиторы комплекса III на сайте  $Q_o$ : азоксистробин (А.1.1), куметоксистробин (А.1.2), кумоксистробин (А.1.3), димоксистробин (А.1.4), энестробурин (А.1.5), фенаминстробин (А.1.6), феноксистробин/флуфеноксистробин (А.1.7), флуоксастробин (А.1.8), крезоксим-метил (А.1.9), мандестробин (А.1.10), метоминостробин (А.1.11), оризастробин (А.1.12), пикоксистробин (А.1.13), пиракlostробин (А.1.14), пираметостробин (А.1.15), пираоксистробин (А.1.16), трифлуксистробин (А.1.17), 2-(2-(3-(2,6-дихлорфенил)-1-метил-аллилиденаминооксиметил)-фенил)-2-метоксиимино-N-метил-ацетамид (А.1.18), пирибенкарб (А.1.19), триклопирикарб/хлординкарб (А.1.20), фамоксадон (А.1.21), фенамидон (А.1.21a), метил-N-[2-[(1,4-диметил-5-фенил-пиразол-3-ил)оксилметил]фенил]-N-метокси-карбамат (А.1.22), метилтетрапол (А.1.25), (Z,2E)-5-[1-(2,4-дихлорфенил)пиразол-3-ил]-окси-2-метоксиимино-N,3-диметил-пент-3-енамид (А.1.34), (Z,2E)-5-[1-(4-хлорфенил)пиразол-3-ил]окси-2-метоксиимино-N,3-

диметил-пент-3-енамид (А.1.35), пириминостробин (А.1.36), бифуджунжи (А.1.37), метиловый эфир 2-(орто-((2,5-диметилфенил-оксиметилен)фенил)-3-метокси-акриловой кислоты (А.1.38);

5 - ингибиторы комплекса III на сайте Q<sub>i</sub>: циазофамид (А.2.1), амисульбром (А.2.2), [(6S,7R,8R)-8-бензил-3-[(3-гидрокси-4-метокси-пиридин-2-карбонил)амино]-6-метил-4,9-диоксо-1,5-диоксонан-7-ил] 2-метилпропаноат (А.2.3), фенпикоксамид (А.2.4), флорилпикоксамид (А.2.5), метарилпикоксамид (А.2.6);

10 - ингибиторы комплекса II: беноданил (А.3.1), бензовиндифлупир (А.3.2), биксафен (А.3.3), боскалид (А.3.4), карбоксин (А.3.5), фенфурам (А.3.6), флуопирам (А.3.7), флутоланил (А.3.8), флуксапироксад (А.3.9), фураметпир (А.3.10), изофетамид (А.3.11), изопиразам (А.3.12), мепронил (А.3.13), оксикарбоксин (А.3.14), пенфлуфен (А.3.15), пентиопирад (А.3.16), пидифлуметофен (А.3.17), пиразифлумид (А.3.18), седаксан (А.3.19),  
15 теклофталам (А.3.20), тифлузамид (А.3.21), инпирфлуксам (А.3.22), пирапропоин (А.3.23), флуиндапир (А.3.28), N-[2-[2-хлор-4-(трифторметил)фенокси]фенил]-3-(дифторметил)-5-фтор-1-метил-пиразол-4-карбоксамид (А.3.29), метил (Е)-2-[2-[(5-циано-2-метил-фенокси)метил]фенил]-3-метокси-проп-2-еноат (А.3.30), изофлуципрам (А.3.31), 2-(дифторметил)-N-(1,1,3-триметил-индан-4-ил)пиридин-3-карбоксамид (А.3.32), 2-(дифторметил)-N-[(3R)-1,1,3-триметилиндан-4-ил]пиридин-3-карбоксамид (А.3.33), 2-(дифторметил)-N-(3-этил-1,1-диметил-индан-4-ил)пиридин-3-карбоксамид (А.3.34), 2-(дифторметил)-N-[(3R)-3-этил-1,1-диметил-индан-4-ил]пиридин-3-карбоксамид (А.3.35), 2-(дифторметил)-N-(1,1-диметил-3-пропил-индан-4-ил)пиридин-3-карбоксамид (А.3.36), 2-(дифторметил)-N-[(3R)-1,1-диметил-3-пропил-индан-4-ил]пиридин-3-карбоксамид (А.3.37), 2-(дифторметил)-N-(3-изобутил-1,1-диметил-индан-4-ил)пиридин-3-карбоксамид (А.3.38), 2-(дифторметил)-N-[(3R)-3-изобутил-1,1-диметил-индан-4-ил]пиридин-3-карбоксамид (А.3.39), циклобутрифлурам (А.3.24);

30 - другие ингибиторы дыхания: дифлуметорим (А.4.1); производные нитрофенила: бинапакрил (А.4.2), динобутон (А.4.3), динокап (А.4.4), флуазинам (А.4.5), мептилдинокап (А.4.6), феримзон (А.4.7); металлоорганические соединения: соли фентина, например, фентинацетат (А.4.8), фентинхлорид

(А.4.9) или фентингидроксид (А.4.10); аметокрадин (А.4.11); силтиофам (А.4.12);

В) Ингибиторы биосинтеза стерина (фунгициды ИБС)

- ингибиторы С14 деметилазы: триазолы: азаконазол (В.1.1), битертанол (В.1.2), бромконазол (В.1.3), ципроконазол (В.1.4), дифеноконазол (В.1.5), диниконазол (В.1.6), диниконазол-М (В.1.7), эпоксиконазол (В.1.8), фенбуконазол (В.1.9), флуквинконазол (В.1.10), флузилазол (В.1.11), флутриафол (В.1.12), гексаконазол (В.1.13), гексаконазол (В.1.13), имибенконазол (В.1.14), ипконазол (В.1.15), метконазол (В.1.17), миклобутанил (В.1.18), окспоконазол (В.1.19), паклобутразол (В.1.20), пенконазол (В.1.21), пропиконазол (В.1.22), протиоконазол (В.1.23), симеконазол (В.1.24), тебуконазол (В.1.25), тетраконазол (В.1.26), триадимефон (В.1.27), триадименол (В.1.28), тритиконазол (В.1.29), униконазол (В.1.30), 2-(2,4-дифторфенил)-1,1-дифтор-3-(тетразол-1-ил)-1-[5-[4-(2,2,2-трифторэтокси)фенил]-2-пиридил]пропан-2-ол (В.1.31), 2-(2,4-дифторфенил)-1,1-дифтор-3-(тетразол-1-ил)-1-[5-[4-(трифторметокси)фенил]-2-пиридил]пропан-2-ол (В.1.32), 4-[[6-[2-(2,4-дифторфенил)-1,1-дифтор-2-гидрокси-3-(5-сульфанил-1,2,4-триазол-1-ил)пропил]-3-пиридил]окси]бензонитрил (В.1.33), ипфентрифлуконазол (В.1.37), мефентрифлуконазол (В.1.38), (2*R*)-2-[4-(4-хлорфенокси)-2-(трифторметил)фенил]-1-(1,2,4-триазол-1-ил)пропан-2-ол, (2*S*)-2-[4-(4-хлорфенокси)-2-(трифторметил)фенил]-1-(1,2,4-триазол-1-ил)пропан-2-ол, 2-(хлорметил)-2-метил-5-(*n*-толилметил)-1-(1,2,4-триазол-1-илметил)циклопентанол (В.1.43); имидазолы: имазалил (В.1.44), пефуразоат (В.1.45), прохлораз (В.1.46), трифлумизол (В.1.47); пиримидины, пиридины, пиперазины: фенаримол (В.1.49), пирифенокс (В.1.50), трифорин (В.1.51), [3-(4-хлор-2-фтор-фенил)-5-(2,4-дифторфенил)изоксазол-4-ил]-(3-пиридил)метанол (В.1.52), 4-[[6-[2-(2,4-дифторфенил)-1,1-дифтор-2-гидрокси-3-(1,2,4-триазол-1-ил)пропил]-3-пиридил]окси]бензонитрил (В.1.53), 2-[6-(4-бромфенокси)-2-(трифторметил)-3-пиридил]-1-(1,2,4-триазол-1-ил)пропан-2-ол (В.1.54), 2-[6-(4-хлорфенокси)-2-(трифторметил)-3-пиридил]-1-(1,2,4-триазол-1-ил)пропан-2-ол (В.1.55);
- Ингибиторы дельта-14-редуктазы: алдиморф (В.2.1), додеморф (В.2.2), додеморф-ацетат (В.2.3), фенпропиморф (В.2.4), тридеморф (В.2.5), фенпропидин (В.2.6), пипералин (В.2.7), спироксамин (В.2.8);

- Ингибиторы 3-кеторедуктазы: фенгексамид (В.3.1);
- Другие ингибиторы биосинтеза стероидов: хлорфеномизол (В.4.1);
- С) Ингибиторы синтеза нуклеиновых кислот
  - фениламины или фунгициды ациламинокислоты: беналаксил (С.1.1),
  - 5 беналаксил-М (С.1.2), киралаксил (С.1.3), металаксил (С.1.4), металаксил-М (С.1.5), офураце (С.1.6), оксадиксил (С.1.7);
  - другие ингибиторы синтеза нуклеиновых кислот: гимексазол (С.2.1), октилинон (С.2.2), оксолиновая кислота (С.2.3), бупиримат (С.2.4), 5-фторцитозин (С.2.5), 5-фтор-2-(*n*-толилметокси)пиримидин-4-амин (С.2.6), 5-фтор-2-(4-фторфенилметокси)пиримидин-4-амин (С.2.7), 5-фтор-2-(4-хлорфенилметокси)пиримидин-4 амин (С.2.8);
  - Д) Ингибиторы деления клеток и цитоскелета
    - ингибиторы тубулина: беномил (D.1.1), карбендазим (D.1.2), фуберидазол (D.1.3), тиобендазол (D.1.4), тиофанат-метил (D.1.5),
    - 15 пиридахлометил (D.1.6), N-этил-2-[(3-этинил-8-метил-6-хинолил)окси]бутанамид (D.1.8), N-этил-2-[(3-этинил-8-метил-6-хинолил)окси]-2-метилсульфанил-ацетамид (D.1.9), 2-[(3-этинил-8-метил-6-хинолил)окси]-N-(2-фторэтил)бутанамид (D.1.10), 2-[(3-этинил-8-метил-6-хинолил)окси]-N-(2-фторэтил)-2-метокси-ацетамид (D.1.11), 2-[(3-этинил-8-метил-6-хинолил)окси]-N-пропил-бутанамид (D.1.12), 2-[(3-этинил-8-метил-6-хинолил)окси]-2-метокси-N-пропил-ацетамид (D.1.13), 2-[(3-этинил-8-метил-6-хинолил)окси]-2-метилсульфанил-N-пропил-ацетамид (D.1.14), 2-[(3-этинил-8-метил-6-хинолил)окси]-N-(2-фторэтил)-2-метилсульфанил-ацетамид (D.1.15), 4-(2-бром-4-фтор-фенил)-N-(2-хлор-6-фтор-фенил)-2,5-диметил-пиразол-3-амин (D.1.16);
    - 25 - другие ингибиторы деления клеток: диэтофенкарб (D.2.1), этабоксам (D.2.2), пенцикурон (D.2.3), флупиколид (D.2.4), зоксамид (D.2.5), метрафенон (D.2.6), приофенон (D.2.7), фенамакрил (D.2.8);
    - Е) Ингибиторы синтеза аминокислот и белков
      - ингибиторы синтеза метионина: ципродинил (E.1.1), мепанипирим (E.1.2), приметанил (E.1.3);
      - 30 - ингибиторы синтеза белков: бластицидин-S (E.2.1), казугамицин (E.2.2), гидрохлорид-гидрат казугамицина (E.2.3), милдиомицин (E.2.4), стрептомицин (E.2.5), окситетрациклин (E.2.6);
      - Ф) Ингибиторы сигнальной трансдукции

- Ингибиторы MAP-/гистидин-киназы: фторимид (F.1.1), ипродион (F.1.2), процимидон (F.1.3), винклозолин (F.1.4), флудиоксонил (F.1.5);
- Ингибиторы G белков: квиноксифен (F.2.1);
- G) Ингибиторы липидного и мембранного синтеза
- 5       - Ингибиторы биосинтеза фосфолипидов: эдифенфос (G.1.1), ипробенфос (G.1.2), пиразофос (G.1.3), изопротиолан (G.1.4);
  - перекисного окисления липидов: диклоран (G.2.1), квинтозен (G.2.2), текназен (G.2.3), толклофос-метил (G.2.4), бифенил (G.2.5), хлорнеб (G.2.6), этридиазол (G.2.7), цинктиазол (G.2.8);
- 10       - биосинтеза фосфолипидов и отложения клеточной оболочки: диметоморф (G.3.1), флуморф (G.3.2), мандипропамид (G.3.3), пириморф (G.3.4), бентиаваликарб (G.3.5), ипроваликарб (G.3.6), валифеналат (G.3.7);
  - соединения, повреждающие проницаемость клеточной мембраны и жирных кислот: пропамокарб (G.4.1);
- 15       - ингибиторы оксистерин-связывающего белка: оксатиापипролин (G.5.1), флуоксапипролин (G.5.3), 4-[1-[2-[3-(дифторметил)-5-метил-пиразол-1-ил]ацетил]-4-пиперидил]-N-тетралин-1-ил-пиридин-2-карбоксамид (G.5.4), 4-[1-[2-[3,5-бис(дифторметил)пиразол-1-ил]ацетил]-4-пиперидил]-N-тетралин-1-ил-пиридин-2-карбоксамид (G.5.5), 4-[1-[2-[3-(дифторметил)-5-
- 20       (трифторметил)пиразол-1-ил]ацетил]-4-пиперидил]-N-тетралин-1-ил-пиридин-2-карбоксамид (G.5.6), 4-[1-[2-[5-циклопропил-3-(дифторметил)пиразол-1-ил]ацетил]-4-пиперидил]-N-тетралин-1-ил-пиридин-2-карбоксамид (G.5.7), 4-[1-[2-[5-метил-3-(трифторметил)пиразол-1-ил]ацетил]-4-пиперидил]-N-тетралин-1-ил-пиридин-2-карбоксамид (G.5.8), 4-[1-[2-[5-(дифторметил)-3-
- 25       (трифторметил)пиразол-1-ил]ацетил]-4-пиперидил]-N-тетралин-1-ил-пиридин-2-карбоксамид (G.5.9), 4-[1-[2-[3,5-бис(трифторметил)пиразол-1-ил]ацетил]-4-пиперидил]-N-тетралин-1-ил-пиридин-2-карбоксамид (G.5.10), (4-[1-[2-[5-циклопропил-3-(трифторметил)пиразол-1-ил]ацетил]-4-пиперидил]-N-тетралин-
- 30       1-ил-пиридин-2-карбоксамид (G.5.11);
- Н) Ингибиторы с многосторонним действием:
  - неорганические активные вещества: бордоская смесь (H.1.1), медь (H.1.2), ацетат меди (H.1.3), гидроксид меди (H.1.4), оксихлорид меди (H.1.5), основной сульфат меди (H.1.6), сера (H.1.7);

- тио- и дитиокарбаматы: фербам (Н.2.1), манкозеп (Н.2.2), манеб (Н.2.3), метам (Н.2.4), метирам (Н.2.5), пропинеб (Н.2.6), тирам (Н.2.7), цинеб (Н.2.8), цирам (Н.2.9);

5 - хлорорганические соединения: анилазин (Н.3.1), хлороталонил (Н.3.2), каптафол (Н.3.3), каптан (Н.3.4), фолпет (Н.3.5), дихлофлуанид (Н.3.6), дихлорофен (Н.3.7), гексахлорбензол (Н.3.8), пентахлорфенол (Н.3.9) и его соли, фталид (Н.3.10), толилфлуанид (Н.3.11);

