



УКРАЇНА

(19) UA (11) 128680 (13) C2

(51) МПК

C07D 271/06 (2006.01)
C07D 401/12 (2006.01)
C07D 403/12 (2006.01)
C07D 413/12 (2006.01)
C07D 419/12 (2006.01)
A01N 43/82 (2006.01)

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

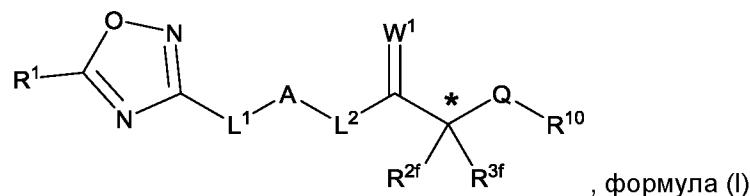
(12) ОПИС ДО ПАТЕНТУ НА ВИНАХІД

(21) Номер заяви:	a 2021 06199	(72) Винахідник(и):
(22) Дата подання заяви:	07.04.2020	Бхуджаде Парас Райбхан (IN), Найк Маруті Н. (IN), Павар Раджеш (IN), Белкар Йогеш Каширам (IN), Ауткар Сантош Шрідхар (IN), Гарг Ручі (IN), Гаде Вішванатх (IN), Клаузенер Александр Г.М. (DE), Кулкарні Шантану Ганеш (IN), Ратхоре Каран (IN)
(24) Дата, з якої є чинними права інтелектуальної власності:	26.09.2024	(73) Володілець (володільці):
(31) Номер попередньої заяви відповідно до Паризької конвенції:	201911014149	ПІ ІНДАСТРІЗ ЛІМІТЕД, Udaisagar Road, Udaipur- Rajasthan 313001, India (IN)
(32) Дата подання попередньої заяви відповідно до Паризької конвенції:	08.04.2019	(74) Представник: Михайлук Ганна Валентинівна, реєстр. №184
(33) Код держави-учасниці IN Паризької конвенції, до якої подано попередню заявку:		(56) Перелік документів, взятих до уваги експертизою: EP 3165093 A1, 10.05.2017 WO 2017/076740 A1, 11.05.2017 EP 3458446 A1, 27.03.2019 JP S63162680 A, 06.07.1988
(41) Публікація відомостей про заявку:	05.01.2022, Бюл.№ 1	
(46) Публікація відомостей про державну реєстрацію:	25.09.2024, Бюл.№ 39	
(86) Номер та дата подання міжнародної заяви, поданої відповідно до Договору РСТ	PCT/IB2020/053297, 07.04.2020	

(54) ОКСАДІАЗОЛЬНІ СПОЛУКИ ДЛЯ КОНТРОЛЮ ФІТОПАТОГЕННИХ ГРИБІВ АБО ПОПЕРЕДЖЕННЯ УРАЖЕННЯ НИМИ

(57) Реферат:

В даному винаході розкрита сполука формули (I):



де R¹, L¹, A, L², W¹, R^{2f}, R^{3f}, Q і R¹⁰ є такими, як визначено в докладному описі. Даний винахід також належить до способу одержання сполуки формули (I).

UA 128680 C2

UA 128680 C2

Даний винахід відноситься до нових оксадіазольних сполук, застосовних для боротьби з фітопатогенними грибами, комбінації на їх основі та композиції, що містить нові оксадіазольні сполуки. Даний винахід також відноситься до способу контролю фітопатогенних грибів або попередження ураження ними.

5 **ПЕРЕДУМОВИ ВИНАХОДУ**

Оксадіазоли раніше були розкриті у літературі. Наприклад, у JPS5665881, JPS63162680, JPS6296480, JPS6051188, WO2005051932, EP3165093, EP3167716, EP3165093, WO2017076740, WO2017102006, WO2017110861, WO2017110862, WO2017110864, WO2017157962, WO2017174158, WO2017198852, WO2017207757, WO2017211650, WO2017211652, WO2017220485, WO2017072247, WO2017076742, WO2017076757, WO2017076935, WO2018015447, WO2018065414, WO2018118781, WO2018187553 і WO2018202491 були розкриті різні оксадіазоли.

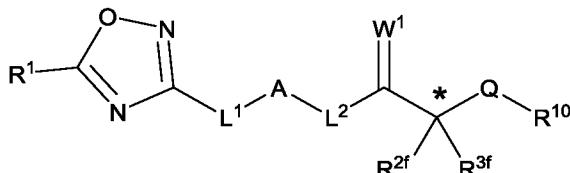
10 Оксадіазольні сполуки, вказані у вищезгаданій літературі, мають недоліки у певних аспектах, такі як те, що вони проявляють вузький спектр застосування або що вони не характеризуються задовільною фунгіцидною активністю, зокрема за низьких норм застосування.

15 Отже, об'єктом даного винаходу є забезпечення сполук, що характеризуються поліпшеною/посиленою активністю та/або ширшим спектром активності щодо фітопатогенних грибів.

20 Даня мета досягається шляхом застосування сполуки формули (I) за даним винаходом для фітопатогенних грибів або попередження ураження ними

СТИСЛИЙ ОПИС ВИНАХОДУ

Даний винахід відноситься до сполуки формули (I),



25 формула (I),

де R¹, L¹, A, L², W¹, R^{2f}, R^{3f}, Q і R¹⁰ є такими, як визначено в докладному описі. Даний винахід також відноситься до способу одержання сполуки формули (I).

На сьогодні було виявлено, що сполуки формули (I) мають переваги над сполуками, згаданими в літературі, які проявляються або в поліпшенні фунгіцидній ефективності, ширшому спектрі біологічної активності, нижчих нормах застосування, більш придатних біологічних або екологічних властивостях, або в підвищенні сумісності з рослинами.

Даний винахід додатково відноситься до комбінації, яка містить сполуку формули (I) за даним винаходом і щонайменше одну додаткову пестицидно активну речовину для ефективного фітопатогенних грибів, з якими важко боротися, або попередження ураження ними.

Даний винахід також додатково відноситься до композиції, яка містить сполуку формули (I) або сполуку формули (I) в комбінації з додатковою пестицидно активною речовиною.

Даний винахід також додатково відноситься до способу та застосування сполуки формули (I), комбінації або композиції на її основі для контролю та/або попередження захворювань 40 рослин, зокрема фітопатогенних грибів.

ДОКЛАДНИЙ ОПИС ДАНОГО ВИНАХОДУ

ВИЗНАЧЕННЯ

Визначення, представлені у даному документі для термінології, використовуваної в даному винахіді, призначені лише для ілюстративної цілі і жодним чином не обмежують обсяг даного винахіду, розкритий у даному винаході.

55 Використовувані в даному документі терміни "передбачає", "що передбачає", "включає", "включаючи", "має", "що має", "містить", "що містить", "характеризується" або будь-які інші їх варіації призначені для охоплення невиключного включення, за умови, що будь-які обмеження не зазначені явно. Наприклад, композиція, суміш, процес або спосіб, які включають список елементів, не обов'язково обмежені тільки цими елементами, але можуть включати й інші елементи, явно не перелічені або не властиві таким композиції, суміші, процесу або способу.

Перехідна фраза "що складається з" виключає будь-який не вказаний елемент, стадію або інгредієнт. Якщо така фраза присутня в пункті формули, то вона обмежує включення матеріалів, відмінних від перелічених, за винятком домішок, зазвичай з ними пов'язаних. У разі якщо фраза "що складається з" з'являється у реченні відмітної частини пункту формули винаходу, а не безпосередньо після обмежувальної частини, то вона обмежує тільки елемент, вказаний у

цьому реченні; інші елементи не виключаються з пункту формули в цілому.