10 - гуанидины и другие: гуанидин (Н.4.1), додин (Н.4.2), додин свободное основание (Н.4.3), гуазатин (Н.4.4), гуазатин-ацетат (Н.4.5), иминоктадин (Н.4.6), иминоктадин-триацетат (Н.4.7), иминоктадин-трис(албезилат) (Н.4.8), дитианон (Н.4.9), 2,6-диметил-1Н,5Н-[1,4]дитиино[2,3-с:5,6-с']дипиррол-1,3,5,7(2Н,6Н)-тетраон (Н.4.10);

I) Ингибиторы синтеза клеточной оболочки

15 - ингибиторы синтеза глюкана: валидамицин (I.1.1), полиоксин В (I.1.2);  
- ингибиторы синтеза меланина: пироквилон (I.2.1), трициклазол (I.2.2), карпропамид (I.2.3), дицикломет (I.2.4), феноксанил (I.2.5);

J) Индукторы защиты растений

20 - ацибензолар-S-метил (J.1.1), пробеназол (J.1.2), изотианил (J.1.3), тиадинил (J.1.4), прогексадион-кальций (J.1.5); фосфонаты: фосэтил (J.1.6), фосэтил-алюминий (J.1.7), фосфористая кислота и ее соли (J.1.8), фосфонат кальция (J.1.11), фосфонат калия (J.1.12), бикарбонат калия или натрия (J.1.9), 4-циклопропил-N-(2,4-диметоксифенил)тиадиазол-5-карбоксамид (J.1.10);

K) Неизвестный механизм действия

25 - брнопол (K.1.1), хинометионат (K.1.2), цифлуфенамид (K.1.3), цимоксанил (K.1.4), дазомет (K.1.5), дебакарб (K.1.6), диклоцимет (K.1.7), дикломезин (K.1.8), дифензокват (K.1.9), дифензокват-метилсульфат (K.1.10), дифениламин (K.1.11), фенитропан (K.1.12), фенпиразамин (K.1.13), флуметовер (K.1.14), флусульфамид (K.1.15), флутианил (K.1.16), гарпин (K.1.17), метасульфокарб (K.1.18), нитрапирин (K.1.19), нитротал-изопропил (K.1.20), толпрокарб (K.1.21), оксин-медь (K.1.22), проквиназид (K.1.23), тебуфлорвин (K.1.24), теклофталам (K.1.25), триазоксид (K.1.26), N'-(4-(4-хлор-3-трифторметил-фенокси)-2,5-диметил-фенил)-N-этил-N-метил формамидин (K.1.27), N'-(4-(4-фтор-3-трифторметил-фенокси)-2,5-диметил-фенил)-N-этил-N-метилформамидин (K.1.28), N'-[4-[[3-[(4-хлорфенил)метил]-1,2,4-тиадиазол-5-

ил]окси]-2,5-диметил-фенил]-N-этил-N-метил-формаимидин (К.1.29), N'-(5-бром-6-индан-2-илокси-2-метил-3-пиридил)-N-этил-N-метил-формаимидин (К.1.30), N'-[5-бром-6-[1-(3,5-дифторфенил)этокси]-2-метил-3-пиридил]-N-этил-N-метил-формаимидин (К.1.31), N'-[5-бром-6-(4-изопропилциклогексокси)-2-метил-3-пиридил]-N-этил-N-метил-формаимидин (К.1.32), N'-[5-бром-2-метил-6-(1-фенилэтокси)-3-пиридил]-N-этил-N-метил-формаимидин (К.1.33), N'-(2-метил-5-трифторметил-4-(3-триметилсиланил-пропокси)-фенил)-N-этил-N-метил-формаимидин (К.1.34), N'-(5-дифторметил-2-метил-4-(3-триметилсиланил-пропокси)-фенил)-N-этил-N-метил-формаимидин (К.1.35), 2-(4-хлор-фенил)-N-[4-(3,4-диметокси-фенил)-изоксазол-5-ил]-2-проп-2-инилокси-ацетамид (К.1.36), 3-[5-(4-хлор-фенил)-2,3-диметил-изоксазолидин-3-ил]-пиридин (пиризоксазол) (К.1.37), 3-[5-(4-метилфенил)-2,3-диметил-изоксазолидин-3-ил]-пиридин (К.1.38), 5-хлор-1-(4,6-диметокси-пиримидин-2-ил)-2-метил-1H-бензоимидазол (К.1.39), этил (Z)-3-амино-2-циано-3-фенил-проп-2-еноат (К.1.40), пикарбутразокс (К.1.41), пентил N-[6-[[[(Z)-[(1-метилтетразол-5-ил)-фенил-метиле]амино]оксиметил]-2-пиридил]карбамат (К.1.42), бут-3-инил N-[6-[[[(Z)-[(1-метилтетразол-5-ил)-фенил-метиле]амино]оксиметил]-2-пиридил]карбамат (К.1.43), ипфлуфенохин (К.1.44), хинофумелин (К.1.47), бензизотиазолинон (К.1.48), бромталонил (К.1.49), 2-(6-бензил-2-пиридил)хиназолин (К.1.50), 2-[6-(3-фтор-4-метокси-фенил)-5-метил-2-пиридил]хиназолин (К.1.51), дихлобентиазокс (К.1.52), N'-(2,5-диметил-4-фенокси-фенил)-N-этил-N-метил-формаимидин (К.1.53), аминопирифен (К.1.54), флуопимомид (К.1.55), N'-[5-бром-2-метил-6-(1-метил-2-пропокси-этокси)-3-пиридил]-N-этил-N-метил-формаимидин (К.1.56), N'-[4-(4,5-дихлортиазол-2-ил)окси-2,5-диметил-фенил]-N-этил-N-метил-формаимидин (К.1.57), N-(2-фторфенил)-4-[5-(трифторметил)-1,2,4-оксадиазол-3-ил]бензамид (К.1.58), N-метил-4-[5-(трифторметил)-1,2,4-оксадиазол-3-ил]бензолкарботиоамид (К.1.59), N-метокси-N-[[4-[5-(трифторметил)-1,2,4-оксадиазол-3-ил]фенил]метил]циклопропанкарбоксамид (WO2018/177894, WO 2020/212513);

30 L) Биопестициды

L1) Микробные пестициды с фунгицидной, бактерицидной, вирулицидной активностью и/или активностью активатора защиты растений: *Ampelomyces quisqualis*, *Aspergillus flavus*, *Aureobasidium pullulans*, *Bacillus altitudinis*, *B. amyloliquefaciens*, *B. amyloliquefaciens* ssp. *plantarum* (также называемый *B.*



*velezensis*), *B. megaterium*, *B. mojavensis*, *B. mycoides*, *B. pumilus*, *B. simplex*, *B. solisalsi*, *B. subtilis*, *B. subtilis* var. *amyloliquefaciens*, *B. velezensis*, *Candida oleophila*, *C. saitoana*, *Clavibacter michiganensis* (бактериофаги), *Coniothyrium minitans*, *Cryphonectria parasitica*, *Cryptococcus albidus*, *Dilophosphora alopecuri*,  
 5 *Fusarium oxysporum*, *Clonostachys rosea* f. *catenulate* (также называемый *Gliocladium catenulatum*), *Gliocladium roseum*, *Lysobacter antibioticus*, *L. enzymogenes*, *Metschnikowia fructicola*, *Microdochium dimerum*, *Microsphaeropsis ochracea*, *Muscodor albus*, *Paenibacillus alvei*, *Paenibacillus epiphyticus*, *P. polymyxa*, *Pantoea vagans*, *Penicillium bilaiae*, *Phlebiopsis gigantea*, *Pseudomonas*  
 10 sp., *Pseudomonas chloraphis*, *Pseudozyma flocculosa*, *Pichia anomala*, *Pythium oligandrum*, *Sphaerodes mycoparasitica*, *Streptomyces griseoviridis*, *S. lydicus*, *S. violaceusniger*, *Talaromyces flavus*, *Trichoderma asperelloides*, *T. asperellum*, *T. atroviride*, *T. fertile*, *T. gamsii*, *T. harmatum*, *T. harzianum*, *T. polysporum*, *T. stromaticum*, *T. virens*, *T. viride*, *Typhula phacorrhiza*, *Ulocladium oudemansii*,  
 15 *Verticillium dahlia*, вирус желтой мозаики кабачка (авирулентный штамм);

L2) Биохимические пестициды с фунгицидной, бактерицидной, вирулицидной активностью и/или активностью активатора защиты растений: белок гарпин, экстракт *Reynoutria sachalinensis*;

L3) Микробные пестициды с инсектицидной, акарицидной, моллюскоцидной и/или нематоцидной активностью: *Agrobacterium radiobacter*,  
 20 *Bacillus cereus*, *B. firmus*, *B. thuringiensis*, *B. thuringiensis* ssp. *aizawai*, *B. t.* ssp. *israelensis*, *B. t.* ssp. *galleriae*, *B. t.* ssp. *kurstaki*, *B. t.* ssp. *tenebrionis*, *Beauveria bassiana*, *B. brongniartii*, *Burkholderia* spp., *Chromobacterium subtsugae*,  
 25 грануловиром *Cydia pomonella* (СрGV), грануловиром *Cryptophlebia leucotreta* (CrleGV), *Flavobacterium* spp., нуклеополигедровирус *Helicoverpa armigera* (HearNPV), нуклеополигедровирус *Helicoverpa zea* (ГцNPV), однокапсидный нуклеополигедровирус *Helicoverpa zea* (ГцSNPV), *Heterorhabditis bacteriophora*, *Isaria fumosorosea*, *Lecanicillium longisporum*, *L. muscarium*, *Metarhizium anisopliae*, *M. anisopliae* var. *anisopliae*, *M. anisopliae* var. *acridum*, *Nomuraea rileyi*, *Paecilomyces fumosoroseus*, *P. lilacinus*, *Paenibacillus popilliae*, *Pasteuria*  
 30 spp., *P. nishizawae*, *P. penetrans*, *P. ramosa*, *P. thornea*, *P. usgae*, *Pseudomonas fluorescens*, нуклеополигедровирус *Spodoptera littoralis* (SpliNPV), *Steinernema carpocapsae*, *S. feltiae*, *S. kraussei*, *Streptomyces galbus*, *S. microflavus*;

L4) Биохимические пестициды с инсектицидной, акарицидной, моллюскоцидной, феромонной и/или нематицидной активностью: L-карвон, цитраль, (E,Z)-7,9-додекадиен-1-илацетат, этилформиат, (E,Z)-2,4-этилдекадиеноат (грушевый сложный эфир), (Z,Z,E)-7,11,13-гексадекатриеналь, гептилбутират, изопропилмиристан, лаванулилсенециоат, цис-жасмон, 2-метил-1-бутанол, метилэвгенол, метилжасмонат, (E,Z)-2,13-октадекадиен-1-ол, (E,Z)-2,13-октадекадиен-1-олацетат, (E,Z)-3,13-октадекадиен-1-ол, (R)-1-октен-3-ол, пентатерманон, (E,Z,Z)-3,8,11-тетрадекатриенилацетат, (Z,E)-9,12-тетрадекадиен-1-илацетат, (Z)-7-тетрадецен-2-он, (Z)-9-тетрадецен-1-илацетат, (Z)-11-тетрадеценаль, (Z)-11-тетрадецен-1-ол, экстракт *Chenopodium ambrosioides*, масло семян маргозы, экстракт квиллайи;

L5) Микробные пестициды, снижающие стресс растений, регуляторы роста растений, стимулирующие рост растений и/или повышающие урожайность: *Azospirillum amazonense*, *A. brasilense*, *A. lipoferum*, *A. irakense*, *A. halopraeferens*, *Bradyrhizobium* spp., *B. elkanii*, *B. japonicum*, *B. liaoningense*, *B. lupini*, *Delftia acidovorans*, *Glomus intraradices*, *Mesorhizobium* spp., *Rhizobium leguminosarum* bv. *phaseoli*, *R. l.* bv. *trifolii*, *R. l.* bv. *viciae*, *R. tropici*, *Sinorhizobium meliloti*;

О) Инсектициды из классов О.1 - О.29

О.1 Ингибиторы ацетилхолинэстеразы (AChE): алдикарб, аланикарб, бендиокарб, бенфуракарб, бутокарбоксим, бутоксикарбоксим, карбарил, карбофуран, карбосульфат, этиофенкарб, фенобукарб, форметанат, фуратиокарб, изопрокарб, метиокарб, метомил, метолкарб, оксамил, пиримикарб, пропоксур, тиодикарб, тиофанокс, триметакарб, ХМС, ксилкарб, триазамат, ацефат, азаметифос, азинфос-этил, азинфосметил, кадузафос, хлорэтоксифос, хлорфенвинфос, хлормефос, хлорпирифос, хлорпирифос-метил, кумафос, цианофос, деметон-S-метил, диазион, дихлорвос/DDVP, дикротофос, диметоат, диметилвинфос (44), дисульфотон, EPN, этион, этопрофос, фамфур, фенамифос, фенитроцион, фентион, фостиазат, гептенофос, имициафос, изофенфос, изопропил О-(метоксиаминотио-фосфорил) салицилат, изоксатион, малатион, мекарбам, метамидофос, метидатион, мевинфос, монокротофос, налед, ометоат, оксидеметон-метил, паратион, паратион-метил, пентоат, фонат, фосалон, фосмет, фосфамидон, фоксим, пиримфос-метил, профенофос, пропетамфос, протиофос,

пираклофос, пиридафентион, квиналфос, сульфотеп, тебупиримфос, темефос, тербуфос, тетрахлорвинфос, тиометон, триазофос, трихлорфон, ванидотион;

О.2 Антагонисты регулируемых ГАМК хлоридных каналов: эндосульфан, хлордан, этипрол, фипронила, флуфипрол, пифлупрол, пирипрол;

5 О.3 Модуляторы натриевых каналов: акринатрин, аллетрин, d-цис-транс аллетрин, d-транс аллетрин, бифентрин, каппа-бифентрин, биоаллетрин, биоаллетрин S-циклопентенил, биоресметрин, циклопротрин, цифлутрин, бета-цифлутрин, цигалотрин, лямбда-цигалотрин, гамма-цигалотрин, циперметрин, альфа-циперметрин, бета-циперметрин, тета-циперметрин, зета-циперметрин, 10 цифенотрин, дельтаметрин, эмпентрин, эсфенвалерат, этофенпрокс, фенпропатрин, фенвалерат, флуцитринат, флуметрин, тау-флувалинат, галфенпрокс, гептафлутрин, имипротрин, меперфлутрин, метофлутрин, момфлуортрин, эпсилон- момфлуортрин, перметрин, фенотрин, праллетрин, профлутрин, пиретрин (пиретрум), ресметрин, силафлуофен, тефлутрин, каппа- 15 тефлутрин, тетраметилфлутрин, тетраметрин, тралометрин, трансфлутрин, DDT, метоксихлор;

О.4 Агонисты никотинового ацетилхолинового рецептора (nAChR): ацетамиприд, клотианидин, циклоксаприд, динотефуран, имидаклоприд, нитенпирам, тиаклоприд, тиаметоксам, 4,5-дигидро-N-нитро- 20 1-(2-оксиранилметил)-1H-имидазол-2-амин, (2E)-1-[(6-хлорпиридин-3-ил)метил]-N'-натро-2-пентилиденгидразинкарбоксимидамид, 1-[(6-хлорпиридин-3-ил)метил]-7-метил-8-нитро-5-пропокси-1,2,3,5,6,7-гексагидроимидазо[1,2- 25 а]пиридин, никотин, сульфоксафлор, флупирадифуран, трифлумезопирим, (3R)-3-(2-хлортиазол-5-ил)-8-метил-5-оксо-6-фенил-2,3-дигидротиазоло[3,2- а]пиримидин-8-ий-7-олат, (3S)-3-(6-хлор-3-пиридил)-8-метил-5-оксо-6-фенил- 2,3-дигидротиазоло[3,2-а]пиримидин-8-ий-7-олат, (3S)-8-метил-5-оксо-6-фенил- 3-пиримидин-5-ил-2,3-дигидротиазоло[3,2-а]пиримидин-8-ий-7-олат, (3R)-3-(2- 30 хлортиазол-5-ил)-8-метил-5-оксо-6-[3-(трифторметил)фенил]-2,3- дигидротиазоло[3,2-а]пиримидин-8-ий-7-олат, (3R)-3-(2-хлортиазол-5-ил)-6-(3,5- дихлорфенил)-8-метил-5-оксо-2,3-дигидротиазоло[3,2-а]пиримидин-8-ий-7-олат, (3R)-3-(2-хлортиазол-5-ил)-8-этил-5-оксо-6-фенил-2,3-дигидротиазоло[3,2- а]пиримидин-8-ий-7-олат;