Перехідна фраза "що по суті складається з" використовується для визначення композиції або способу, які включають матеріали, стадії, ознаки, компоненти або елементи додатково до тих, що розкриті буквально, за умови, що такі додаткові матеріали, стадії, ознаки, компоненти або елементи суттєво не впливають на основну(-и) та нову(-и) характеристику(-и) заявленого винаходу. Термін "що по суті складається з" займає середню позицію між "що містить" і "що складається з".

Крім того, якщо явно не вказано протилежне, "або" відноситься до включчного "або", а не виключчного "або". Наприклад, умова "A" або "B" задовольняється будь-чим із наступного: A є істинним (або присутнє) і B є хибним (або відсутнє), A є хибним (або відсутнє) і B є істинним (або присутнє), й A та B є обидва істинними (або присутні).

Крім того, елемент або компонент у формі однини за даним винаходом призначені для необмежувальної кількості випадків (тобто появ) елемента або компонента. Отже, форми однини слід читати як такі, що включають один або щонайменше один, і слово у формі однини, що позначає елемент або компонент, також включає множину, якщо кількість явно не означає однину.

Згадуваний в даному розкритті термін "безхребетний-шкідник" включає членистоногих, черевоногих та нематод, які є економічно важливими як шкідники. Термін "членистоногий" включає комах, кліщів, павуків, скорпіонів, багатоніжок, тисячоніжок, мокриць і симфіл. Термін "черевоногий" включає равликів, спімаків та інших із ряду *Stylopomatophora*. Термін "нематода" відноситься до живого організму типу *Nematoda*. Термін "паразитичні черви" включає круглих червів, серцевих гельмінтів, рослиноїдних нематод (*Nematoda*), сисунів (*Tematoda*), скреблянок та ствожкових червів (*Cestoda*).

У контексті даного винаходу "контроль безхребетних-шкідників" означає пригнічення розвитку безхребетного-шкідника (включаючи смертність, зниження щодо харчування та/або порушення спарювання), і пов'язані вирази визначені аналогічно.

Термін "агрономічний" відноситься до виробництва польових культур, як наприклад, для продуктів харчування, кормових продуктів і волокон, і включає конкретно вирощування кукурудзи, видів сої та інших бобових, рису, злакових культур (наприклад, пшениці, вівса, ячменю, жита, рису, майсу), листових овочів (наприклад, салату-латуку, капусти та інших капустяних культур), плодоносних овочів (наприклад, помідорів, перцю, баклажанів, хрестоцвітих і гарбузових), видів картоплі, видів солодкої картоплі, видів винограду, бавовнику, плодових дерев (наприклад, сім'янок, кістянок і цитрусових), ягідних культур (ягід, вишень) та інших спеціальних культур (наприклад, канолі, соняшнику, оливок).

Термін "неагрономічний" відноситься до культур, відмінних від польових культур, таких як садові культури (наприклад, тепличні рослини, саджанці або декоративні рослини, які не вирощуються на полях), варіантів застосування в житлових, сільськогосподарських, комерційних і промислових структурах, дернині (наприклад, дернова ферма, пасовище, поле для гольфу, галевина, спортивний майданчик тощо), виробах із деревини, продуктах, які зберігаються, агролісівництві й управлінні рослинністю, охороні здоров'я населення (тобто людини) та охороні здоров'я тварин (наприклад, одомашнених тварин, таких як домашні тварини, домашня худоба та домашня птиця, неодомашнених тварин, таких як дикі тварини).

Неагрономічні варіанти застосування включають захист тварини від паразитичного безхребетного-шкідника за допомогою введення паразитицидно ефективної (тобто біологічно ефективної) кількості сполуки за даним винаходом, типово у формі композиції, складеної для ветеринарного застосування, тварині, яка потребує захисту. Згадувані у даному розкритті та формулі винаходу, терміни "паразитицидний" і "паразитицидно" відноситься до спостережуваних ефектів щодо паразитичних безхребетних-шкідників для забезпечення захисту тварини від шкідника. Паразитицидні ефекти як правило, відносяться до зменшення появи або активності цільового паразитичного безхребетного-шкідника. Такі ефекти щодо шкідника включають некроз, смерть, уповільнений ріст, зменшенну рухливість або знижену здатність залишатися на організмі тварини-хазяїна або в ньому, знижене живлення та пригнічення розмноження. Такі ефекти щодо паразитичних безхребетних-шкідників забезпечують контроль (включаючи попередження, зниження або усунення) зараження або інфекції тварини паразитами.

Сполуки за даним винаходом можуть бути представлені або у чистій формі, або як суміш різних можливих ізомерних форм, таких як стереоізомери або конституційні ізомери. Різні стереоізомери включають енантіомери, діастереомери, хіральні ізомери, атропоізомери, конформери, ротамери, таутомери, оптичні ізомери, поліморфи та геометричні ізомери. Будь-які потрібні суміші таких ізомерів знаходяться у межах обсягу формули даного винаходу. Фахівець

в даній галузі зрозуміє, що один стереоізомер може бути більш активним та/або може проявляти сприятливі ефекти, у разі збагачення відносно іншого(-их) ізомера(-ів) або у разі відділення від іншого(-их) ізомера(-ів). Крім того, фахівцю у даній галузі техніки відомі процеси, або способи, або методи розділення, збагачення та/або селективного одержання вказаних ізомерів.

5 Далі будуть проілюстровані значення різних термінів, використовуваних в описі.

Термін "алкіл", використовуваний або окремо, або у складних словах, таких як "алкілтіо", або "галогеналкіл", або -N(алкіл), або алкілкарбонілалкіл, або алкілсульфоніламіно, включає C₁-C₂₄алкіл із прямим або розгалуженим ланцюгом, переважно C₁-C₁₅алкіл, більш переважно C₁-C₁₀алкіл, найбільш переважно C₁-C₆алкіл. Необмежувальні приклади алкілу включають метил, етил, пропіл, 1-метилетил, бутил, 1-метилпропіл, 2-метилпропіл, 1,1-диметилетил, пентил, 1-метилбутил, 2-метилбутил, 3-метилбутил, 2,2-диметилпропіл, 1-етилпропіл, гексил, 1,1-диметилпропіл, 1,2-диметилпропіл, 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-етилбутил, 2-етилбутил, 1,1,2-триметилпропіл, 1,2,2-триметилпропіл, 1-етил-1-метилпропіл та 1-етил-2-метилпропіл або інші ізомери. Якщо алкіл знаходиться в кінці складного замісника, як наприклад, в алкілциклоалкілі, то частина складного замісника на початку, наприклад циклоалкіл, може бути моно- або полізаміщеною однаково або по-різному і незалежно алкілом. Це також стосується складних замісників, у яких на кінці знаходяться інші радикали, наприклад, алкеніл, алкініл, гідроксил, галоген, карбоніл, карбонілокси тощо.

Термін "алкеніл", використовуваний або окремо, або у складних словах, включає C₂-C₂₄алкени із прямим або розгалуженим ланцюгом, переважно C₂-C₁₅алкени, більш переважно C₂-C₁₀алкени, найбільш переважно C₂-C₆алкени. Необмежувальні приклади алкенів включають етеніл, 1-пропеніл, 2-пропеніл, 1-метилетеніл, 1-бутеніл, 2-бутеніл, 3-бутеніл, 1-метил-1-пропеніл, 2-метил-1-пропеніл, 1-метил-2-пропеніл, 2-метил-2-пропеніл, 1-пентеніл, 2-пентеніл, 3-пентеніл, 4-пентеніл, 1-метил-1-бутеніл, 2-метил-1-бутеніл, 3-метил-1-бутеніл, 1-метил-2-бутеніл, 2-метил-2-бутеніл, 3-метил-2-бутеніл, 1-метил-3-бутеніл, 2-метил-3-бутеніл, 3-метил-3-бутеніл, 1,1-диметил-2-пропеніл, 1,2-диметил-1-пропеніл, 1,2-диметил-2-пропеніл, 1-етил-1-пропеніл, 1-етил-2-пропеніл, 1-гексеніл, 2-гексеніл, 3-гексеніл, 4-гексеніл, 5-гексеніл, 1-метил-1-пентеніл, 2-метил-1-пентеніл, 3-метил-1-пентеніл, 4-метил-1-пентеніл, 1-метил-2-пентеніл, 2-метил-2-пентеніл, 3-метил-2-пентеніл, 4-метил-2-пентеніл, 1-метил-3-пентеніл, 2-метил-3-пентеніл, 3-метил-3-пентеніл, 4-метил-3-пентеніл, 1-метил-4-пентеніл, 2-метил-4-пентеніл, 3-метил-4-пентеніл, 4-метил-4-пентеніл, 1,1-диметил-2-бутеніл, 1,1-диметил-3-бутеніл, 1,2-диметил-1-бутеніл, 1,2-диметил-2-бутеніл, 1,2-диметил-3-бутеніл, 1,3-диметил-1-бутеніл, 1,3-диметил-2-бутеніл, 1,3-диметил-3-бутеніл, 2,2-диметил-3-бутеніл, 2,3-диметил-1-бутеніл, 2,3-диметил-2-бутеніл, 2,3-диметил-3-бутеніл, 3,3-диметил-1-бутеніл, 3,3-диметил-2-бутеніл, 1-етил-1-бутеніл, 1-етил-2-бутеніл, 1-етил-3-бутеніл, 2-етил-1-бутеніл, 2-етил-2-бутеніл, 2-етил-3-бутеніл, 1,1,2-триметил-2-пропеніл, 1-етил-1-метил-2-пропеніл, 1-етил-2-метил-1-пропеніл та 1-етил-2-метил-2-пропеніл або інші ізомери. "Алкеніл" також включає полієни, такі як 1,2-пропадієніл і 2,4-гексадієніл. Дане визначення також відноситься до алкенілу як частини складного замісника, наприклад, галогеналкенілу тощо, якщо будь-де конкретно не вказане інше.

Необмежувальні приклади алкінів включають етиніл, 1-пропініл, 2-пропініл, 1-бутиніл, 2-бутиніл, 3-бутиніл, 1-метил-2-пропініл, 1-пентиніл, 2-пентиніл, 3-пентиніл, 4-пентиніл, 1-метил-2-бутиніл, 1-метил-3-бутиніл, 2-метил-3-бутиніл, 3-метил-1-бутиніл, 1,1-диметил-2-пропініл, 1-етил-2-пропініл, 1-гексиніл, 2-гексиніл, 3-гексиніл, 4-гексиніл, 5-гексиніл, 1-метил-2-пентиніл, 1-метил-3-пентиніл, 1-метил-4-пентиніл, 2-метил-3-пентиніл, 2-метил-4-пентиніл, 3-метил-1-пентиніл, 3-метил-4-пентиніл, 4-метил-1-пентиніл, 4-метил-2-пентиніл, 1,1-диметил-2-бутиніл, 1,1-диметил-3-бутиніл, 1,2-диметил-3-бутиніл, 2,2-диметил-3-буtinіl, 3,3-диметил-1-бутиніл, 1-етил-2-бутиніл, 1-етил-3-бутиніл, 2-етил-3-бутиніл та 1-етил-1-метил-2-пропініл або інші ізомери. Дане визначення також відноситься до алкінілу як частини складного замісника, наприклад, галогеналкінілу тощо, якщо будь-де конкретно не вказане інше. Термін "алкініл" також може включати фрагменти, що містять декілька потрійних зв'язків, таких як 2,5-гексадіїніл.

55 Термін "циклоалкіл" означає алкіл, замкнений з утворенням кільця. Необмежувальні приклади включають циклопропіл, цикlopентил і циклогексил. Це визначення також відноситься до циклоалкілу як частини складного замісника, наприклад, циклоалкілалкілу тощо, якщо будь-де конкретно не вказане інше.

60 Термін "циклоалкеніл" означає алкеніл, замкнений з утворенням кільця, включаючи моноциклічні, частково ненасичені вуглеводневі групи. Необмежувальні приклади включають

циклопропеніл, цикlopентеніл і циклогексеніл. Це визначення також відноситься до циклоалкенілу як частини складного замісника, наприклад циклоалкенілалкілу тощо, якщо будь-де конкретно не вказане інше.

5 Термін "циклоалкініл" означає алкініл, замкнений з утворенням кільця, включаючи моноциклічні, частково ненасичені групи. Необмежувальні приклади включають циклопропініл, цикlopентиніл і циклогексиніл. Це визначення також відноситься до циклоалкінілу як частини складного замісника, наприклад, циклоалкінілалкілу тощо, якщо будь-де конкретно не вказане інше.

10 Терміни "циклоалкокси", "циклоалкенілокси" тощо визначені аналогічно. Необмежувальні приклади циклоалкокси включають циклопропілокси, цикlopентилокси та циклогексилокси. Це визначення також відноситься до циклоалкокси як частини складного замісника, наприклад, циклоалкоксиалкілу тощо, якщо будь-де конкретно не вказане інше.

15 Термін "галоген" або окремо, або у складному слові, такому як "галогеналкіл", включає фтор, хлор, бром або йод. Крім того, при використанні у складних словах, таких як "галогеналкіл", вказаний алкіл може бути частково або повністю заміщений атомами галогену, які можуть бути однаковими або різними. Необмежувальні приклади "галогеналкілу" включають хлорметил, бромметил, дихлорметил, трихлорметил, фторметил, дифторметил, трифторметил, хлорфторметил, дихлорфторметил, хлордифторметил, 1-хлоретил, 1-брометил, 1-фторетил, 2-фторетил, 2,2-дифторетил, 2,2,2-трифторетил, 2-хлор-2-фторетил, 2-хлор-2,2-дифторетил, 2,2-дихлор-2-фторетил, 2,2,2-трихлоретил, пентафторетил, 1,1-дихлор-2,2,2-трифторетил і 1,1,1-трифторпроп-2-іл. Це визначення також відноситься до галогеналкілу як частини складного замісника, наприклад, галогеналкіламіноалкілу тощо, якщо будь-де конкретно не вказане інше.

20 Терміни "галогеналкеніл" і "галогеналкініл" визначені аналогічно, за винятком того, що замість алкільних груп присутні алкенільні та алкінільні групи як частини замісника.

25 Термін "галогеналкокси" означає алкоксигрупи з прямим або розгалуженим ланцюгом, де деякі або всі атоми водню в таких групах можуть бути замінені атомами галогену, вказаними вище. Необмежувальні приклади галогеналкокси включають хлорметокси, бромметокси, дихлорметокси, трихлорметокси, фторметокси, дифторметокси, трифторметокси, хлорфторметокси, дихлорфторметокси, хлордифторметокси, 1-хлоретокси, 1-брометокси, 1-фторетокси, 2-фторетокси, 2,2-дифторетокси, 2,2,2-трифторетокси, 2-хлор-2-фторетокси, 2-хлор-2,2-дифторетокси, 2,2-дихлор-2-фторетокси, 2,2,2-трихлоретокси, пентафторетокси та 1,1,1-трифторпроп-2-окси. Це визначення також відноситься до галогеналкокси як частини складного замісника, наприклад, галогеналкоксиалкілу тощо, якщо будь-де конкретно не вказане інше.