О.5 Аллостерические активаторы никотинового ацетилхолинового рецептора: спиносад, спинеторам;

О.6 Активаторы хлоридных каналов: абамектин, эмамектин бензоат, ивермектин, лепимектин, милбемектин;

О.7 Миметики ювенильных гормонов: гидропрен, кинопрен, метопрен, феноксикарб, пирипроксифен;

5 О.8 Смешанные неспецифические (многостороннего действия) ингибиторы: метилбромид (1) и другие алкилгалогениды, хлорпикрин, сульфурилфторид, бура, виннокислый антимолил-калий;

О.9 Модуляторы каналов TRPV хордотонального органа: пиметрозин, пирифлухиназон;

10 О.10 Ингибиторы роста клещей: клофентезин, гекситиазокс, дифловидазин, этоксазол;

О.11 Микробные разрушители мембран средней кишки насекомых: *Bacillus thuringiensis*, *Bacillus sphaericus* и инсектицидные белки, которые они производят: *Bacillus thuringiensis* subsp. *israelensis*, *Bacillus sphaericus*, *Bacillus thuringiensis* subsp. *aizawai*, *Bacillus thuringiensis* subsp. *kurstaki*, *Bacillus thuringiensis* subsp. *tenebrionis*, Bt белки сельскохозяйственных культур: Cry1Ab, Cry1Ac, Cry1Fa, Cry2Ab, mCry3A, Cry3Ab, Cry3Bb, Cry34/35Ab1;

15

О.12 Ингибиторы митохондриальной АТФ-синтазы: диафентиурон, азоциклотин, цигексатин, фенбутатин оксид, пропаргит, тетрадифон;

20 О.13 Разобщители окислительного фосфорилирования посредством разрушения протонного градиента: хлорфенапир, DNOC, амид серы;

О.14 Блокаторы каналов никотинового ацетилхолинового рецептора (nAChR): бенсультап, картап гидрохлорид, тиоциклам, тиосультап натрия;

25 О.15 Ингибиторы биосинтеза хитина типа 0: бистрифлурон, хлорфлуазурон, дифлубензурон, флуциклоксурон, флуфеноксурон, гексафлумурон, луфенурон, новалурон, новифлумурон, тефлубензурон, трифлумурон;

О.16 Ингибиторы биосинтеза хитина типа 1: бупрофезин;

О.17 Разрушители линьки: циромазин;

30 О.18 Агонисты рецепторов экдизона: метоксифенозид, тебуфенозид, галофенозид, фуфенозид, хромафенозид;

О.19 Агонисты рецептора октопамина: амитраз;

О.20 Ингибиторы переноса электронов митохондриального комплекса III: гидраметилнон, ацеквиноцил, флуакрипирим, бифеназат;

О.21 Ингибиторы переноса электронов митохондриального комплекса I: феназаквин, фенпироксимат, пиримифиден, пиридабен, тебуфенпирад, толфенпирад, ротенон;

5 О.22 Блокаторы потенциалзависимых натриевых каналов: индоксакарб, метафлумизон, 2-[2-(4-цианофенил)-1-[3-(трифторметил)фенил]этилиден]-N-[4-(дифторметокси)фенил]-гидразинкарбоксамид, N-(3-хлор-2-метилфенил)-2-[(4-хлорфенил)-[4-[метил(метилсульфонил)амино]фенил]метилен]-гидразинкарбоксамид;

10 О.23 Ингибиторы ацетил-КоА-карбоксилазы: спиродиклофен, спиромезифен, спиротетрамат, спиропидион;

О.24 Ингибиторы переноса электронов митохондриального комплекса IV: фосфид алюминия, фосфид кальция, фосфин, фосфид цинка, цианид;

О.25 Ингибиторы переноса электронов митохондриального комплекса II: циенопирафен, цифлуметофен;

15 О.26 Модуляторы рианодиновых рецепторов: флубенамид, хлорантранилипрол, циантранилипрол, цикланилипрол, тетранилипрол, (R)-3-хлор-N<sup>1</sup>-{2-метил-4-[1,2,2,2-тетрафтор-1-(трифторметил)этил]фенил}-N<sup>2</sup>-(1-метил-2-метилсульфонилэтил)фталамид, (S)-3-хлор-N<sup>1</sup>-{2-метил-4-[1,2,2,2-тетрафтор-1-(трифторметил)этил]фенил}-N<sup>2</sup>-(1-метил-2-метилсульфонилэтил)фталамид, метил-2-[3,5-дибром-2-({[3-бром-1-(3-хлорпиридин-2-ил)-1H-пиразол-5-ил]карбонил}амино)бензоил]-1,2-диметилгидразинкарбоксилат, N-[4,6-дихлор-2-[(диэтил-лямбда-4-сульфанилиден)карбамоил]-фенил]-2-(3-хлор-2-пиридил)-5-(трифторметил)пиразол-3-карбоксамид, N-[4-хлор-2-[(диэтил-лямбда-4-сульфанилиден)карбамоил]-6-метил-фенил]-2-(3-хлор-2-пиридил)-5-(трифторметил)пиразол-3-карбоксамид, N-[4-хлор-2-[(ди-2-пропил-лямбда-4-сульфанилиден)карбамоил]-фенил]-2-(3-хлор-2-пиридил)-5-(трифторметил)пиразол-3-карбоксамид, N-[4,6-дихлор-2-[(ди-2-пропил-лямбда-4-сульфанилиден)карбамоил]-фенил]-2-(3-хлор-2-пиридил)-5-(трифторметил)пиразол-3-карбоксамид, N-[4,6-дибром-2-[(диэтил-лямбда-4-сульфанилиден)карбамоил]-фенил]-2-(3-хлор-2-пиридил)-5-(трифторметил)пиразол-3-карбоксамид, N-[2-(5-амино-1,3,4-тиадиазол-2-ил)-4-хлор-6-метилфенил]-3-бром-1-(3-хлор-2-пиридинил)-1H-пиразол-5-карбоксамид, 3-хлор-1-(3-хлор-2-пиридинил)-N-[2,4-дихлор-6-[(1-циано-1-

20

25

30

метилэтил)амино]карбонил]фенил]-1Н-пиразол-5-карбоксамид,  
тетрахлорантранилипрол, N-[4-хлор-2-[[1,1-диметилэтил)амино]карбонил]-6-  
метилфенил]-1-(3-хлор-2-пиридинил)-3-(фторметокси)-1Н-пиразол-5-  
карбоксамид, цигалодиамид;

5 О.27: Модуляторы хордотонального органа – неопределенный участок-  
мишень: флоникамид;

О.28. Инсектицидные соединения неизвестного или неопределенного  
механизма действия: афидопиропен, афоксоланер, азадирахтин, амидофлумет,  
бензоксимат, брофланилид, бромпропилат, хинометионат, криолит,  
10 ципрофланилид, диклоромезотиаз, дикофол, флуфенерим, флометоквин,  
флуенсульфон, флугексафон, флуопирам, флураланер, метоксадиазон,  
пиперонил бутоксид, пифлубумид, пиридалил, тиоксазафен, 11-(4-хлор-  
2,6-диметилфенил)-12-гидрокси-1,4-диокса-9-азадиспиро[4.2.4.2]-тетрадец-11-  
ен-10-он, 3-(4'-фтор-2,4-диметилбифенил-3-ил)-4-гидрокси-8-окса-1-  
15 азаспиро[4.5]дец-3-ен-2-он, 1-[2-фтор-4-метил-5-[(2,2,2-  
трифторэтил)сульфинил]фенил]-3-(трифторметил)-1Н-1,2,4-триазол-5-амин,  
Bacillus firmus I-1582, флупиримин, флузаиндолизин, 4-[5-(3,5-дихлорфенил)-5-  
(трифторметил)-4Н-изоксазол-3-ил]-2-метил-N-(1-оксотизтан-3-ил)бензамид,  
флуксаметамида, 5-[3-[2,6-дихлор-4-(3,3-дихлораллилокси)феноксипропокси]-  
20 1Н-пиразол, 4-циано-N-[2-циано-5-[[2,6-дибром-4-[1,2,2,3,3,3-гексафтор-1-  
(трифторметил)пропил]фенил]карбамоил]фенил]-2-метил-бензамид, 4-циано-3-  
[[4-циано-2-метил-бензоил)амино]-N-[2,6-дихлор-4-[1,2,2,3,3,3-гексафтор-1-  
(трифторметил)пропил]фенил]-2-фтор-бензамид, N-[5-[[2-хлор-6-циано-  
4-[1,2,2,3,3,3-гексафтор-1-(трифторметил)пропил]фенил]карбамоил]-2-циано-  
25 фенил]-4-циано-2-метил-бензамид, N-[5-[[2-бром-6-хлор-4-[2,2,2-трифтор-1-  
гидрокси-1-(трифторметил)этил]фенил]карбамоил]-2-циано-фенил]-4-циано-  
2-метил-бензамид, N-[5-[[2-бром-6-хлор-4-[1,2,2,3,3,3-гексафтор-1-  
(трифторметил)пропил]фенил]карбамоил]-2-циано-фенил]-4-циано-2-метил-  
бензамид, 4-циано-N-[2-циано-5-[[2,6-дихлор-4-[1,2,2,3,3,3-гексафтор-  
30 1-(трифторметил)пропил]фенил]карбамоил]фенил]-2-метил-бензамид, 4-циано-  
N-[2-циано-5-[[2,6-дихлор-4-[1,2,2,2-тетрафтор-  
1-(трифторметил)этил]фенил]карбамоил]фенил]-2-метил-бензамид,  
N-[5-[[2-бром-6-хлор-4-[1,2,2,2-тетрафтор-1-  
(трифторметил)этил]фенил]карбамоил]-2-циано-фенил]-4-циано-2-метил-

бензамид ( ); 2-(1,3-диоксан-2-ил)-6-[2-(3-пиридинил)-5-тиазолил]-пиридин,  
 2-[6-[2-(5-фтор-3-пиридинил)-5-тиазолил]-2-пиридинил]-пиримидин, 2-[6-[2-(3-  
 пиридинил)-5-тиазолил]-2-пиридинил]-пиримидин, N-метилсульфонил-6-[2-(3-  
 пиридил)тиазол-5-ил]пиридин-2-карбоксамид, N-метилсульфонил-6-[2-(3-  
 5 пиридил)тиазол-5-ил]пиридин-2-карбоксамид, 1-[(6-хлор-3-пиридинил)метил]-  
 1,2,3,5,6,7-гексагидро-5-метокси-7-метил-8-нитро-имидазо[1,2-а]пиридин, 1-[(6-  
 хлорпиридин-3-ил)метил]-7-метил-8-нитро-1,2,3,5,6,7-гексагидроимидазо[1,2-  
 а]пиридин-5-ол, 1-изопропил-N,5-диметил-N-пиридазин-4-ил-пиразол-4-  
 карбоксамид, 1-(1,2-диметилпропил)-N-этил-5-метил-N-пиридазин-4-ил-  
 10 пиразол-4-карбоксамид, N,5-диметил-N-пиридазин-4-ил-1-(2,2,2-трифтор-1-  
 метил-этил)пиразол-4-карбоксамид, 1-[1-(1-цианоциклопропил)этил]-N-этил-5-  
 метил-N-пиридазин-4-ил-пиразол-4-карбоксамид, N-этил-1-(2-фтор-1-метил-  
 пропил)-5-метил-N-пиридазин-4-ил-пиразол-4-карбоксамид, 1-(1,2-  
 диметилпропил)-N,5-диметил-N-пиридазин-4-ил-пиразол-4-карбоксамид,  
 15 1-[1-(1-цианоциклопропил)этил]-N,5-диметил-N-пиридазин-4-ил-пиразол-4-  
 карбоксамид, N-метил-1-(2-фтор-1-метил-пропил)-5-метил-N-пиридазин-4-ил-  
 пиразол-4-карбоксамид, 1-(4,4-дифторциклогексил)-N-этил-5-метил-N-  
 пиридазин-4-ил-пиразол-4-карбоксамид, 1-(4,4-дифторциклогексил)-N,5-  
 диметил-N-пиридазин-4-ил-пиразол-4-карбоксамид, N-(1-метилэтил)-2-(3-  
 20 пиридинил)-2H-индазол-4-карбоксамид, N-циклопропил-2-(3-пиридинил)-2H-  
 индазол-4-карбоксамид, N-циклогексил-2-(3-пиридинил)-2H-индазол-4-  
 карбоксамид, 2-(3-пиридинил)-N-(2,2,2-трифторэтил)-2H-индазол-4-  
 карбоксамид, 2-(3-пиридинил)-N-[(тетрагидро-2-фуранил)метил]-2H-индазол-  
 5-карбоксамид, метил 2-[[2-(3-пиридинил)-2H-индазол-5-  
 25 ил]карбонил]гидразинкарбоксилат, N-[(2,2-дифторциклопропил)метил]-2-(3-  
 пиридинил)-2H-индазол-5-карбоксамид, N-(2,2-дифторпропил)-2-(3-пиридинил)-  
 2H-индазол-5-карбоксамид, 2-(3-пиридинил)-N-(2-пиримидинилметил)-2H-  
 индазол-5-карбоксамид, N-[(5-метил-2-пиразинил)метил]-2-(3-пиридинил)-2H-  
 индазол-5-карбоксамид, тиклопирazoфлор, сароланер, лотиланер, N-[4-хлор-3-  
 30 [[(фенилметил)амино]карбонил]фенил]-1-метил-3-(1,1,2,2,2-пентафторэтил)-  
 4-(трифторметил)-1H-пиразол-5-карбоксамид, 2-(3-этилсульфонил-2-пиридил)-3-  
 метил-6-(трифторметил)имидазо[4,5-b]пиридин, 2-[3-этилсульфонил-5-  
 (трифторметил)-2-пиридил]-3-метил-6-(трифторметил)имидазо[4,5-b]пиридин,  
 изоциклосолам, N-[4-хлор-3-(циклопропилкарбамоил)фенил]-2-метил-

- 5-(1,1,2,2,2-пентафторэтил)-4-(трифторметил)пиразол-3-карбоксамид, N-[4-хлор-3-[(1-цианоциклопропил)карбамоил]фенил]-2-метил-5-(1,1,2,2,2-пентафторэтил)-4-(трифторметил)пиразол-3-карбоксамид, ацинонапир, бензпиримоксан, тиголанер, хлор-N-(1-цианоциклопропил)-5-[1-[2-метил-
- 5 5-(1,1,2,2,2-пентафторэтил)-4-(трифторметил)пиразол-3-ил]пиразол-4-ил]бензамид, оксазосульфил, [(2S,3R,4R,5S,6S)-3,5-диметокси-6-метил-4-пропокси-тетрагидропиран-2-ил]-N-[4-[1-[4-(трифторметокси)фенил]-1,2,4-триазол-3-ил]фенил]карбамат, [(2S,3R,4R,5S,6S)-3,4,5-триметокси-6-метил-тетрагидропиран-2-ил] N-[4-[1-[4-(трифторметокси)фенил]-1,2,4-триазол-3-ил]фенил]карбамат, [(2S,3R,4R,5S,6S)-3,5-диметокси-6-метил-4-пропокси-тетрагидропиран-2-ил]-N-[4-[1-[4-(1,1,2,2,2-пентафторэтоксифенил)-1,2,4-триазол-3-ил]фенил]карбамат, [(2S,3R,4R,5S,6S)-3,4,5-триметокси-6-метил-тетрагидропиран-2-ил]-N-[4-[1-[4-(1,1,2,2,2-пентафторэтоксифенил)-1,2,4-триазол-3-ил]фенил]карбамат, (2Z)-3-(2-изопропилфенил)-2-[(E)-[4-[1-[4-
- 15 (1,1,2,2,2-пентафторэтоксифенил)-1,2,4-триазол-3-ил]фенил]метиленидразоно]тиазолидин-4-он, 2-(6-хлор-3-этилсульфонил-имидазо[1,2-а]пиридин-2-ил)-3-метил-6-(трифторметил)имидазо[4,5-б]пиридин, 2-(6-бром-3-этилсульфонил-имидазо[1,2-а]пиридин-2-ил)-3-метил-6-(трифторметил)имидазо[4,5-б]пиридин, 2-(3-этилсульфонил-6-йодо-имидазо[1,2-а]пиридин-2-ил)-3-метил-6-(трифторметил)имидазо[4,5-б]пиридин, 2-[3-этилсульфонил-6-(трифторметил)имидазо[1,2-а]пиридин-2-ил]-3-метил-6-(трифторметил)имидазо[4,5-б]пиридин, 2-(7-хлор-3-этилсульфонил-имидазо[1,2-а]пиридин-2-ил)-3-метил-6-(трифторметил)имидазо[4,5-б]пиридин, 2-(3-этилсульфонил-7-йод-имидазо[1,2-а]пиридин-2-ил)-3-метил-6-
- 20 (трифторметил)имидазо[4,5-б]пиридин, 3-этилсульфонил-6-йодо-2-[3-метил-6-(трифторметил)имидазо[4,5-б]пиридин-2-ил]имидазо[1,2-а]пиридин-8-карбнитрил, 2-[3-этилсульфонил-8-фтор-6-(трифторметил)имидазо[1,2-а]пиридин-2-ил]-3-метил-6-(трифторметил)имидазо[4,5-б]пиридин, 2-[3-этилсульфонил-7-(трифторметил)имидазо[1,2-а]пиридин-2-ил]-3-метил-6-
- 25 (трифторметил)имидазо[4,5-б]пиридин, 2-[3-этилсульфонил-7-
- 30 (трифторметил)имидазо[1,2-а]пиридин-2-ил]-3-метил-6-(трифторметил)имидазо[4,5-с]пиридин, 2-(6-бром-3-этилсульфонил-имидазо[1,2-а]пиридин-2-ил)-6-(трифторметил)пиразоло[4,3-с]пиридин.



Активные вещества, относящиеся к компоненту 2, их получение и их активность, например, известны против вредных грибов (см.: <http://www.alanwood.net/pesticides/>); эти вещества являются коммерчески доступными. Соединения, описанные номенклатурой ИЮПАК, их получение и их пестицидная активность также являются известными (см. Can. J. Plant Sci. 48(6), 587-94, 1968; EP-A 141 317; EP-A 152 031; EP-A 226 917; EP-A 243 970; EP-A 256 503; EP-A 428 941; EP-A 532 022; EP-A 1 028 125; EP-A 1 035 122; EP-A 1 201 648; EP-A 1 122 244, JP 2002316902; DE 19650197; DE 10021412; DE 102005009458; US 3,296,272; US 3,325,503; WO 98/46608; WO 99/14187; WO 99/24413; WO 99/27783; WO 00/29404; WO 00/46148; WO 00/65913; WO 01/54501; WO 01/56358; WO 02/22583; WO 02/40431; WO 03/10149; WO 03/11853; WO 03/14103; WO 03/16286; WO 03/53145; WO 03/61388; WO 03/66609; WO 03/74491; WO 04/49804; WO 04/83193; WO 05/120234; WO 05/123689; WO 05/123690; WO 05/63721; WO 05/87772; WO 05/87773; WO 06/15866; WO 06/87325; WO 06/87343; WO 07/82098; WO 07/90624, WO 10/139271, WO 11/028657, WO 12/168188, WO 07/006670, WO 11/77514; WO 13/047749, WO 10/069882, WO 13/047441, WO 03/16303, WO 09/90181, WO 13/007767, WO 13/010862, WO 13/127704, WO 13/024009, WO 13/24010, WO 13/047441, WO 13/162072, WO 13/092224, WO 11/135833, CN 1907024, CN 1456054, CN 103387541, CN 1309897, WO 12/84812, CN 1907024, WO 09094442, WO 14/60177, WO 13/116251, WO 08/013622, WO 15/65922, WO 94/01546, EP 2865265, WO 07/129454, WO 12/165511, WO 11/081174, WO 13/47441, WO 16/156241, WO 16/162265). Некоторые соединения идентифицируются по их регистрационному номеру CAS, который разделен дефисами на три части: первая состоит из двух-семи цифр, вторая состоит из двух цифр, а третья состоит из одной цифры.

В соответствии с изобретением твердое вещество (сухое вещество) биопестицидов (за исключением масел, таких как масло семян маргозы) считается активными компонентами (например, получаемыми после сушки или упаривания экстракционной или суспензионной среды в случае жидких составов микробных пестицидов). Массовые соотношения и проценты, используемые для биологического экстракта, такого как экстракт квиллайи, основаны на общей массе сухого содержания (твердого вещества) соответствующего(их) экстракта(ов).

Общие массовые соотношения композиций, содержащих по меньшей мере один микробный пестицид в форме жизнеспособных микробных клеток, включая спящие формы, могут быть определены с использованием количества КОЕ соответствующего микроорганизма для расчета общей массы соответствующего

5 активного компонента по следующему уравнению, где  $1 \times 10^{10}$  КОЕ равняется одному грамму общей массы соответствующего активного компонента.

Колониеобразующая единица является мерой жизнеспособных микробных клеток. Кроме того, под КОЕ можно также понимать количество (ювенильных) отдельных нематод в случае нематодных биопестицидов, таких как *Steinernema*

10 *Feltiae*.

В бинарных смесях массовое соотношение компонента 1) и компонента 2), как правило, зависит от свойств используемых компонентов, обычно оно находится в диапазоне от 1:10,000 до 10,000:1, часто от 1:100 до 100:1, как

15 правило от 1:50 до 50:1, предпочтительно от 1:20 до 20:1, более предпочтительно от 1:10 до 10:1, даже более предпочтительно от 1:4 до 4:1 и в особенности от 1:2 до 2:1. В соответствии с дополнительными вариантами осуществления, массовое соотношение компонента 1) и компонента 2) обычно

20 находится в диапазоне от 1000:1 до 1:1, часто от 100:1 до 1:1, обычно от 50:1 до 1:1, предпочтительно от 20:1 до 1:1, более предпочтительно от 10:1 до 1:1, даже более предпочтительно от 4:1 до 1:1 и в особенности от 2:1 до 1:1. В

25 соответствии с дополнительными вариантами осуществления, массовое соотношение компонента 1) и компонента 2) обычно находится в диапазоне от 20,000:1 до 1:10, часто от 10,000:1 до 1:1, обычно от 5,000:1 до 5:1,

30 предпочтительно от 5,000:1 до 10:1, более предпочтительно от 2,000:1 до 30:1, даже более предпочтительно от 2,000:1 до 100:1 и в особенности от 1,000:1 до 100:1. В соответствии с дополнительными вариантами осуществления, массовое соотношение компонента 1) и компонента 2) обычно находится в диапазоне от 1:1 до 1:1000, часто от 1:1 до 1:100, обычно от 1:1 до 1:50, предпочтительно от 1:1 до 1:20, более предпочтительно от 1:1 до 1:10, даже более предпочтительно от 1:1 до 1:4 и в особенности от 1:1 до 1:2. В соответствии с дополнительными вариантами осуществления, массовое соотношение компонента 1) и компонента 2) обычно находится в диапазоне от 10:1 до 1:20,000, часто от 1:1 до 1:10,000, обычно от 1:5 до 1:5,000, предпочтительно от 1:10 до 1:5,000, более

предпочтительно от 1:30 до 1:2,000, даже более предпочтительно от 1:100 до 1:2,000 и в особенности от 1:100 до 1:1,000.

В тройных смесях, т.е. композициях, содержащих компонент 1) и компонент 2) и соединение III (компонент 3), массовое соотношение компонента 1) и компонента 2) зависит от свойств используемых активных веществ, обычно оно находится в диапазоне от 1:100 до 100:1, обычно от 1:50 до 50:1, предпочтительно от 1:20 до 20:1, более предпочтительно от 1:10 до 10:1 и в особенности от 1:4 до 4:1, и массовое соотношение компонента 1) и компонента 3) обычно находится в диапазоне от 1:100 до 100:1, обычно от 1:50 до 50:1, предпочтительно от 1:20 до 20:1, более предпочтительно от 1:10 до 10:1 и в особенности от 1:4 до 4:1. При желании к компоненту 1) добавляют любые дополнительные активные компоненты в соотношении от 20:1 до 1:20. Эти соотношения также подходят для смесей, применяемых при обработке семян.

При использовании смесей, содержащих микробные пестициды, для защиты сельскохозяйственных культур нормы внесения варьируются от  $1 \times 10^6$  до  $5 \times 10^{16}$  (или больше) КОЕ/га, предпочтительно от  $1 \times 10^8$  до  $1 \times 10^{13}$  КОЕ/га, и даже более предпочтительно от  $1 \times 10^9$  до  $5 \times 10^{15}$  КОЕ/га и в особенности от  $1 \times 10^{12}$  до  $5 \times 10^{14}$  КОЕ/га. В случае нематод в качестве микробных пестицидов (например, *Steinernema feltiae*) нормы внесения обычно варьируются от  $1 \times 10^5$  до  $1 \times 10^{12}$  (или больше), предпочтительно от  $1 \times 10^8$  до  $1 \times 10^{11}$ , более предпочтительно от  $5 \times 10^8$  до  $1 \times 10^{10}$  особей (например, в виде яиц, молодых особей или особей на любых других живых стадиях, предпочтительно на инфекционной ювенильной стадии) на га.

При использовании смесей, содержащих микробные пестициды, для обработки семян нормы внесения обычно варьируются от  $1 \times 10^6$  до  $1 \times 10^{12}$  (или больше) КОЕ/семя, предпочтительно от  $1 \times 10^6$  до  $1 \times 10^9$  КОЕ/семя. Кроме того, нормы внесения при обработке семян обычно варьируются от  $1 \times 10^7$  до  $1 \times 10^{14}$  (или больше) КОЕ на 100 кг семян, предпочтительно от  $1 \times 10^9$  до  $1 \times 10^{12}$  КОЕ на 100 кг семян.

Предпочтение отдается смесям, содержащим в качестве компонента 2) по меньшей мере одно активное вещество, выбранное из ингибиторов комплекса III на Q<sub>o</sub> сайте в группе А), более предпочтительно выбранное из соединений (А.1.1), (А.1.4), (А.1.8), (А.1.9), (А.1.10), (А.1.12), (А.1.13), (А.1.14), (А.1.17), (А.1.21), (А.1.25), (А.1.34) и (А.1.35); особенно выбранное из соединений

(A.1.1), (A.1.4), (A.1.8), (A.1.9), (A.1.13), (A.1.14), (A.1.17), (A.1.25), (A.1.34) и (A.1.35).

Предпочтение также отдается смесям, содержащим в качестве компонента 2) по меньшей мере одно активное вещество, выбранное из ингибиторов комплекса III на  $Q_i$  сайте в группе A), более предпочтительно выбранное из соединений (A.2.1), (A.2.3), (A.2.4) и (A.2.6); особенно выбранное из соединений (A.2.3), (A.2.4) и (A.2.6).

Предпочтение также отдается смесям, содержащим в качестве компонента 2) по меньшей мере одно активное вещество, выбранное из ингибиторов комплекса II в группе A), более предпочтительно выбранное из соединений (A.3.2), (A.3.3), (A.3.4), (A.3.7), (A.3.9), (A.3.11), (A.3.12), (A.3.15), (A.3.16), (A.3.17), (A.3.18), (A.3.19), (A.3.20), (A.3.21), (A.3.22), (A.3.23), (A.3.24), (A.3.28), (A.3.31), (A.3.32), (A.3.33), (A.3.34), (A.3.35), (A.3.36), (A.3.37), (A.3.38) и (A.3.39); особенно выбранное из соединений (A.3.2), (A.3.3), (A.3.4), (A.3.7), (A.3.9), (A.3.12), (A.3.15), (A.3.17), (A.3.19), (A.3.22), (A.3.23), (A.3.24), (A.3.31), (A.3.32), (A.3.33), (A.3.34), (A.3.35), (A.3.36), (A.3.37), (A.3.38) и (A.3.39).

Предпочтение также отдается смесям, содержащим в качестве компонента 2) по меньшей мере одно активное вещество, выбранное из других ингибиторов дыхания в группе A), более предпочтительно выбранное из соединений (A.4.5) и (A.4.11); в особенности (A.4.11).

Предпочтение также отдается смесям, содержащим в качестве компонента 2) по меньшей мере одно активное вещество, выбранное из ингибиторов деметилазы C14 в группе B), более предпочтительно выбранное из соединений (B.1.4), (B.1.5), (B.1.8), (B.1.10), (B.1.11), (B.1.12), (B.1.13), (B.1.17), (B.1.18), (B.1.21), (B.1.22), (B.1.23), (B.1.25), (B.1.26), (B.1.29), (B.1.34), (B.1.37), (B.1.38), (B.1.43), (B.1.46), (B.1.53), (B.1.54) и (B.1.55); особенно выбранное из соединений (B.1.5), (B.1.8), (B.1.10), (B.1.17), (B.1.22), (B.1.23), (B.1.25), (B.1.33), (B.1.34), (B.1.37), (B.1.38), (B.1.43) и (B.1.46).

Предпочтение также отдается смесям, содержащим в качестве компонента 2) по меньшей мере одно активное вещество, выбранное из ингибиторов дельта 14-редуктазы в группе B), более предпочтительно выбранное из соединений (B.2.4), (B.2.5), (B.2.6) и (B.2.8); в особенности (B.2.4).

Предпочтение также отдается смесям, содержащим в качестве компонента 2) по меньшей мере одно активное вещество, выбранное из фениламинов и

фунгицидов ациламинокислот в группе С), более предпочтительно выбранное из соединений (С.1.1), (С.1.2), (С.1.4) и (С.1.5); особенно выбранное из соединений (С.1.1) и (С.1.4).

5 Предпочтение также отдается смесям, содержащим в качестве компонента 2) по меньшей мере одно активное вещество, выбранное из других ингибиторов синтеза нуклеиновых кислот в группе С), более предпочтительно выбранное из соединений (С.2.6), (С.2.7) и (С.2.8).

10 Предпочтение также отдается смесям, содержащим в качестве компонента 2) по меньшей мере одно активное вещество, выбранное из группы D), более предпочтительно выбранное из соединений (D.1.1), (D.1.2), (D.1.5), (D.2.4) и (D.2.6); особенно выбранное из соединений (D.1.2), (D.1.5) и (D.2.6).

15 Предпочтение также отдается смесям, содержащим в качестве компонента 2) по меньшей мере одно активное вещество, выбранное из группы E), более предпочтительно выбранное из соединений (E.1.1), (E.1.3), (E.2.2) и (E.2.3); в особенности (E.1.3).

Предпочтение также отдается смесям, содержащим в качестве компонента 2) по меньшей мере одно активное вещество, выбранное из группы F), более предпочтительно выбранное из соединений (F.1.2), (F.1.4) и (F.1.5).

20 Предпочтение также отдается смесям, содержащим в качестве компонента 2) по меньшей мере одно активное вещество, выбранное из группы G), более предпочтительно выбранное из соединений (G.3.1), (G.3.3), (G.3.6), (G.5.1), (G.5.3), (G.5.4), (G.5.5), G.5.6), G.5.7), (G.5.8), (G.5.9), (G.5.10) и (G.5.11); особенно выбранное из соединений (G.3.1), (G.5.1) и (G.5.3).