35 Термін "галогеналкілтіо" означає алкілтіогрупи з прямим або розгалуженим ланцюгом, де деякі або всі атоми водню в таких групах можуть бути замінені атомами галогену, вказаними вище. Необмежувальні приклади галогеналкілтіо включають хлорметилтіо, бромметилтіо, дихлорметилтіо, трихлорметилтіо, фторметилтіо, дифторметилтіо, трифторметилтіо, хлорфторметилтіо, дихлорфторметилтіо, хлордифторметилтіо, 1-хлоретилтіо, 1-брометилтіо, 1-фторетилтіо, 2-фторетилтіо, 2,2-дифторетилтіо, 2,2,2-трифторетилтіо, 2-хлор-2-фторетилтіо, 2-хлор-2,2-дифторетилтіо, 2,2-дихлор-2-фторетилтіо, 2,2,2-трихлоретилтіо, пентафторетилтіо та 1,1,1-трифторпроп-2-ілтіо. Це визначення також відноситься до галогеналкілтіо як частини складного замісника, наприклад, галогеналкілтіоалкілу тощо, якщо будь-де конкретно не вказане інше.

45 Необмежувальні приклади "галогеналкілсульфінілу" включають $\text{CF}_3\text{S}(\text{O})$, $\text{CCl}_3\text{S}(\text{O})$, $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{S}(\text{O})$ і $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{S}(\text{O})$. Необмежувальні приклади "галогеналкілсульфонілу" включають $\text{CF}_3\text{S}(\text{O})_2$, $\text{CCl}_3\text{S}(\text{O})_2$, $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{S}(\text{O})_2$ і $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{S}(\text{O})_2$.

50 Термін "гідрокси" означає $-\text{OH}$, аміно означає $-\text{NRR}$, де R може являти собою H або будь-який можливий замісник, такий як алкіл. Карбоніл означає $-\text{C}(=\text{O})-$, карбонілокси означає $-\text{OC}(=\text{O})-$, сульфініл означає SO , сульфоніл означає $\text{S}(\text{O})_2$.

55 Термін "алкокси", використовуваний або окремо, або у складних словах, включає $\text{C}_1\text{-C}_{24}\text{алкокси}$, переважно $\text{C}_1\text{-C}_{15}\text{алкокси}$, більш переважно $\text{C}_1\text{-C}_{10}\text{алкокси}$, найбільш переважно $\text{C}_1\text{-C}_6\text{алкокси}$. Приклади алкокси включають метокси, етокси, пропокси, 1-метилетокси, бутокси, 1-метилпропокси, 2-метилпропокси, 1,1-диметилетокси, пентокси, 1-метилбутокси, 2-метилбутокси, 3-метилбутокси, 2,2-диметилпропокси, 1-етилпропокси, гексокси, 1,1-диметилпропокси, 1,2-диметилпропокси, 1-метилпентокси, 2-метилпентокси, 3-метилпентокси, 4-метилпентокси, 1,1-диметилбутокси, 1,2-диметилбутокси, 1,3-диметилбутокси, 2,2-диметилбутокси, 2,3-диметилбутокси, 3,3-диметилбутокси, 1-етилбутокси, 2-етилбутокси, 1,1,2-триметилпропокси, 1,2,2-триметилпропокси, 1-етил-1-метилпропокси та 1-етил-2-метилпропокси та різні ізомери. Це визначення також відноситься до алкокси як частини складного замісника,

наприклад, галогеналкокси, алкінілалкокси тощо, якщо будь-де конкретно не вказане інше.

Термін "алкоксиалкіл" позначає заміщення алкокси при алкілі. Необмежувальні приклади "алкоксиалкілу" включають CH_3OCH_2 , $\text{CH}_3\text{OCH}_2\text{CH}_2$, $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{OCH}_2$, $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_2$ і $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{CH}_2$.

5 Термін "алкоксиалкокси" позначає заміщення алкокси при алкокси.

Термін "алкілтіо" включає алкілтіо-фрагменти з розгалуженим або прямим ланцюгом, такі як метилтіо, етилтіо, пропілтіо, 1-метилетилтіо, бутилтіо, 1-метилпропілтіо, 2-метилпропілтіо, 1,1-диметилетилтіо, пентилтіо, 1-метилбутилтіо, 2-метилбутилтіо, 3-метилбутилтіо, 2,2-диметилпропілтіо, 1-етилпропілтіо, гексилтіо, 1,1-диметилпропілтіо, 1,2-диметилпропілтіо, 1-метилпентилтіо, 2-метилпентилтіо, 3-метилпентилтіо, 4-метилпентилтіо, 1,1-диметилбутилтіо, 1,2-диметилбутилтіо, 1,3-диметилбутилтіо, 2,2-диметилбутилтіо, 2,3-диметилбутилтіо, 3,3-диметилбутилтіо, 1-етилбутилтіо, 2-етилбутилтіо, 1,1,2-триметилпропілтіо, 1,2,2-триметилпропілтіо, 1-етил-1-метилпропілтіо й 1-етил-2-метилпропілтіо та інші ізомери.

Галогенциклоалкіл, галогенциклоалкеніл, алкілциклоалкіл, циклоалкілалкіл, циклоалкоксиалкіл, алкілсульфінілалкіл, алкілсульфонілалкіл, галогеналкілкарбоніл, циклоалкілкарбоніл, галогеналкоксилалкіл тощо визначені аналогічно до вищевказаних прикладів.

20 Термін "алкілтіоалкіл" позначає заміщення алкілтіо при алкілі. Необмежувальні приклади "алкілтіоалкілу" включають $-\text{CH}_2\text{SCH}_2$, $-\text{CH}_2\text{SCH}_2\text{CH}_2$, $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{SCH}_2$, $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{SCH}_2$ і $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{SCH}_2\text{CH}_2$. "Алкілтіоалкокси" позначає заміщення алкілтіо при алкокси. Термін "циклоалкілалкіламіно" позначає заміщення циклоалкіл при алкіламіно.

25 Терміни "алкоксиалкоксиалкіл", "алкіламіноалкіл", "діалкіламіноалкіл", "циклоалкіламіноалкіл", "циклоалкіламінокарбоніл" тощо визначені аналогічно до "алкілтіоалкілу" або "циклоалкілалкіламіно".

Термін "алкоксикарбоніл" являє собою алкоксигрупу, зв'язану з оством через карбонільну 30 групу (-CO-). Це визначення також відноситься до алкоксикарбонілу як частини складного замісника, наприклад циклоалкілалкоксикарбонілу тощо, якщо будь-де конкретно не вказане інше.

Термін "алкоксикарбонілалкіламіно" позначає заміщення алкоксикарбоніл при алкіламіно. "Алкілкарбонілалкіламіно" позначає заміщення алкілкарбоніл при алкіламіно. Терміни алкілтіоалкоксикарбоніл, циклоалкілалкіламіноалкіл тощо визначені аналогічно.