25 Предпочтение также отдается смесям, содержащим в качестве компонента 2) по меньшей мере одно активное вещество, выбранное из группы H), более предпочтительно выбранное из соединений (H.2.2), (H.2.3), (H.2.5), (H.2.7), (H.2.8), (H.3.2), (H.3.4), (H.3.5), (H.4.9) и (H.4.10); особенно выбранное из соединений (H.2.2), (H.2.5), (H.3.2), (H.4.9) и (H.4.10).

30 Предпочтение также отдается смесям, содержащим в качестве компонента 2) по меньшей мере одно активное вещество, выбранное из группы I), более предпочтительно выбранное из соединений (I.2.2) и (I.2.5).

Предпочтение также отдается смесям, содержащим в качестве компонента 2) по меньшей мере одно активное вещество, выбранное из группы J), более

предпочтительно выбранное из соединений (J.1.2), (J.1.5), (J.1.8), (J.1.11) и (J.1.12); в особенности (J.1.5).

Предпочтение также отдается смесям, содержащим в качестве компонента 2) по меньшей мере одно активное вещество, выбранное из группы К), более предпочтительно выбранное из соединений (К.1.41), (К.1.42), (К.1.44), (К.1.47), (К.1.57), (К.1.58) и (К.1.59); особенно выбранное из соединений (К.1.41), (К.1.44), (К.1.47), (К.1.57), (К.1.58) и (К.1.59).

Биопестициды из группы L1) и/или L2) могут также обладать инсектицидной, акарицидной, моллюскоцидной, феромонной, нематицидной, снижающей стресс растений, регулирующей рост растений, стимулирующей рост растений и/или повышающей урожайность активностью. Биопестициды из группы L3) и/или L4) могут также обладать фунгицидной, бактерицидной, вирулицидной, активирующей защиту растений, снижающей стресс растений, регулирующей рост растений, стимулирующей рост растений и/или повышающей урожайность активностью. Биопестициды из группы L5) могут также обладать фунгицидной, бактерицидной, вирулицидной, активирующей защиту растений, инсектицидной, акарицидной, моллюскоцидной, феромонной и/или нематицидной активностью.

К микробным пестицидам, в особенности из групп L1), L3) и L5), относятся не только выделенные, чистые культуры соответствующего микроорганизма, как определено в данном документе, но и его бесклеточный экстракт, его суспензия в цельной бульонной культуре и культуральная среда, содержащая метаболит, или очищенный метаболит, полученный из цельной бульонной культуры микроорганизма.

Многие из этих биопестицидов, депонированные под номерами, указанными в настоящем документе (префиксы, такие как ATCC или DSM, относятся к аббревиатуре соответствующей коллекции культур, подробности см. здесь.: [http://www.wfcc.info/ccinfo/collection/by\\_acronym/](http://www.wfcc.info/ccinfo/collection/by_acronym/)), упоминаются в литературе, являются зарегистрированными и/или коммерчески доступными: смеси *Aureobasidium pullulans* DSM 14940 и DSM 14941, выделенные в 1989 году в Констанце, Германия (например, бластоспоры в BlossomProtect® от Bio-Ferm GmbH, Австрия), *Azospirillum brasilense* Sp245, первоначально выделенные в пшеничном регионе Южной Бразилии (Пасо Фундо) по меньшей мере до 1980 г. (BR 11005; например, GELFIX® Gramíneas от BASF Agricultural Specialties Ltd.,

Бразилия), *A. brasilense* штаммы Ab-V5 и Ab-V6 (например, у AzoMax от Novozymes BioAg Produtos para Agricultura Ltda., Куаттро-Баррас, Бразилия, или Simbiose-Maiz® от Simbiose-Agro, Бразилия; Plant Soil 331, 413-425, 2010), *Bacillus amyloliquefaciens* штамм AP-188 (NRRL B-50615 и B-50331; US 8,445,255); *B. amyloliquefaciens* ssp. *plantarum* штаммы, ранее также иногда называемые *B. subtilis*, недавно вместе с *B. метилотrophicus*, и *B. velezensis* классифицированы как *B. velezensis* (Int. J. Syst. Evol. Microbiol. 66, 1212–1217, 2016): *B. a.* ssp. *plantarum* или *B. velezensis* D747, выделенные из воздуха в Кикугава, Япония (US 20130236522 A1; FERM BP-8234; например, Double Nickel™ 55 WDG от Certis LLC, USA), *B. a.* ssp. *plantarum* или *B. velezensis* FZB24 выделенные из почвы в Бранденбурге, Германия (также называемые SB3615; DSM 96-2; J. Plant Dis. Prot. 105, 181–197, 1998; например, Taegro® от Novozyme Biologicals, Inc., США), *B. a.* ssp. *plantarum* или *B. velezensis* FZB42, выделенные из почвы в Бранденбурге, Германия (DSM 23117; J. Plant Dis. Prot. 105, 181–197, 1998; например, RhizoVital® 42 от AbiTEP GmbH, Германия), *B. a.* ssp. *plantarum* или *B. velezensis* MBI600, выделенные из конских бобов в Саттон-Бонингтоне, Ноттингемшир, Великобритания, по меньшей мере до 1988 (также называемые 1430; NRRL B-50595; US 2012/0149571 A1; например, Integral® от BASF Corp., США), *B. a.* ssp. *plantarum* или *B. velezensis* QST-713, выделенные из персикового сада в 1995 году в Калифорнии, США (NRRL B-21661; например, Serenade® MAX от Bayer Crop Science LP, США), *B. a.* ssp. *plantarum* или *B. velezensis* TJ1000, выделенные в 1992 в Южной Дакоте, США (также называемые 1BE; ATCC BAA-390; CA 2471555 A1; например, QuickRoots™ от TJ Technologies, Watertown, SD, США); *B. firmus* CNCM I-1582, вариант родительского штамма EIP-N1 (CNCM I-1556), выделенный из почвы центральной равнинной местности Израиля (WO 2009/126473, US 6,406,690; например, Votivo® от Bayer CropScience LP, США), *B. pumilus* GHA 180, выделенные из ризосферы яблони в Мексике (IDAC 260707-01; например, PRO-MIX® BX от Premier Horticulture, Квебек, Канада), *B. pumilus* INR-7, иначе называемые BU-F22 и BU-F33, выделенные по меньшей мере до 1993 от огурца, зараженного *Erwinia tracheiphila* (NRRL B-50185, NRRL B-50153; US 8,445,255), *B. pumilus* KFP9F, выделенные из ризосферы трав Южной Африки по меньшей мере до 2008 (NRRL B-50754; WO 2014/029697; например, BAS-UP или FUSION-P от BASF Agricultural Specialities (Pty) Ltd., Южная Африка), *B.*

*pumilus* QST 2808, выделенные из почвы, собранной в Понпеи, Федеративные Штаты Микронезии, в 1998 году (NRRL B-30087; например, Sonata® или Ballad® Plus от Bayer Crop Science LP, США), *B. simplex* ABU 288 (NRRL B-50304; US 8,445,255), *B. subtilis* FB17, также называемые UD 1022 или UD10-22,

5 выделенные из корнеплодов красной свеклы в Северной Америке (ATCC PTA-11857; System. Appl. Microbiol. 27, 372-379, 2004; US 2010/0260735; WO 2011/109395); *B. thuringiensis* ssp. *aizawai* ABTS-1857, выделенные из почвы, взятой с газона в Эфраиме, штат Висконсин, США, в 1987 году (также называемые ABG-6346; ATCC SD-1372; например, XenTari® от BioFa AG,

10 Мюнзинген, Германия), *B. t.* ssp. *kurstaki* ABTS-351, идентичные HD-1, выделенные в 1967 из больных черных личинок розового коробочного червя в Браунсвилле, штат Техас, США (ATCC SD-1275; например, Dipel® DF от Valent BioSciences, IL, США), *B. t.* ssp. *kurstaki* SB4, выделенные из личиночных трупов *E. saccharina* (NRRL B-50753; например, Beta Pro® от BASF Agricultural

15 Specialities (Pty) Ltd., Южная Африка), *B. t.* ssp. *tenebrionis* NB-176-1, мутант штамма NB-125, штамм дикого типа, выделенный в 1982 году из мертвой куколки жука *Tenebrio molitor* (DSM 5480; EP 585 215 B1; например, Novodor® от Valent BioSciences, Швейцария), *Beauveria bassiana* GHA (ATCC 74250; например, BotaniGard® 22WGP от Laverlam Int. Corp., США), *B. bassiana* JW-1

20 (ATCC 74040; например, Naturalis® от CBC (Европа) S.r.l., Италия), *B. bassiana* PPRI 5339, выделенные из личинки щитоноски *Conchyloctenia punctata* (NRRL 50757; например, BroadBand® от BASF Agricultural Specialities (Pty) Ltd., Южная Африка), *Bradyrhizobium elkanii* штаммы SEMIA 5019 (также называемые 29W), выделенные в Рио-де-Жанейро, Бразилия, и SEMIA 587, выделенные в 1967 году

25 в штате Риу-Гранди-ду-Сул, из площади, ранее инокулированной североамериканским изолятом, и используемые в коммерческих инокулянтах с 1968 года (Appl. Environ. Microbiol. 73(8), 2635, 2007; например, GELFIX 5 от BASF Agricultural Specialties Ltd., Бразилия), *B. japonicum* 532с, выделенные из поля в Висконсине, США (Nitragin 61A152; Can. J. Plant. Sci. 70, 661-666, 1990;

30 например, у Rhizoflo®, Histick®, Nicoat® Super от BASF Agricultural Specialties Ltd., Канада), *B. japonicum* E-109 вариант штамма USDA 138 (INTA E109, SEMIA 5085; Eur. J. Soil Biol. 45, 28-35, 2009; Biol. Fertil. Soils 47, 81-89, 2011); *B. japonicum* штаммы, депонированные в SEMIA, известные из Appl. Environ. Microbiol. 73(8), 2635, 2007: SEMIA 5079, выделенные из почвы в регионе



Серрадос, Бразилия, компанией Embrapa-Cerrados, используемые в коммерческих инокулянтах с 1992 года (СПАС 15; например, GELFIX 5 или ADHERE 60 от BASF Agricultural Specialties Ltd., Бразилия), *B. japonicum* SEMIA 5080, полученные в лабораторных условиях компанией Embrapa-Cerrados в Бразилии и используемые в коммерческих инокулянтах с 1992 года, являясь природными вариантами SEMIA 586 (CB1809), которые первоначально выделенные в США (СПАС 7; например, GELFIX 5 или ADHERE 60 от BASF Agricultural Specialties Ltd., Бразилия); *Burkholderia sp.* A396, выделенные из почвы в Nikko, Japan, в 2008 году (NRRL B-50319; WO 2013/032693; Marrone Bio Innovations, Inc., США), *Coniothyrium minitans* CON/M/91-08, выделенные из масличного рапса (WO 1996/021358; DSM 9660; например, Contans® WG, Intercept® WG от Bayer CropScience AG, Германия), белок гарпин (альфа-бета) (Science 257, 85-88, 1992; например, Messenger™ или HARP-N-Tek от Plant Health Care plc, Великобритания), нуклеополигедровирус *Helicoverpa armigera* (HearNPV) (J. Invertebrate Pathol. 107, 112–126, 2011; например, Helicovex® от Adermatt Biocontrol, Швейцария; Diplomata® от Koppert, Бразилия; Vivus® Max от AgBiTech Pty Ltd., Queensland, Австралия), однокапсидный нуклеополигедровирус *Helicoverpa zea* (ГцSNPV) (например, Gemstar® от Certis LLC, США), нуклеополигедровирус АВА-NPV-U *Helicoverpa zea* (например, Heligen® от AgBiTech Pty Ltd., Квинсленд, Австралия), *Heterorhabditis bacteriophora* (например, Nemasys® G от BASF Agricultural Specialties Limited, Великобритания), *Isaria fumosorosea* Апорка-97, выделенные из мучнистого червеца на гинуре в Апопке, Флорида, США (ATCC 20874; Biocontrol Science Technol. 22(7), 747-761, 2012; например, PFR-97™ или PreFeRal® от Certis LLC, США), *Metarhizium anisopliae* var. *anisopliae* F52, также называемые 275 или V275, выделенные от плодовой гни в Австрии (DSM 3884, ATCC 90448; например, Met52® Novozymes Biologicals BioAg Group, Канада), *Metschnikowia fructicola* 277, выделенные из винограда в центральной части Израиля (US 6,994,849; NRRL Y-30752; например, ранее Shemer® от Agrogreen, Израиль), *Paecilomyces ilacinus* 251, выделенные из инфицированных яиц нематод на Филиппинах (AGAL 89/030550; WO1991/02051; Crop Protection 27, 352-361, 2008; например, BioAct® from Bayer CropScience AG, Германия и MeloCon® от Certis, США), *Paenibacillus alvei* NAS6G6, выделенные из ризосферы трав в Южной Африке по меньшей мере до 2008 года (WO 2014/029697; NRRL B-

50755; например, ВАС-UP от BASF Agricultural Specialities (Pty) Ltd., Южная Африка), *Paenibacillus* штаммы, выделенные из образцов почвы из различных стран Европы, включая Германию: *P. epiphyticus* Lu17015 (WO 2016/020371; DSM 26971), *P. polymyxa* ssp. *plantarum* Lu16774 (WO 2016/020371; DSM 26969),  
 5 *P. p.* ssp. *plantarum* штамм Lu17007 (WO 2016/020371; DSM 26970); *Pasteuria nishizawae* Pn1, выделенные из соевого поля в середине 2000-х в Иллинойсе, США (ATCC SD-5833; Федеральный реестр 76 (22), 5808, 2 февраля, 2011; например, Clariva™ PN от Syngenta Crop Protection, LLC, США), *Penicillium bilaiae* (также называемые *P. bilaii*) штаммы ATCC 18309 (= ATCC 74319), ATCC  
 10 20851 и/или ATCC 22348 (= ATCC 74318) первоначально выделенные из почвы в Альберте, Канада (Fertilizer Res. 39, 97-103, 1994; Can. J. Plant Sci. 78(1), 91-102, 1998; US 5,026,417, WO 1995/010006; например, Jump Start®, Provide® от Novozymes Biologicals BioAg Group, Канада), экстракт *Reynoutria sachalinensis* (EP 0307510 B1; например, Regalia® SC от Marrone BioInnovations, Davis, CA,  
 15 США или Milsana® от BioFa AG, Германия), *Steinernema carpocapsae* (например, Millenium® от BASF Agricultural Specialities Limited, Великобритания), *S. feltiae* (например, Nemashield® от BioWorks, Inc., США; Nemasys® от BASF Agricultural Specialities Limited, Великобритания), *Streptomyces microflavus* NRRL B-50550 (WO 2014/124369; Bayer CropScience, Германия), *Trichoderma asperelloides* JM41R, выделенные в Южной Африке (NRRL 50759; также называемые *T. fertile*; например, Trichoplus® от BASF Agricultural Specialities (Pty) Ltd., Южная Африка), *T. harzianum* T-22, также называемые KRL-AG2 (ATCC 20847; BioControl 57, 687-696, 2012; например, Plantshield® от BioWorks Inc., США или SabrEx™ от Advanced Biological Marketing Inc., Van Wert, OH,  
 20 США).  
 25 США).

В соответствии с другим вариантом осуществления смесей, по меньшей мере один пестицид II выбран из групп L1) - L5):

L1) Микробные пестициды с фунгицидной, бактерицидной, вирулицидной активностью и/или активностью активатора защиты растений: *Aureobasidium pullulans* DSM 14940 и DSM 14941 (L1.1), *Bacillus amyloliquefaciens* AP-188  
 30 (L.1.2), *B. amyloliquefaciens* ssp. *plantarum* D747 (L.1.3), *B. amyloliquefaciens* ssp. *plantarum* FZB24 (L.1.4), *B. amyloliquefaciens* ssp. *plantarum* FZB42 (L.1.5), *B. amyloliquefaciens* ssp. *plantarum* MBI600 (L.1.6), *B. amyloliquefaciens* ssp. *plantarum* QST-713 (L.1.7), *B. amyloliquefaciens* ssp. *plantarum* TJ1000 (L.1.8), *B.*

- pumilus* GB34 (L.1.9), *B. pumilus* GHA 180 (L.1.10), *B. pumilus* INR-7 (L.1.11), *B. pumilus* KFP9F (L.1.12), *B. pumilus* QST 2808 (L.1.13), *B. simplex* ABU 288 (L.1.14), *B. subtilis* FB17 (L.1.15), *Coniothyrium minitans* CON/M/91-08 (L.1.16), *Metschnikowia fructicola* NRRL Y-30752 (L.1.17), *Paenibacillus alvei* NAS6G6 (L.1.18), *P. epiphyticus* Lu17015 (L.1.25), *P. polymyxa* ssp. *plantarum* Lu16774 (L.1.26), *P. p.* ssp. *plantarum* штамм Lu17007 (L.1.27), *Penicillium bilaiae* ATCC 22348 (L.1.19), *P. bilaiae* ATCC 20851 (L.1.20), *Penicillium bilaiae* ATCC 18309 (L.1.21), *Streptomyces microflavus* NRRL B-50550 (L.1.22), *Trichoderma asperelloides* JM41R (L.1.23), *T. harzianum* T-22 (L.1.24);
- 10 L2) Биохимические пестициды с фунгицидной, бактерицидной, вирулицидной активностью и/или активностью активатора защиты растений: белок гарпин (L.2.1), экстракт *Reynoutria sachalinensis* (L.2.2);
- L3) Микробные пестициды, обладающие инсектицидной, акарицидной, моллюскоцидной и/или нематицидной активностью: *Bacillus firmus* I-1582 (L.3.1); *B. thuringiensis* ssp. *aizawai* ABTS-1857 (L.3.2), *B. t.* ssp. *kurstaki* ABTS-351 (L.3.3), *B. t.* ssp. *kurstaki* SB4 (L.3.4), *B. t.* ssp. *tenebrionis* NB-176-1 (L.3.5), *Beauveria bassiana* GHA (L.3.6), *B. bassiana* JW-1 (L.3.7), *B. bassiana* PPRI 5339 (L.3.8), *Burkholderia* sp. A396 (L.3.9), нуклеополигедровирус *Helicoverpa armigera* (HearNPV) (L.3.10), нуклеополигедровирус *Helicoverpa zea* (ГцNPV) (L.3.11), АВА-NPV-U (L.3.11), однокапсидный нуклеополигедровирус *Helicoverpa zea* (ГцSNPV) (L.3.12), *Heterohabditis bacteriophora* (L.3.13), *Isaria fumosorosea* Аропка-97 (L.3.14), *Metarhizium anisopliae* var. *anisopliae* F52 (L.3.15), *Paecilomyces lilacinus* 251 (L.3.16), *Pasteuria nishizawae* Pn1 (L.3.17), *Steinernema carpocapsae* (L.3.18), *S. feltiae* (L.3.19);
- 20
- 25 L4) Биохимические пестициды с инсектицидной, акарицидной, моллюскоцидной, феромонной и/или нематицидной активностью: цис-жасмон (L.4.1), метилжасмонат (L.4.2), экстракт квиллайи (L.4.3);
- L5) Микробные пестициды со снижающей стресс растений, регулирующей рост растений, стимулирующей рост растений и/или повышающей урожайность
- 30 активностью: *Azospirillum brasilense* Ab-V5 и Ab-V6 (L.5.1), *A. brasilense* Sp245 (L.5.2), *Bradyrhizobium elkanii* SEMIA 587 (L.5.3), *B. elkanii* SEMIA 5019 (L.5.4), *B. japonicum* 532c (L.5.5), *B. japonicum* E-109 (L.5.6), *B. japonicum* SEMIA 5079 (L.5.7), *B. japonicum* SEMIA 5080 (L.5.8).

Кроме того, настоящее изобретение относится к агрохимическим композициям, содержащим смесь по меньшей мере одного соединения I (компонент 1) и по меньшей мере одного биопестицида, выбранного из группы L) (компонент 2), в особенности по меньшей мере одного биопестицида, выбранного из групп L1) и L2), как описано выше, и при желании по меньшей мере одного пригодного вспомогательного средства.

Кроме того, настоящее изобретение относится к агрохимическим композициям, содержащим смесь по меньшей мере одного соединения I (компонент 1) и по меньшей мере одного биопестицида, выбранного из группы L) (компонент 2), в особенности по меньшей мере одного биопестицида, выбранного из групп L3) и L4), как описано выше, и при желании по меньшей мере одного пригодного вспомогательного средства.

Предпочтение также отдается смесям, содержащим в качестве пестицида II (компонент 2) биопестицид, выбранный из групп L1), L3) и L5), предпочтительно выбранный из штаммов, обозначенных выше как (L.1.2), (L.1.3), (L.1.4), (L.1.5), (L.1.6), (L.1.7), (L.1.8), (L.1.10), (L.1.11), (L.1.12), (L.1.13), (L.1.14), (L.1.15), (L.1.17), (L.1.18), (L.1.19), (L.1.20), (L.1.21), (L.1.25), (L.1.26), (L.1.27), (L.3.1); (L.3.9), (L.3.16), (L.3.17), (L.5.1), (L.5.2), (L.5.3), (L.5.4), (L.5.5), (L.5.6), (L.5.7), (L.5.8); (L.4.2), и (L.4.1); даже более предпочтительно выбранный из (L.1.2), (L.1.6), (L.1.7), (L.1.8), (L.1.11), (L.1.12), (L.1.13), (L.1.14), (L.1.15), (L.1.18), (L.1.19), (L.1.20), (L.1.21), (L.3.1); (L.3.9), (L.3.16), (L.3.17), (L.5.1), (L.5.2), (L.5.5), (L.5.6); (L.4.2), и (L.4.1). Эти смеси особенно подходят для обработки материалов для размножения растений, т.е. для обработки семян, а также для обработки почвы. Эти смеси для обработки семян особенно подходят для таких культур, как зерновые, кукуруза и зернобобовые растения, такие как соя.

Предпочтение также отдается смесям, содержащим в качестве пестицида II (компонент 2) биопестицид, выбранный из групп L1), L3) и L5), предпочтительно выбранный из штаммов, обозначенных выше как (L1.1), (L.1.2), (L.1.3), (L.1.6), (L.1.7), (L.1.9), (L.1.11), (L.1.12), (L.1.13), (L.1.14), (L.1.15), (L.1.17), (L.1.18), (L.1.22), (L.1.23), (L.1.24), (L.1.25), (L.1.26), (L.1.27), (L.2.2); (L.3.2), (L.3.3), (L.3.4), (L.3.5), (L.3.6), (L.3.7), (L.3.8), (L.3.10), (L.3.11), (L.3.12), (L.3.13), (L.3.14), (L.3.15), (L.3.18), (L.3.19); (L.4.2), даже более предпочтительно выбранный из (L.1.2), (L.1.7), (L.1.11), (L.1.13), (L.1.14),

(L.1.15), (L.1.18), (L.1.23), (L.3.3), (L.3.4), (L.3.6), (L.3.7), (L.3.8), (L.3.10), (L.3.11), (L.3.12), (L.3.15), и (L.4.2). Эти смеси особенно подходят для внекорневой обработки культурных растений, предпочтительно овощей, фруктов, винограда, зерновых, кукурузы и зернобобовых культур, таких как соя.

5 Композиции, содержащие смеси активных ингредиентов, можно приготовить обычными способами, например, способами, указанными для композиций соединений I.

10 Когда живые микроорганизмы, такие как пестициды II из групп L1), L3) и L5), образуют часть композиций, такие композиции можно приготовить обычными способами (например, H.D. Burges: Formulation of Microbial Biopesticides, Springer, 1998; WO 2008/002371, US 6,955,912, US 5,422,107).

#### I. Примеры синтеза

Пример 1: (8-фтор-3-хинолил)-(2-нитрофенил)метанол

15 К смеси 8-фтор-3-йод-хинолина (15 г, 0,055 моль) в ТГФ (200 мл) добавляли по каплям при 0°C в атмосфере N<sub>2</sub> i-PrMgCl (2M) (36 мл, 0,0715 моль) и смесь перемешивали в течение 20 минут при 0°C. Затем при 0°C по каплям добавляли раствор 2-нитробензальдегида (10 г, 0,066 моль) в ТГФ (10 мл) и смесь перемешивали при 20°C в течение 16 часов. Реакционную смесь гасили водным раствором NH<sub>4</sub>Cl (200 мл) и экстрагировали EtOAc (100 мл).

20 Органический слой сушили над безводным сульфатом магния, концентрировали в вакууме и остаток очищали на колонке с силикагелем (PE: EtOAc=47%~100%) с получением указанного в заголовке соединения в виде твердого вещества зеленого цвета.

25 <sup>1</sup>H ЯМР: (400 МГц, CHLOROFORM-d): δ = 3.56 - 3.92 (m, 1 H) 6.70 (s, 1 H) 7.37 - 7.43 (m, 1 H) 7.46 - 7.55 (m, 2 H) 7.59 (d, J=8.16 Гц, 1 H) 7.70 (td, J=7.62, 1.19 Гц, 1 H) 7.83 (dd, J=7.91, 1.25 Гц, 1 H) 8.03 (dd, J=8.16, 1.25 Гц, 1 H) 8.19 (s, 1 H) 8.90 (d, J=2.01 Гц, 1 H)

Пример 2: (8-фтор-3-хинолил)-(2-нитрофенил)метанол

30 К смеси никеля Ренея (500 мг) в EtOH (10 мл) добавляли раствор (8-фтор-3-хинолил)-(2-нитрофенил)метанола (1,6 г, 5,4 ммоль) в EtOH (200 мл), и смесь перемешивали в течение 2 часов при 20°C в атмосфере H<sub>2</sub> (15 фунтов/квдратный дюйм). Реакционную смесь фильтровали, фильтрат концентрировали при пониженном давлении и сырой продукт промывали МТВЕ (30 мл) с получением указанного в заголовке соединения в виде желтого

твёрдого вещества. Указанное в заголовке соединение непосредственно использовали без дополнительной очистки.

<sup>1</sup>H ЯМР (400 МГц, CDCl<sub>3</sub>):  $\mu$  [м.д.]: 2.78 - 2.92 (m, 1 H) 4.01 - 4.17 (m, 2 H) 6.14 (s, 1 H) 6.74 (d,  $J=8.03$  Гц, 1 H) 6.80 (t,  $J=7.47$  Гц, 1 H) 7.09 (br d,  $J=7.78$  Гц, 1 H) 7.20 (br t,  $J=7.78$  Гц, 1 H) 7.39 - 7.44 (m, 1 H) 7.51 (td,  $J=7.91, 4.89$  Гц, 1 H) 7.62 (d,  $J=7.91$  Гц, 1 H) 8.21 (s, 1 H) 8.99 (d,  $J=1.63$  Гц, 1H).

Пример 3: (2-аминофенил)-(8-фтор-3-хинолил)метанон

К раствору (8-фтор-3-хинолил)-(2-нитрофенил)метанола (1 г, 3,73 ммоль) в ДМФА (15 мл) добавляли CuCl (37 мг, 0,373 ммоль) и K<sub>2</sub>CO<sub>3</sub> (1,03 г, 7,46 ммоль), затем смесь перемешивали в течение 16 ч при 60°C в атмосфере O<sub>2</sub>. Реакционный раствор гасили соляным раствором (100 мл) и экстрагировали EtOAc (80 мл). Органические вещества промывали соляным раствором (100 мл x 2), сушили над безводным сульфатом магния и концентрировали в вакууме. Очистка жидкостной хроматографией на силикагеле (PE:EtOAc = ~30%) давала

указанное в заголовке соединение в виде желтого твёрдого вещества.

<sup>1</sup>H ЯМР (400 МГц, CDCl<sub>3</sub>):  $\mu$  [м.д.]: 6.03 - 6.34 (m, 2 H) 6.57 (ddd,  $J=8.06, 7.06, 1.07$  Гц, 1 H) 6.72 (dd,  $J=8.41, 0.75$  Гц, 1 H) 7.29 (ddd,  $J=8.41, 7.03, 1.51$  Гц, 1 H) 7.37 (dd,  $J=8.09, 1.44$  Гц, 1 H) 7.42 - 7.55 (m, 2 H) 7.65 (d,  $J=8.03$  Гц, 1 H) 8.37 (t,  $J=1.76$  Гц, 1 H) 9.13 (d,  $J=2.13$  Гц, 1 H)

Пример 4: 4-(8-фтор-3-хинолил)-2,2-диметил-1H-хиназолин

К смеси (2-аминофенил)-(8-фтор-3-хинолил)метанола (700 мг, 2,63 ммоль) в ацетоне (10 мл) добавляли NH<sub>4</sub>OAc (1 г, 13,2 ммоль) и молекулярные сита 4 Å (1,5 ж) в атмосфере N<sub>2</sub> и смесь перемешивали при 60°C в течение 2 часов. Реакционную смесь фильтровали, фильтрат промывали водным раствором NaHCO<sub>3</sub> (50 мл) и соляным раствором (50 мл). Затем органические вещества сушили над безводным сульфатом магния и концентрировали в вакууме. Сырой продукт очищали жидкостной хроматографией на силикагеле (PE:EtOAc=3:1) с получением указанного в заголовке соединения в виде желтого твёрдого вещества.

<sup>1</sup>H ЯМР (400 МГц, CDCl<sub>3</sub>):  $\mu$  [м.д.]: 9.02 (d,  $J=1.88$  Гц, 1 H), 8.33 (br s, 1 H), 7.62 (d,  $J=8.00$  Гц, 1 H), 7.32 - 7.51 (m, 2 H), 7.19 - 7.23 (m, 1 H), 6.98 (d,  $J=7.63$  Гц, 1 H), 6.55 - 6.66 (m, 2 H), 3.96 - 4.14 (br, 1 H), 1.55 (s, 6 H)

Пример 5: 4-(8-фтор-3-хинолил)-1,2,2-триметил-хиназолин

К смеси 4-(8-фтор-3-хинолил)-2,2-диметил-1Н-хиназолина (250 мг, 0,82 ммоль) в ДМФА (10 мл) добавляли NaH (~60%) (66 мг, 1,64 ммоль) при 0°C в атмосфере N<sub>2</sub>, и смесь перемешивали при 0°C в течение 0,5 часа. Затем добавляли метилйодид (175 мг, 1,23 ммоль), и смесь перемешивали при 20°C в течение 16 часов. Реакционную смесь разбавляли соляным раствором (50 мл), экстрагировали EtOAc (50 мл), объединенный органический слой промывали соляным раствором (80 мл x 2), сушили над безводным сульфатом магния и концентрировали в вакууме. Сырой продукт очищали жидкостной хроматографией на силикагеле (PE: EtOAc~30%) с получением указанного в заголовке соединения в виде желтого масла.

<sup>1</sup>H ЯМР (400 МГц, CDCl<sub>3</sub>):  $\mu$  [м.д.]: 9.02 (d,  $J=1.88$  Гц, 1H), 8.31 (br s, 1H), 7.61 (d,  $J=8.16$  Гц, 1H), 7.28 - 7.48 (m, 3H), 6.98 (dd,  $J=7.65, 1.25$  Гц, 1H), 6.70 (d,  $J=8.28$  Гц, 1H), 6.60 (t,  $J=7.47$  Гц, 1H), 2.88 (s, 3H), 1.53 (s, 6H)

Пример 6: 1-[8-фтор-4-(8-фтор-3-хинолил)-2,2-диметил-хиназолин-1-ил]этанон

8-фтор-4-(8-фтор-3-хинолил)-2,2-диметил-1Н-хиназолин (200 мг, 0,31 ммоль) добавляли к раствору Ac<sub>2</sub>O (4 мл) и пиридина (0,2 мл) при 25°C в атмосфере N<sub>2</sub>, и смесь перемешивали при 145°C в течение 16 часов.