Необмежувальні приклади "алкілсульфінілу" включають метилсульфініл, етилсульфініл, пропілсульфініл, 1-метилетилсульфініл, бутилсульфініл, 1-метилпропілсульфініл, 2-метилпропілсульфініл, 1,1-диметилетилсульфініл, пентилсульфініл, 1-метилбутилсульфініл, 2-метилбутилсульфініл, 3-метилбутилсульфініл, 2,2-диметилпропілсульфініл, 1-етилпропілсульфініл, гексилсульфініл, 1,1-диметилпропілсульфініл, диметилпропілсульфініл, 1-метилпентилсульфініл, 2-метилпентилсульфініл, 3-метилпентилсульфініл, 4-метилпентилсульфініл, 1,1-диметилбутилсульфініл, 1,2-диметилбутилсульфініл, 1,3-диметилбутилсульфініл, 2,2-диметилбутилсульфініл, 2,3-диметилбутилсульфініл, 3,3-диметилбутилсульфініл, 1-етилбутилсульфініл, 2-етилбутилсульфініл, 1,1,2-триметилпропілсульфініл, 1,2,2-триметилпропілсульфініл, 1-етил-1-метилпропілсульфініл і 1-етил-2-метилпропілсульфініл та інші ізомери. Термін "арилсульфініл" включає Ar-S(O) , де Ar може являти собою будь-який карбоцикл або гетероцикл. Це визначення також відноситься до алкілсульфінілу як частини складного замісника, наприклад, галогеналкілсульфінілу тощо, якщо будь-де конкретно не вказане інше.

Необмежувальні приклади "алкілсульфонілу" включають метилсульфоніл, етилсульфоніл, пропілсульфоніл, 1-метилетилсульфоніл, бутилсульфоніл, 1-метилпропілсульфоніл, 2-метилпропілсульфоніл, 1,1-диметилетилсульфоніл, пентилсульфоніл, 1-метилбутилсульфоніл, 2-метилбутилсульфоніл, 3-метилбутилсульфоніл, 2,2-диметилпропілсульфоніл, 1-етилпропілсульфоніл, гексилсульфоніл, 1,1-диметилпропілсульфоніл, диметилпропілсульфоніл, 1-метилпентилсульфоніл, 2-метилпентилсульфоніл, 3-метилпентилсульфоніл, 4-метилпентилсульфоніл, 1,1-диметилбутилсульфоніл, 1,2-диметилбутилсульфоніл, 1,3-диметилбутилсульфоніл, 2,2-диметилбутилсульфоніл, 2,3-диметилбутилсульфоніл, 3,3-диметилбутилсульфоніл, 1-етилбутилсульфоніл, 2-етилбутилсульфоніл, 1,1,2-триметилпропілсульфоніл, 1,2,2-триметилпропілсульфоніл, 1-етил-1-метилпропілсульфоніл і 1-етил-2-метилпропілсульфоніл та інші ізомери. Термін "арилсульфоніл" включає Ar-S(O)_2 , де Ar може являти собою будь-який карбоцикл або гетероцикл. Це визначення також стосується алкілсульфонілу як частини складного замісника, наприклад, алкілсульфонілалкілу тощо, якщо будь-де не вказане інше.

60 "Алкіламіно", "діалкіламіно" тощо визначені аналогічно до вищевказаних прикладів.

5 Термін "карбоцикл або карбоциклічний" включає "ароматичну карбоциклічну кільцеву систему" та "неароматичну карбоциклічну кільцеву систему" або поліцикличні або біцикличні (спіро, конденсовані, місткові, неконденсовані) кільцеві сполуки, в яких кільце може бути ароматичним або неароматичним (де ароматичний вказує на те, що правило Гюкеля задовольняється, і неароматичний вказує на те, що правило Гюкеля не задовольняється).

10 5 Термін "гетероцикл" або "гетероциклічний" включає "ароматичний гетероцикл" або "гетероарильну кільцеву систему" та "неароматичну гетероциклічну кільцеву систему", або поліцикличні або біцикличні (спіро, конденсовані, з'єднані містковим зв'язком, неконденсовані) кільцеві сполуки, в яких кільце може бути ароматичним або неароматичним, де гетероциклічне кільце містить щонайменше один гетероатом, вибраний із N, O, S(O)₀₋₂, та/або член кільця, що являє собою C, гетероциклу може бути замінений C(=O), C(=S), C(=CR^{*}R^{*}) і C=NR^{*}, при цьому * позначає цілі числа.

15 10 Термін "неароматичний гетероцикл" або "неароматична гетероциклічна сполука" означає три – п'ятнадцятичленний, переважно три – дванадцятичленний, насичений або частково ненасичений гетероцикл, що містить від одного до чотирьох гетероатомів із групи, що складається з кисню, азоту та сірки: моно, бі- або трицикличні гетероцикли, які містять додатково до членів кільця, що являють собою вуглець, від одного до трьох атомів азоту та/або один атом кисню або сірки, або один, або два атоми кисню та/або сірки; при цьому якщо кільце містить більше ніж один атом кисню, то вони не є безпосередньо суміжними; необмежувальними прикладами є оксетаніл, оксiranіл, азиридиніл, 2-тетрагідрофураніл, 3-тетрагідрофураніл, 2-тетрагідротієніл, 3-тетрагідротієніл, 1-піролідиніл, 2-піролідиніл, 3-піролідиніл, 3-ізоксазолідиніл, 4-ізоксазолідиніл, 5-ізоксазолідиніл, 3-ізотіазолідиніл, 4-ізотіазолідиніл, 5-ізотіазолідиніл, 1-піразолідиніл, 3-піразолідиніл, 4-піразолідиніл, 5-піразолідиніл, 2-оксазолідиніл, 4-оксазолідиніл, 5-оксазолідиніл, 2-тіазолідиніл, 4-тіазолідиніл, 5-тіазолідиніл, 1-імідазолідиніл, 2-імідазолідиніл, 4-імідазолідиніл, 1,2,4-оксадіазолідин-3-іл, 1,2,4-оксадіазолідин-5-іл, 1,2,4-тіадіазолідин-3-іл, 1,2,4-тіадіазолідин-5-іл, 1,2,4-триазолідин-1-іл, 1,2,4-триазолідин-3-іл, 1,3,4-оксадіазолідин-2-іл, 1,3,4-тіадіазолідин-2-іл, 1,3,4-триазолідин-1-іл, 1,3,4-триазолідин-2-іл, 2,3-дигідрофур-2-іл, 2,3-дигідрофур-3-іл, 2,4-дигідрофур-2-іл, 2,4-дигідрофур-3-іл, 2,3-дигідротієн-2-іл, 2,3-дигідротієн-3-іл, 2,4-дигідротієн-2-іл, 2,4-дигідротієн-3-іл, піролініл, 2-піролін-2-іл, 2-піролін-3-іл, 3-піролін-2-іл, 3-піролін-3-іл, 2-ізоксазолін-3-іл, 3-ізоксазолін-3-іл, 4-ізоксазолін-3-іл, 2-ізоксазолін-4-іл, 3-ізоксазолін-4-іл, 4-ізоксазолін-4-іл, 2-ізоксазолін-5-іл, 3-ізоксазолін-5-іл, 4-ізоксазолін-5-іл, 2-ізотіазолін-3-іл, 3-ізотіазолін-3-іл, 4-ізотіазолін-3-іл, 2-ізотіазолін-4-іл, 3-ізотіазолін-4-іл, 4-ізотіазолін-4-іл, 2-ізотіазолін-5-іл, 3-ізотіазолін-5-іл, 4-ізотіазолін-5-іл, 2,3-дигідропіразол-1-іл, 2,3-дигідропіразол-2-іл, 2,3-дигідропіразол-3-іл, 2,3-дигідропіразол-4-іл, 2,3-дигідропіразол-5-іл, 3,4-дигідропіразол-1-іл, 3,4-дигідропіразол-3-іл, 3,4-дигідропіразол-4-іл, 3,4-дигідропіразол-5-іл, 4,5-дигідропіразол-1-іл, 4,5-дигідропіразол-3-іл, 4,5-дигідропіразол-4-іл, 4,5-дигідропіразол-5-іл, 2,3-дигідрооксазол-2-іл, 2,3-дигідрооксазол-3-іл, 2,3-дигідрооксазол-4-іл, 2,3-дигідрооксазол-5-іл, 3,4-дигідрооксазол-2-іл, 3,4-дигідрооксазол-3-іл, 3,4-дигідрооксазол-4-іл, 3,4-дигідрооксазол-5-іл, 3,4-дигідрооксазол-2-іл, 3,4-дигідрооксазол-3-іл, 3,4-дигідрооксазол-4-іл, піперидиніл, 2-піперидиніл, 3-піперидиніл, 4-піперидиніл, піразиніл, морфолініл, тіоморфолініл, 1,3-діоксан-5-іл, 2-тетрагідропіраніл, 4-тетрагідропіраніл, 2-тетрагідротієніл, 3-гексагідропіридазиніл, 4-гексагідропіридазиніл, 2-гексагідропіrimідиніл, 4-гексагідропіrimідиніл, 5-гексагідропіrimідиніл, 2-піperазиніл, 1,3,5-гексагідротриазин-2-іл, 1,2,4-гексагідротриазин-3-іл, циклосерини, 2,3,4,5-тетрагідро[1H]азепін-1-, або -2-, або -3-, або -4-, або -5-, або -6-, або -7-іл, 3,4,5,6-тетрагідро[2H]азепін-2-, або -3-, або -4-, або -5-, або -6-, або -7-іл, 2,3,4,7-тетрагідро[1H]азепін-1-, або -2-, або -3-, або -4-, або -5-, або -6-, або -7-іл, 2,3,6,7-тетрагідро[1H]азепін-1-, або -2-, або -3-, або -4-, або -5-, або -6-, або -7-іл, гексагідроазепін-1-, або -2-, або -3-, або -4-іл, тетра- та гексагідрооксепініл, такий як 2,3,4,5-тетрагідро[1H]оксепін-2-, або -3-, або -4-, або -5-, або -6-, або -7-іл, 2,3,4,7-тетрагідро[1H]оксепін-2-, або -3-, або -4-, або -5-, або -6-, або -7-іл, тетра- та гексагідро-1,3-оксазепініл, тетра- та гексагідро-1,4-оксазепініл, тетра- та гексагідро-1,3-діоксепініл, тетра- та гексагідро-1,4-діоксепініл. Це визначення також відноситься до гетероциклу як частини складного замісника, наприклад, гетероциклалкілу тощо, якщо будь-де конкретно не вказане інше.

55 60 Термін "гетероарил" або "ароматична гетероциклічна сполука" означає 5- або 6-членну, повністю ненасичену моноцикличні кільцеву систему, що містить від одного до чотирьох гетероатомів із групи, що складається з кисню, азоту та сірки; при цьому якщо кільце містить більше ніж один атом кисню, то вони не є безпосередньо суміжними; 5-членний гетероарил, що містить від одного до чотирьох атомів азоту або від одного до трьох атомів азоту та один атом

сірки або кисню; 5-членну гетероарильну групу, яка додатково до атомів вуглецю може містити від одного до чотирьох атомів азоту або від одного до трьох атомів азоту та один атом сірки або кисню як члени кільця, необмежувальними прикладами є фурил, тіеніл, піроліл, ізоксазоліл, ізотіазоліл, піразоліл, оксазоліл, тіазоліл, імідазоліл, 1,2,4-оксадіазоліл, 1,2,4-тіадіазоліл, 1,2,4-триазоліл, 1,3,4-оксадіазоліл, 1,3,4-тіадіазоліл, 1,3,4-триазоліл, тетразоліл; азот-зв'язаний 5-членний гетероарил, що містить від одного до чотирьох атомів азоту, або бензоконденсований азот-зв'язаний 5-членний гетероарил, що містить від одного до трьох атомів азоту: 5-членні гетероарильні групи, які додатково до атомів вуглецю можуть містити від одного до чотирьох атомів азоту або від одного до трьох атомів азоту як члени кільця, і в яких два суміжні члени кільця, що являють собою вуглець, або один атом азоту та один суміжній член кільця, що являє собою вуглець, можуть бути з'єднані містковим зв'язком через бута-1,3-дієн-1,4-діїльну групу, в якій один або два атоми вуглецю можуть бути замінені на атоми азоту, де такі кільця приєднані до остова через один із членів кільця, що являють собою азот, необмежувальними прикладами є 1-піроліл, 1-піразоліл, 1,2,4-триазол-1-іл, 1-імідазоліл, 1,2,3-триазол-1-іл і 1,3,4-триазол-1-іл; 6-членний гетероарил, який містить від одного до чотирьох атомів азоту: 6-членні гетероарильні групи, які додатково до атомів вуглецю можуть містити, відповідно, від одного до трьох і від одного до чотирьох атомів азоту як члени кільця, необмежувальними прикладами є 2-піридиніл, 3-піридиніл, 4-піридиніл, 3-піридиніл, 4-піридиніл, 2-піримідиніл, 4-піримідиніл, 5-піримідиніл, 2-піразиніл, 1,3,5-триазин-2-іл, 1,2,4-триазин-3-іл і 1,2,4,5-тетразин-3-іл; бензоконденсований 5-членний гетероарил, що містить від одного до трьох атомів азоту або один атом азоту та один атом кисню або сірки, необмежувальними прикладами є індол-1-іл, індол-2-іл, індол-3-іл, індол-4-іл, індол-5-іл, індол-6-іл, індол-7-іл, бензимідазол-1-іл, бензимідазол-2-іл, бензимідазол-4-іл, бензимідазол-5-іл, індазол-1-іл, індазол-3-іл, індазол-4-іл, індазол-5-іл, індазол-6-іл, індазол-7-іл, індазол-2-іл, 1-бензофуран-2-іл, 1-бензофуран-3-іл, 1-бензофуран-4-іл, 1-бензофуран-5-іл, 1-бензофуран-6-іл, 1-бензофуран-7-іл, 1-бензотіофен-2-іл, 1-бензотіофен-3-іл, 1-бензотіофен-4-іл, 1-бензотіофен-5-іл, 1-бензотіофен-6-іл, 1-бензотіофен-7-іл, 1,3-бензотіазол-2-іл, 1,3-бензотіазол-4-іл, 1,3-бензотіазол-5-іл, 1,3-бензотіазол-6-іл, 1,3-бензотіазол-7-іл, 1,3-бензоксазол-2-іл, 1,3-бензоксазол-4-іл, 1,3-бензоксазол-5-іл, 1,3-бензоксазол-6-іл і 1,3-бензоксазол-7-іл; бензоконденсований 6-членний гетероарил, який містить від одного до трьох атомів азоту, необмежувальними прикладами є: хінолін-2-іл, хінолін-3-іл, хінолін-4-іл, хінолін-5-іл, хінолін-6-іл, хінолін-7-іл, хінолін-8-іл, ізохінолін-1-іл, ізохінолін-3-іл, ізохінолін-4-іл, ізохінолін-5-іл, ізохінолін-6-іл, ізохінолін-7-іл та ізохінолін-8-іл.