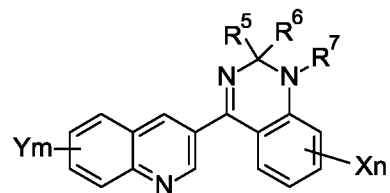
Реакционную смесь концентрировали при пониженном давлении, и сырой продукт очищали методом высокоэффективной жидкостной хроматографии на силикагеле (ВЭЖХ-колонка Kinetex XB C18 1,7 мкм (50 x 2,1 мм); элюент: ацетонитрил/вода (градиент от 5:95 до 100:0 за 1,5 мин при 60°C, градиент потока от 0,8 до 1,0 мл/мин за 1,5 мин) с получением указанного в заголовке соединения в виде желтого твердого вещества.

<sup>1</sup>H ЯМР (400 МГц, CDCl<sub>3</sub>):  $\mu$  [м.д.]: 9.24 (d,  $J=2.1$  Гц, 1H), 8.51 (t,  $J=1.7$  Гц, 1H), 7.72 (d,  $J=8.2$  Гц, 1H), 7.61 - 7.48 (m, 2H), 7.35 - 7.29 (m, 1H), 7.22 (dt,  $J=4.9, 7.9$  Гц, 1H), 7.13 (dd,  $J=1.0, 7.6$  Гц, 1H), 2.22 (d,  $J=4.8$  Гц, 3H), 1.79 (s, 6H)

Соединения, перечисленные в Таблице I, получали аналогичным образом.

Таблица I:

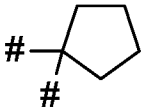
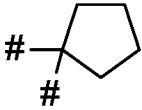
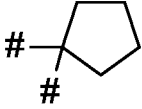
Соединения Прим.-1 - Прим.-13 формулы I

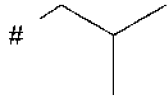
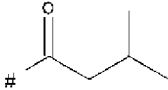
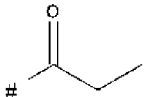


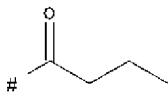
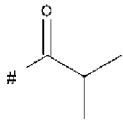
5

Прим.-№	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	Y <sub>m</sub>	X <sub>n</sub>	R <sup>7</sup>	RT	M+H	MP (°C)
Прим.-1	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	8-F	H	H	0.832	306.1	
Прим.-2	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	8-F	H	CH <sub>3</sub>	0.855	320.1	
Прим.-3	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	8-F	8-F	H	0.791	323.9	142
Прим.-4	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	8-F	8-F	CH <sub>3</sub>	0.848	338	130



Прим.-№	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	Y <sub>m</sub>	X <sub>n</sub>	R <sup>7</sup>	RT	M+H	MP (°C)
Прим.-5			8-F	H	H	0.828	332.1	
Прим.-6			8-F	H	CH <sub>3</sub>	0.857	346.1	157
Прим.-7			8-F	H	CN	1.25	357.3	123
Прим.-8	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	8-F	H	CN	1.136	331.1	172
Прим.-9	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	8-F	8-F	н-бутил	1.015	380.2	
Прим.-10	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	8-F	8-F	этил	0.911	352.3	158
Прим.-11	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	8-F	8-F	н-пропил	0.972	366.3	153

Прим.-№	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	Ym	Xn	R <sup>7</sup>	RT	M+H	MP (°C)
Прим.-12	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	8-F	8-Cl	H	0.865	339.9	
Прим.-13	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	8-F	8-Cl	CH <sub>3</sub>	0.923	353.9	143
Прим.-14	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	8-F	8-F	изопропил	0.949	348.0	
Прим.-15	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	8-F	8-F	# 	1.004	380.3	168
Прим.-16	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	8-F	8-F	# 	1.281	408.4	183
Прим.-17	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	8-F	8-F	ацетил	1.091	366.3	131
Прим.-18	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	8-F	8-F	# 	1.175	380.3	185

Прим.-№	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	Ym	Xn	R <sup>7</sup>	RT	M+H	MP (°C)
Прим.-19	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	8-F	8-F		1.235	394.3	154
Прим.-20	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	8-F	H	ацетил	1.021	348.2	163.3
Прим.-21	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	8-F	8-F		1.123	394.0	214.7
Прим.-22	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	8-F	8-F	CN	1.085	349.2	186
Прим.-23	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	8-F	8-Cl	CN	1.251	365.1	167
Прим.-24	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	8-F	H	0.805	306.2	118
Прим.-25	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	8-F	CH <sub>3</sub>	0.855	320.2	99

Прим.-№	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	Y <sub>m</sub>	X <sub>n</sub>	R <sup>7</sup>	RT	M+H	MP (°C)
Прим.-26	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	8-F	CN	0.989	331.2	175
Прим.-27	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	8-Cl	H	0.858	322.1	
Прим.-28	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	8-Cl	CH <sub>3</sub>	0.907	336.2	116
Прим.-29	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	8-Cl	8-F	CN	1.189	365.1	209
Прим.-30	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	8-Cl	8-F	H	0.874	340.2	156
Прим.-31	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	8-Cl	8-F	CH <sub>3</sub>	0.924	354.1	125
Прим.-32	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	8-Cl	H	H	0.866	322.1	150


Прим.-№	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	Y <sub>m</sub>	X <sub>n</sub>	R <sup>7</sup>	RT	M+H	MP (°C)
Прим.-33	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	8-Cl	H	CH <sub>3</sub>	0.891	336.1	
Прим.-34	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	8-Cl	H	CN	1.213	347.1	227
Прим.-35	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	8-Cl	CN	1.008	347.1	233
Прим.-36	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	8-Cl	8-Cl	H	0.934	356.1	116
Прим.-37	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	8-CH <sub>3</sub>	8-F	H	0.897	320.2	167
Прим.-38	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	8-CH <sub>3</sub>	8-F	CN	1.132	345.2	174
Прим.-39	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	8-Cl	8-Cl	CH <sub>3</sub>	0.964	370.0	180

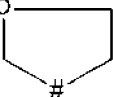
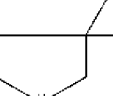
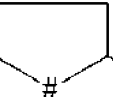
Прим.-№	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	Y <sub>m</sub>	X <sub>n</sub>	R <sup>7</sup>	RT	M+H	MP (°C)
Прим.-40	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	8-Cl	8-Cl	CN	1.206	381.0	241
Прим.-41	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	7,8-F <sub>2</sub>	H	CH <sub>3</sub>	0.838	337.9	133.2
Прим.-42	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	8-CH <sub>3</sub>	8-F	CH <sub>3</sub>	0.908	334.0	87
Прим.-43	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	8-CH <sub>3</sub>	H	CN	1.163	327.2	146.5
Прим.-44	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	8-CH <sub>3</sub>	8-Cl	H	0.946	336.2	111.5
Прим.-45	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	8-CH <sub>3</sub>	8-Cl	CH <sub>3</sub>	0.987	350.2	113
Прим.-46	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	8-CH <sub>3</sub>	8-Cl	CN	1.181	361.2	178.5

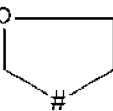
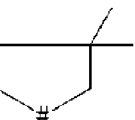
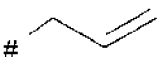
Прим.-№	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	Y <sub>m</sub>	X <sub>n</sub>	R <sup>7</sup>	RT	M+H	MP (°C)
Прим.-47	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	7,8-F <sub>2</sub>	H	CN	1.206	349.2	206.5
Прим.-48	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	8-CH <sub>3</sub>	H	H	0.891	302.2	171
Прим.-49	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	8-CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	0.907	316.2	
Прим.-49''	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	7,8-F <sub>2</sub>	H	H	0.846	324.2	83
Прим.-50	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	7,8-F <sub>2</sub>	8-F	H	0.859	342.2	130
Прим.-51	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	7,8-F <sub>2</sub>	8-Cl	H	0.927	358.1	165
Прим.-52	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H	H	0.782	387.9	103

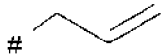
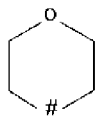
Прим.-№	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	Y <sub>m</sub>	X <sub>n</sub>	R <sup>7</sup>	RT	M+H	MP (°C)
Прим.-53	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H	CH <sub>3</sub>	0.815	302.2	
Прим.-54	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H	CN	1.007	313.2	55.6
Прим.-55	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	7,8-F <sub>2</sub>	8-F	CH <sub>3</sub>	0.916	356.2	142.5
Прим.-56	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	7,8-F <sub>2</sub>	8-F	CN	1.171	367.2	190
Прим.-57	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	7,8-F <sub>2</sub>	8-Cl	CH <sub>3</sub>	0.973	371.8	181
Прим.-58	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	7,8-F <sub>2</sub>	8-Cl	CN	1.198	382.8	240
Прим.-59	CH <sub>3</sub>	изопропил	8-F	H	H	0.868	333.9	80

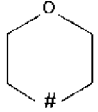




Прим.-№	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	Y <sub>m</sub>	X <sub>n</sub>	R <sup>7</sup>	RT	M+H	MP (°C)
Прим.-60	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	8-F	H		0.937	360.0	
Прим.-61	(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub>		8-F	8-F	CH <sub>3</sub>	0.911	349.9	
Прим.-62	CH <sub>3</sub>	4-F-фенил	8-F	H	H	0.935	385.9	101.5
Прим.-63	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	7,8-F <sub>2</sub>	H	0.710	323.8	180
Прим.-64	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	7,8-F <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	0.775	337.9	103
Прим.-65	CH <sub>3</sub>	изопропил	8-F	H	CN	1.281	358.9	251
Прим.-66	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	8-F	H	H	0.835	349.9	

Прим.-№	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	Y <sub>m</sub>	X <sub>n</sub>	R <sup>7</sup>	RT	M+H	MP (°C)
Прим.-67			8-F	H	H	0.782	333.8	99
Прим.-68	CH <sub>3</sub>	4-F-фенил	8-F	H	CN	1.273	410.9	
Прим.-69	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	8-F	H	CN	1.216	399.2	
Прим.-70	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	8-F	H	CN	1.150	375.2	
Прим.-71			8-F	H	H	0.945	359.9	135
Прим.-72			8-F	H	H	0.897	346.2	
Прим.-73	CH <sub>3</sub>	4-F-бензил	8-F	H	CN	1.305	425.3	

Прим.-№	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	Y <sub>m</sub>	X <sub>n</sub>	R <sup>7</sup>	RT	M+H	MP (°C)
Прим.-74	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	7,8-F <sub>2</sub>	CN	0.889	349.2	186
Прим.-75	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	8-F	7,8-F <sub>2</sub>	H	0.864	342.2	122
Прим.-76	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	8-F	7,8-F <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	0.925	356.2	122
Прим.-77			8-F	H	CN	1.076	359.2	94
Прим.-78			8-F	H	CN	1.380	385.1	140.7
Прим.-79	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> F	8-F	H	H	0.814	323.8	
Прим.-80	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	8-F	H		0.888	346.0	

Прим.-№	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	Y <sub>m</sub>	X <sub>n</sub>	R <sup>7</sup>	RT	M+H	MP (°C)
Прим.-81	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	8-F	8-F	# 	0.953	363.9	159
Прим.-82	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> F	8-F	H	CN	1.123	348.8	214.5
Прим.-83	этил	этил	8-F	H	H	0.876	334.2	
Прим.-84	(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub>		8-F	H	H	0.886	346.0	
Прим.-85			8-F	H	H	0.801	348.2	
Прим.-86	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	8-F	7,8-F <sub>2</sub>	CN	1.153	367.2	199.6
Прим.-87	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	4-CH <sub>3</sub> , 8-F	8-F	H	0.840	338.2	158.8

Прим.-№	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	Y <sub>m</sub>	X <sub>n</sub>	R <sup>7</sup>	RT	M+H	MP (°C)
Прим.-88	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	8-F	H	0.893	334.3	
Прим.-89	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	8-F	CN	1.279	358.9	
Прим.-90			H	8-F	CN	1.122	372.8	
Прим.-91			H	8-F	CN	1.349	371	
Прим.-92			H	8-F	CN	1.341	371	

### **Теплица**

Соединение растворяли в смеси ацетона и/или диметилсульфоксида и смачивающего агента/эмульгатора Wettol, который основан на этоксилированных алкилфенолах, в соотношении (объеме) растворитель-эмульгатор 99 к 1, получая общий объем 5 мл. Затем добавляли воду до общего объема 100 мл.

Затем этот исходный раствор разбавляли описанной смесью растворитель-эмульгатор-вода до конечной концентрации, приведенной в Таблице ниже.

#### **Пример 1 - Профилактическая фунгицидная борьба с *Botrytis cinerea* на листьях зеленого перца**

Молодые саженцы зеленого перца выращивали в горшках до стадии 4–5 листьев. Эти растения опрыскивали до стекания капель ранее описанным раствором для опрыскивания, содержащим активное вещество или смесь в концентрации, указанной в Таблице ниже. На следующий день растения инокулировали водным раствором биосолода или DOB, содержащим суспензию спор *Botrytis cinerea*. Затем растения непосредственно переносили во влажную камеру. Через 5 дней при температуре 22 - 24°C и насыщенной относительной влажности степень поражения листьев грибами оценивали визуально как % пораженной площади листа.

В этом тесте образцы, обработанные 250 м.д. активного вещества из примеров, выбранных из Прим.-2, Прим.-3, Прим.-4, Прим.-6, Прим.-7, Прим.-8, Прим.-9, Прим.-10, Прим.-11, Прим.-12, Прим.-13, Прим.-14, Прим.-15, Прим.-18, Прим.-20, Прим.-22, Прим.-23, Прим.-25, Прим.-26, Прим.-28, Прим.-31, Прим.-39, Прим.-42, Прим.-43, Прим.-45, Прим.-46, Прим.-47, Прим.-54, Прим.-55, Прим.-60, Прим.-61, Прим.-65 и Прим.-76, соответственно, показали не более чем на 13 % роста патогена, тогда как необработанные растения были инфицированы на 80 %.

#### **Пример 2 - Профилактическая фунгицидная борьба с белой плесенью на масличном рапсе, вызванной *Slerotinia sclerotiorum* SCLESC P1 OSR**

Растения масличного рапса выращивали в горшках до стадии 13–14 листьев. Эти растения опрыскивали до стекания капель ранее описанным раствором для опрыскивания, содержащим активное вещество или смесь в концентрации, указанной в Таблице ниже.

Растения могли засохнуть на воздухе. На следующий день примененные лепестки рапса фиксировали с помощью 25 мкл 2,5% метилцеллюлозы на листе 1, и на каждый фиксированный лепесток рапса пипеткой наносили 2.25 мкл суспензии спор *Sclerotinia sclerotiorum*. Через 14 дней при температуре 20°C и 5 относительной влажности 60 % визуально оценивали степень поражения листьев грибами как % пораженной площади листа.

В этом тесте образцы, обработанные 100 г/га активного вещества из примеров, выбранных из Прим.-2, Прим.-3, Прим.-4, Прим.-6, Прим.-7, Прим.-8, 10 Прим.-9, Прим.-10, Прим.-11, Прим.-12, Прим.-13, Прим.-15, Прим.-22, Прим.-25, Прим.-26, соответственно, показали не более чем на 12 % роста патогена, тогда как необработанные растения были инфицированы на 80 %.

**Пример 3 - Профилактическая фунгицидная борьба с белой плесенью на соевых бобах, вызванной *Sclerotinia sclerotiorum* (SCLESC P1)**

Молодые саженцы сои выращивали в горшках. Эти растения опрыскивали 15 до стекания капель ранее описанным раствором для опрыскивания, содержащим активное вещество или смесь в концентрации, указанной в Таблице ниже. На следующий день обработанные растения инокулировали суспензией биосолода, содержащей мицелий *Sclerotinia sclerotiorum*. Затем тестируемые растения культивировали в течение 6 дней в тепличной камере при температуре 23°C и 20 относительной влажности между 80 и 85%. Степень поражения листьев грибами оценивали визуально как % пораженной площади листа.