Термін "триалкілсиліл" включає 3 алкільні радикали з розгалуженним та/або прямим ланцюгом, приєднані до них і зв'язані через атом кремнію, такі як триметилсиліл, триетилсиліл і трет-бутил-диметилсиліл. "Галогентриалкілсиліл" позначає, що щонайменше один із трьох алкільних радикалів частково або повністю заміщений атомами галогену, які можуть бути однаковими або різними. Термін "алкокситриалкілсиліл" позначає, що щонайменше один із трьох алкільних радикалів заміщений одним або більше радикалами алкокси, які можуть бути однаковими або різними. Термін "триалкілсилілокси" позначає триалкілсилільний фрагмент, приєднаний через атом кисню.

Необмежувальні приклади "алкілкарбонілу" включають $\text{C}(\text{=O})\text{CH}_3$, $\text{C}(\text{=O})\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$ і $\text{C}(\text{=O})\text{CH}(\text{CH}_3)_2$. Необмежувальні приклади "алкоксикарбоніту" включають $\text{CH}_3\text{OC}(\text{=O})$, $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{OC}(\text{=O})$, $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OC}(\text{=O})$ та інші бутокси- або пентоксикарбонільні ізомери. Необмежувальні приклади "алкіламінокарбонілу" включають $\text{CH}_3\text{NHC}(\text{=O})$, $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{NHC}(\text{=O})$, $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NHC}(\text{=O})$, $(\text{CH}_3)_2\text{CHNHC}(\text{=O})$ та інші бутиламіно- або пентиламінокарбонільні ізомери. Необмежувальні приклади "діалкіламінокарбонілу" включають $(\text{CH}_3)_2\text{NC}(\text{=O})$, $(\text{CH}_3\text{CH}_2)_2\text{NC}(\text{=O})$, $\text{CH}_3\text{CH}_2(\text{CH}_3)\text{NC}(\text{=O})$, $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2(\text{CH}_3)\text{NC}(\text{=O})$ та $(\text{CH}_3)_2\text{CHN}(\text{CH}_3)\text{C}(\text{=O})$. Необмежувальні приклади "алкоксиалкілкарбонілу" включають $\text{CH}_3\text{OCH}_2\text{C}(\text{=O})$, $\text{CH}_3\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{C}(\text{=O})$, $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{C}(\text{=O})$, $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{C}(\text{=O})$ та $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{C}(\text{=O})$. Необмежувальні приклади "алкілтіоалкілкарбонілу" включають $\text{CH}_3\text{SCH}_2\text{C}(\text{=O})$, $\text{CH}_3\text{SCH}_2\text{CH}_2\text{C}(\text{=O})$, $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{SCH}_2\text{C}(\text{=O})$, $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{SCH}_2\text{C}(\text{=O})$ та $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{SCH}_2\text{CH}_2\text{C}(\text{=O})$. Термін галогеналкілсульфоніламінокарбоніл, алкілсульфоніламінокарбоніл, алкілтіоалкоксикарбоніл, алкоксикарбонілалкіламіно тощо визначені аналогічно.

Необмежувальні приклади "алкіламіноалкілкарбонілу" включають $\text{CH}_3\text{NHCH}_2\text{C}(\text{=O})$, $\text{CH}_3\text{NHCH}_2\text{CH}_2\text{C}(\text{=O})$, $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{NHCH}_2\text{C}(\text{=O})$, $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NHCH}_2\text{C}(\text{=O})$ та $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{NHCH}_2\text{CH}_2\text{C}(\text{=O})$.

Термін "амід" означає $\text{A}-\text{R}'\text{C}=\text{ONR}''-\text{B}$, де R' і R'' позначає замісники, та A і B позначають будь-яку групу.

Термін "тіоамід" означає $\text{A}-\text{R}'\text{C}=\text{SNR}''-\text{B}$, де R' і R'' позначає замісники, та A і B позначають

будь-яку групу.

Загальну кількість атомів вуглецю в групі-заміснику вказують за допомогою префікса "C_i-C_j", де і та ѹ являють собою числа від 1 до 21. Наприклад, C₁-C₃алкілсульфоніл позначає метилсульфоніл через пропілсульфоніл; C₂алкоксиалкіл позначає CH₃OCH₂; C₃алкоксиалкіл позначає, наприклад, CH₃CH(OCH₃), CH₃OCH₂CH₂ або CH₃CH₂OCH₂; і C₄алкоксиалкіл позначає різні ізомери алкільної групи, заміщені алкоксигрупою, що містить загалом чотири атоми вуглецю, приклади включають CH₃CH₂CH₂OCH₂ і CH₃CH₂OCH₂CH₂. У вищевикладених переліках, у разі якщо сполука формули I складається з одного або більше гетероциклічних кілець, – усі замісники приєднуються до цих кілець за допомогою будь-якого доступного атома вуглецю або азоту шляхом заміни водню при вказаному атомі вуглецю або азоту.

У разі якщо сполука заміщена замісником із зазначенням нижнім індексом, який вказує на те, що кількість вказаних замісників може перевищувати 1, – вказані замісники (якщо їх більше 1) незалежно вибрані з групи визначених замісників. Крім того, у разі якщо нижній індекс m у (R)_m позначає ціле число, що перебуває у діапазоні від, наприклад, 0 до 4, то число замісників може бути вибране з цілих чисел від 0 до 4 включно.

У разі якщо група містить замісник, який може являти собою водень, то вважається, що вказана група незаміщена, якщо цей замісник приймається за водень.

Варіанти здійснення, описані в даному документі, та їхні різноманітні ознаки та переважні деталі пояснюються із посиланням на необмежувальні варіанти здійснення в описі. Описи широко відомих компонентів і методик обробки опущені, щоб надмірно не перешкоджати розумінню варіантів здійснення, описаних у даному документі. Приклади, застосовувані у даному документі, призначенні лише для полегшення розуміння способів, за допомогою яких варіанти здійснення, описані в даному документі, можна реалізовувати на практиці, і додатково для забезпечення можливості для фахівців у даній галузі реалізовувати на практиці варіанти здійснення, описані в даному документі. Відповідно, приклади не слід розуміти як такі, що обмежують обсяг варіантів здійснення, описаних у даному документі.

Опис конкретних варіантів здійснення буде настільки повно розкривати основну суть варіантів здійснення, описаних у даному документі, що інші можуть, за допомогою використання сучасних знань, легко модифікувати та/або адаптувати такі конкретні варіанти здійснення для різних варіантів здійснення без відступу від загальної концепції, а отже, такі адаптації та модифікації слід розуміти як такі, що призначенні для розуміння в межах значення та діапазону еквівалентів розкритих варіантів здійснення. Слід розуміти, що формулювання або термінологія, використовувані в даному документі, призначенні для опису, а не для обмеження. Отже, хоча варіанти здійснення, наведені у даному документі, були описані в контексті переважних варіантів здійснення, фахівці в даній галузі зрозуміють, що варіанти здійснення, наведені у даному документі, можна реалізовувати на практиці з модифікацією в межах сутності та обсягу варіантів здійснення, описаних у даному документі.

Будь-яке згадування документів, актів, матеріалів, пристройів, статей тощо, які були включені в даний опис, здійснюється лише з метою надання контексту для даного винаходу. Не мається на увазі, що будь-які або всі такі матеріали утворюють частину основи попереднього рівня техніки або були загальновідомими в галузі техніки, до якої відноситься даний винахід, оскільки вони були будь-де відомими до дати пріоритету даної заявки.

Числові значення, вказані в описі та описі/пунктах формул, хоча і можуть становити важливу частину даного винаходу, будь-яке відхилення від таких числових значень все ще буде знаходитись у межах обсягу даного винаходу, якщо відхилення дотримується такого ж наукового принципу, як і в даному винаході, розкритому в даному винаході.