В этом тесте образцы, обработанные 250 м.д. активного вещества из примеров, выбранных из Прим.-8, Прим.-11, Прим.-13, Прим.-14, Прим.-22, 25 Прим.-25, Прим.-26, Прим.-28, Прим.-31, Прим.-39, Прим.-42, Прим.-43, Прим.-45, Прим.-47, Прим.-55, Прим.-60, Прим.-65, Прим.-76 и Прим.-77, соответственно, показали не более чем на 15 % роста патогена, тогда как необработанные растения были инфицированы на 80 %.

**Микротест**

Активные соединения готовили отдельно в виде исходного раствора с 30 концентрацией 10000 м.д. в диметилсульфоксиде.

Исходные растворы смешивали в соответствующем соотношении, наносили пипеткой на микротитрационный планшет (МТР) и разбавляли водой до установленных концентраций.

**Пример 1 - Активность в отношении серой гнили *Botrytis cinerea* в тесте на микротитрационном планшете**

Затем добавляли суспензию спор *Botrytis cinerea* в водном растворе биосолода или дрожжей-бактопептона-ацетата натрия.

5 В этом тесте образцы, обработанные 31 м.д. активного вещества из Прим.-1, Прим.-2, Прим.-3, Прим.-4, Прим.-5, Прим.-6, Прим.-7, Прим.-8, Прим.-9, Прим.-10, Прим.-11, Прим.-12, Прим.-13, Прим.-14, Прим.-15, Прим.-16, Прим.-17, Прим.-18, Прим.-19, Прим.-20, Прим.-21, Прим.-22, Прим.-23, Прим.-24, Прим.-25, Прим.-26, Прим.-27, Прим.-28, Прим.-29, Прим.-30, Прим.-31, Прим.-10  
32, Прим.-33, Прим.-34, Прим.-35, Прим.-36, Прим.-37, Прим.-38, Прим.-39, Прим.-40, Прим.-41, Прим.-42, Прим.-43, Прим.-44, Прим.-45, Прим.-46, Прим.-47, Прим.-48, Прим.-49, Прим.-49', Прим.-50, Прим.-51, Прим.-52, Прим.-53, Прим.-54, Прим.-55, Прим.-56, Прим.-57, Прим.-58, Прим.-59, Прим.-60, Прим.-61, Прим.-62, Прим.-63, Прим.-64, Прим.-65, Прим.-66, Прим.-67, Прим.-68,  
15 соответственно, показали до 14 % роста патогена

**Пример 2 - Активность в отношении *Fusarium culmorum* в тесте на микротитрационном планшете**

Затем добавляли суспензию спор *Fusarium culmorum* в водном растворе биосолода или дрожжей-бактопептона-глицерина или ДОВ.

20 В этом тесте образцы, обработанные 8 м.д. активного вещества из Прим.-6, Прим.-7, Прим.-8, Прим.-10 и Прим.-11, соответственно, показали до 1 % роста патогена.

В этом тесте образцы, обработанные 31 м.д. активного вещества из Прим.-2, Прим.-3, Прим.-4, Прим.-6, Прим.-7, Прим.-8, Прим.-10, Прим.-11, Прим.-12, 25 Прим.-13, Прим.-14, Прим.-17, Прим.-18, Прим.-19, Прим.-20, Прим.-22, Прим.-23, Прим.-25, Прим.-26, Прим.-27, Прим.-28, Прим.-29, Прим.-30, Прим.-31, Прим.-33, Прим.-34, Прим.-35, Прим.-36, Прим.-37, Прим.-38, Прим.-39, Прим.-40, Прим.-41, Прим.-42, Прим.-43, Прим.-44, Прим.-45, Прим.-46, Прим.-47, Прим.-49, Прим.-50, Прим.-51, Прим.-53, Прим.-54, Прим.-55, Прим.-57, Прим.-30  
60, Прим.-61, Прим.-62, Прим.-64, Прим.-65, Прим.-67, Прим.-68,  
30 соответственно, показали до 20 % роста патогена.



**Пример 3 - Активность в отношении пятнистости листьев пшеницы, вызванной *Septoria tritici***

Затем добавляли суспензию спор *Septoria tritici* в водном растворе биосолода или дрожжей-бактопептона-глицерина или DOB.

5 В этом тесте образцы, обработанные 8 м.д. активного вещества из Прим.-6, Прим.-7, Прим.-8, Прим.-9, Прим.-10 и Прим.-11, соответственно, показали 19 % роста патогена.

10 В этом тесте образцы, обработанные 31 м.д. активного вещества из Прим.-2, Прим.-3, Прим.-4, Прим.-6, Прим.-7, Прим.-9, Прим.-10, Прим.-11, Прим.-12, Прим.-13, Прим.-14, Прим.-17, Прим.-18, Прим.-19, Прим.-20, Прим.-23, Прим.-25, Прим.-26, Прим.-27, Прим.-28, Прим.-31, Прим.-35, Прим.-36, Прим.-39, Прим.-41, Прим.-42, Прим.-44, Прим.-45, Прим.-49, Прим.-50, Прим.-51, Прим.-55, Прим.-57, Прим.-59, Прим.-60, Прим.-61, соответственно, показали до 18 % роста патогена.

15 Измеренные параметры сравнивали с ростом контрольного варианта, не содержащего активного соединения (100%), и холостой пробой, не содержащей грибков, для определения относительного роста % патогенов в соответствующих активных соединениях.

**Пример 4 - Активность в отношении серой плесени *Pyricularia oryzae* в тесте на микротитрационном планшете**

20 Затем добавляли суспензию спор *Pyricularia oryzae* в водном растворе биосолода или дрожжей-бактопептона-ацетата натрия.

25 В этом тесте образцы, обработанные 31 м.д. активного вещества из Прим.-1, Прим.-2, Прим.-3, Прим.-4, Прим.-6, Прим.-7, Прим.-8, Прим.-9, Прим.-10, Прим.-11, Прим.-13, Прим.-14, Прим.-15, Прим.-16, Прим.-17, Прим.-18, Прим.-19, Прим.-20, Прим.-22, Прим.-23, Прим.-29, соответственно, показали до 20 % роста патогена.

**Пример 5 - Активность в отношении серой плесени *Cercospora beticola* в тесте на микротитрационном планшете**

30 Затем добавляли суспензию спор *Cercospora beticola* в водном растворе биосолода или дрожжей-бактопептона-ацетата натрия.

В этом тесте образцы, обработанные 31 м.д. активного вещества из Прим.-4, Прим.-6, Прим.-10, Прим.-12, Прим.-13, Прим.-14, Прим.-17, Прим.-18, Прим.-19, Прим.-25, Прим.-26, соответственно, показали до 20 % роста патогена.

**Пример 6 - Активность в отношении серой плесени *Cercospora sojae* в тесте на микротитрационном планшете**

Затем добавляли суспензию спор *Cercospora sojae* в водном растворе биосолода или дрожжей-бактопептона-ацетата натрия.

5 В этом тесте образцы, обработанные 31 м.д. активного вещества из Прим.-2, Прим.-3, Прим.-4, Прим.-6, Прим.-9, Прим.-10, Прим.-11, Прим.-12, Прим.-13, Прим.-14, Прим.-17, Прим.-18, Прим.-19, Прим.-26, соответственно, показали до 12 % роста патогена.

10 **Пример 7 - Активность в отношении серой плесени *Cercospora zeaе maydis* в тесте на микротитрационном планшете**

Затем добавляли суспензию спор *Cercospora zeaе maydis* в водном растворе биосолода или дрожжей-бактопептона-ацетата натрия.

15 В этом тесте образцы, обработанные 31 м.д. активного вещества из Прим.-4, Прим.-8, Прим.-11, Прим.-13, Прим.-14, Прим.-18, Прим.-22, Прим.-25, Прим.-26, соответственно, показали до 17 % роста патогена.

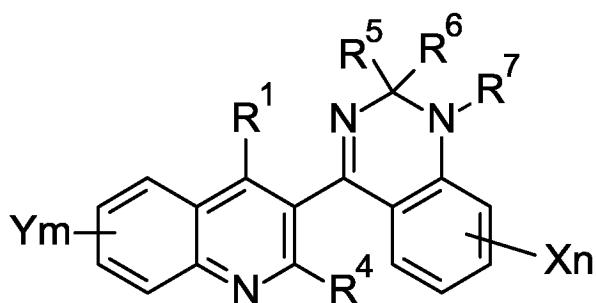
**Пример 8 - Активность в отношении серой плесени G413A мутанта *Corynespora cassiicola* в тесте на микротитрационном планшете**

Затем добавляли суспензию спор *Corynespora cassiicola* в водном растворе биосолода или дрожжей-бактопептона-ацетата натрия.

20 В этом тесте образцы, обработанные 31 м.д. активного вещества из Прим.-1, Прим.-2, Прим.-4, Прим.-5, Прим.-6, Прим.-7, Прим.-8, Прим.-10, Прим.-11, Прим.-12, Прим.-13, Прим.-14, Прим.-15, Прим.-16, Прим.-17, Прим.-18, Прим.-19, Прим.-20, Прим.-22, Прим.-23, Прим.-25, Прим.-26, Прим.-27, Прим.-28, Прим.-29, Прим.-30, Прим.-31, Прим.-32, Прим.-33, Прим.-34, Прим.-35, Прим.-36, Прим.-37, Прим.-38, Прим.-39, Прим.-40, Прим.-41, Прим.-42, Прим.-43, Прим.-44, Прим.-45, Прим.-46, Прим.-47, Прим.-48, Прим.-49, Прим.-49', Прим.-50, Прим.-51, Прим.-52, Прим.-53, Прим.-54, Прим.-55, Прим.-56, Прим.-57, Прим.-58, Прим.-59, Прим.-60, Прим.-61, Прим.-62, Прим.-63, Прим.-64, Прим.-65, Прим.-66, Прим.-67, Прим.-68, соответственно, показали до 17 %  
30 роста патогена.

## ФОРМУЛА ИЗОБРЕТЕНИЯ

## 1. Соединения формулы I



5

где

$R^1$  представляет собой H, галоген, CN,  $C_1$ - $C_4$ -алкил,  $C_1$ - $C_4$ -галогеналкил;

$R^4$  представляет собой H; галоген, CN,  $C_1$ - $C_4$ -алкил,  $C_1$ - $C_4$ -галогеналкил;

$R^5$  в каждом случае независимо выбраны из галогена, CN,  $C_1$ - $C_6$ -алкила,  
 10  $C_1$ - $C_6$ -галогеналкила,  $C_2$ - $C_6$ -алкенила,  $C_2$ - $C_6$ -галогеналкенила,  $C_2$ - $C_6$ -алкинила,  
 $C_2$ - $C_6$ -галогеналкинила, фенила, бензила,

где фенильные и бензильные фрагменты  $R^5$  являются незамещенными или  
 замещены одной-тремя группами  $R^{5a}$ , которые независимо друг от друга  
 выбраны из:

15 галогена, CN,  $C_1$ - $C_6$ -алкила,  $C_1$ - $C_6$ -галогеналкила, O- $C_1$ - $C_6$ -алкила;

$R^6$  в каждом случае независимо выбраны из галогена, CN,  $C_1$ - $C_6$ -алкила,  
 $C_1$ - $C_6$ -галогеналкила,  $C_2$ - $C_6$ -алкенила,  $C_2$ - $C_6$ -галогеналкенила,  $C_2$ - $C_6$ -алкинила,  
 $C_2$ - $C_6$ -галогеналкинила, фенила, бензила,

где фенильные и бензильные фрагменты  $R^6$  являются незамещенными или  
 20 замещены одной-тремя группами  $R^{6a}$ , которые независимо друг от друга  
 выбраны из:

галогена, CN,  $C_1$ - $C_6$ -алкила,  $C_1$ - $C_6$ -галогеналкила, O- $C_1$ - $C_6$ -алкила;

или

$R^5$  и  $R^6$  образуют вместе с C-атомами, к которым они присоединены,  $C_3$ - $C_6$ -  
 25 циклоалкил или 3- - 6-членный насыщенный гетероцикл, который содержит 1, 2  
 или 3 гетероатома из группы, состоящей из O и S;

$R^7$  в каждом случае независимо выбран из водорода, CN,  $CH_2CN$ ,  
 $CH(CH_3)CN$ ,  $CH(=O)$ ,  $C(=O)C_1$ - $C_6$ -алкила,  $C(=O)C_2$ - $C_6$ -алкенила,  $C(=O)C_2$ - $C_6$ -

- алкинила, C(=O)C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-циклоалкила, C(=O)NH-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкила, C(=O)N-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкила)<sub>2</sub>, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкила, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-галогеналкила, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-циклоалкила, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-галогенциклоалкила, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-алкенила, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-галогеналкенил C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-алкинила, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-галогеналкинила, O-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкила, -S(=O)<sub>2</sub>-R<sup>7a</sup>, пяти- или шестичленного гетероарила и арила или бензила; где гетероарил содержит один, два или три гетероатома, выбранных из N, O и S; где арильные и бензильные группы незамещены или несут один, два, три, четыре или пять заместителей, выбранных из группы, состоящей из CN, галогена, OH, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкила, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-галогеналкила, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкокси и C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-галогеналкокси; где
- 5 R<sup>7a</sup> выбран из C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкила, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-галогеналкила, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-алкенила, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-галогеналкенила, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-алкинила, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-галогеналкинила, фенила, бензила, где фенил и бензил могут быть незамещенными или замещены галогеном, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкилом, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-галогеналкилом, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-алкенилом, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-галогеналкенилом, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-алкинилом, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-галогеналкинилом;
- 10 X в каждом случае независимо выбран из галогена, CN, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкила, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-галогеналкила, O-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкила, O-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-галогеналкила;
- n представляет собой 0, 1, 2 или 3;
- Y в каждом случае независимо выбран из галогена, CN, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкила, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-галогеналкила, O-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкила;
- 15 m представляет собой 1, 2 или 3;
- и их N-оксиды и приемлемые в сельском хозяйстве соли в качестве фунгицидов.
2. Соединения по п. 1, где R<sup>5</sup> представляет собой C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкил.
3. Соединения по любому из пп. 1 - 2, где R<sup>6</sup> выбран из C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкила, фенила, бензила, где фенильные и бензильные фрагменты R<sup>6</sup> являются незамещенными или замещены одной-тремя группами R<sup>6a</sup>, которые независимо друг от друга выбраны из:
- 20 галогена, CN, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкила, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-галогеналкила, O-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкила.
4. Соединения по любому из пп. 1 - 3, где R<sup>5</sup> и R<sup>6</sup> образуют вместе с C-атомами, к которым они присоединены, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-циклоалкил.
- 30 5. Соединения по любому из пп. 1 - 4, где X выбран из галогена, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкила, O-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкила, O-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-галогеналкила.
6. Соединения по любому из пп. 1 - 5, где X выбран из F, CH<sub>3</sub>, C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, OCH<sub>3</sub>, OCHF<sub>2</sub>, OCF<sub>3</sub>.

7. Соединения по любому из пп. 1 - 5, где Y выбран из F и Cl.
  8. Соединения по любому из пп. 1 - 9, где R<sup>7</sup> выбран из H, CN, CH<sub>2</sub>CN, CH(CH<sub>3</sub>)CN, C(=O)C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкила, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкила, C(=O)NH-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкила, C(=O)N-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкила)<sub>2</sub>, S(=O)<sub>2</sub>-R<sup>7a</sup>.
- 5        9. Композиция, которая содержит одно соединение формулы I по любому из пп. 1 - 8, его N-оксид или приемлемую в сельском хозяйстве соль.
- 10        10. Способ борьбы с фитопатогенными грибами, который включает обработку грибов или материалов, растений, почвы или семян, подлежащих защите от грибкового поражения, эффективным количеством по меньшей мере одного соединения формулы I по любому из пп. 1-8, или композицией по п. 9.
11. Семена, покрытые по меньшей мере одним соединением формулы I по любому из пп. 1-8, или его приемлемой в сельском хозяйстве солью, или композицией по п. 9, в количестве от 0,1 до 10 кг в пересчете на 100 кг семян.