Сполука за даним винаходом, якщо це необхідно, може бути присутня у вигляді суміші різних можливих ізомерних форм, особливо стереоізомерів, наприклад, E- та Z-, трео- та еритро-, а також оптических ізомерів, а якщо це необхідно, – також і таутомерів. Як E, так і Z-ізомери, а також трео- та еритроізомери й оптичні ізомери, будь-які потрібні суміші таких ізомерів і можливі таутомерні форми розкриті і заявлені у формулі даного винаходу. Термін "шкідник" для мети даного винаходу включає без обмеження гриби, страменопили (ооміцети), бактерії, нематоди, мікроскопічні кліщі, кліщі, комах і гризунів.

Термін "рослина" в даному документі слід розуміти як такий, що означає всі рослини та популяції рослин, такі як потрібні та непотрібні дикі рослини або культурні рослини (включаючи культурні рослини, що зустрічаються в природі). Культурні рослини можуть являти собою рослини, які можна одержувати за допомогою способів традиційної селекції та оптимізації або за допомогою способів біотехнології та генетичної інженерії або комбінації таких способів, включаючи трансгенні рослини та включаючи культурні сорти рослин, які охороняються і не охороняються правами селекціонерів.

Для мети даного винаходу термін "рослина" включає живий організм, прикладом якого є дерева, кущі, лікарські трави, трави, папороті та мохи, які зазвичай ростуть на ділянці, поглинають воду і необхідні речовини через їхні корені та синтезують поживні речовини у своїх листках за допомогою фотосинтезу.

Приклади "рослини" для мети даного винаходу включають без обмеження сільськогосподарські культури, такі як пшениця, жито, ячмінь, тритикале, овес або рис; буряк, наприклад, цукровий буряк або кормовий буряк; плоди та плодові дерева, такі як сім'янки, кістянки або ягоди, наприклад, яблука, груші, сливи, персики, види мигдалю, вишні, суници, малини, ожини або агрусу; бобові рослини, такі як види сочевиці, гороху, люцерна або види сої; олійні рослини, такі як ріпак, види гірчиці, оливок, соняшник, кокос, какао-боби, рослини рицини, олійні пальми, земляні горіхи або соєві боби; гарбузові, такі як види кабачка, огірок або види дині; волокнисті рослини, такі як бавовник, льон, коноплі або джут; плоди цитруса та цитрусові дерева, такі як види апельсина, лимона, грейпфрута або мандарина; будь-які садові рослини, овочі, такі як шпинат, салат-латук, спаржа, види капусти, моркви, цибулі, томату, картоплі, гарбуза або паприка; лаврові рослини, такі як види авокадо, кориця або камфора; гарбузові; олійні рослини; рослини для одержання енергії та сировинних матеріалів, такі як злакові культури, кукурудза, соя, інші бобові рослини, ріпак, цукрова тростина або олійна пальма; тютюн; горіхи; кава; чай; какао; банани; види перцю; виткі рослини (столові сорти винограду та виноградні лози для одержання виноградного соку); хміль; дернина; солодкий лист (також називаний стевією); рослини для одержання природного каучуку або декоративні та лісові рослини, такі як квіти, кущі, широколисті дерева або вічнозелені рослини, наприклад хвойні; і матеріал для розмноження рослин, такий як насіння, та вирощений матеріал таких рослин.

Переважно, рослина для мети даного винаходу включає без обмеження злакові культури, кукурудзу, рис, сою та інші бобові рослини, плоди та плодові дерева, види винограду, горіхи та горіхові дерева, цитрус та цитрусові дерева, будь-які садові рослини, гарбузові, олійні рослини, тютюн, кавове дерево, чайну рослину, дерево какао, цукровий буряк, цукрову тростину, бавовник, картоплю, томат, види цибулі, види перцю та овочі, декоративні рослини, будь-які квітникарські рослини та інші рослини для використання людиною і тваринами.

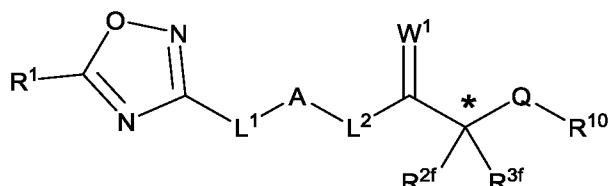
Термін "частини рослини" слід розуміти як такий, що означає всі частини та органи рослин над і під землею. Для мети даного винаходу термін "частини рослини" включає без обмеження живці, листки, гілки, коренеплоди, квітки, насіння, гілки, корені, включаючи стрижневі корені, бічні корені, кореневі волоски, кінчик кореня, кореневий чохлик, кореневища, саджанці, пагони, плоди, плодові тіла, кору, стебло, бруньки, бічні бруньки, меристеми, вузли та міжвузля.

Термін "місце їхнього зростання" включає ґрунт, навколошнє середовище рослини або частин рослини та обладнання або інструменти, застосовувані до, під час або після посіву/посадки рослини або частини рослини.

Застосування сполук за даним винаходом або сполуки за даним винаходом у композиції, яка необов'язково містить інші сумісні сполуки, по відношенню до рослини, або рослинного матеріалу, або місця її зростання включає застосування за допомогою методики, відомої фахівцю у даній галузі, яке включає без обмеження розпилення, нанесення покриття, занурення, обкурювання, просочування, вприскування та напилювання.

Термін "нанесений" означає прилипання до рослини або частини рослини або фізично, або хімічно, включаючи за допомогою просочування.

Із погляду на вищевказане у даному винаході представлена сполука загальної формули (I),



формула (I),

де

R¹ являє собою C₁-C₂галогеналкіл;

L¹ являє собою прямий зв'язок, -CR²R³-, -C(=W¹)-, -O-, -S(=O)₀₋₂₋ і -NR^{4a}-; де знак «-» на початку та в кінці групи позначає точку приєднання або до оксадіазольного кільця, або до A;

L² являє собою прямий зв'язок або -(CR^{2a}R^{3a})₁₋₃₋;

A являє собою ароматичне карбоциклічне кільце або ароматичне гетероциклічне кільце; де гетероатоми ароматичного гетероциклічного кільця вибрані з N, O і S; і кільце A необов'язково

заміщене однією або декількома ідентичними або різними групами R^A ;

R^A вибраний із групи, що складається з водню, галогену, ціано, нітро, аміно, гідрокси, SF_5 , $C_1\text{-}C_6\text{-алкілу}$, $C_2\text{-}C_6\text{-алкенілу}$, $C_2\text{-}C_6\text{-алкінілу}$, $C_3\text{-}C_8\text{-циклоалкілу}$, $C_3\text{-}C_8\text{-циклоалкілалкілу}$, $C_1\text{-}C_6\text{-галогеналкілу}$, $C_1\text{-}C_6\text{-алкокси}\text{-}C_1\text{-}C_4\text{-алкілу}$, $C_1\text{-}C_6\text{-гідроксиалкілу}$, $C_2\text{-}C_6\text{-галогеналкенілу}$, $C_2\text{-}C_6\text{-галогеналкінілу}$, $C_3\text{-}C_8\text{-галогенциклоалкілу}$, $C_1\text{-}C_6\text{-алкокси}$, $C_1\text{-}C_6\text{-галогеналкокси}$, $C_1\text{-}C_6\text{-галогеналкоксикарбонілу}$, $C_1\text{-}C_6\text{-алкілтіо}$, $C_1\text{-}C_6\text{-галогеналкілтіо}$, $C_1\text{-}C_6\text{-галогеналкілсульфінілу}$, $C_1\text{-}C_6\text{-галогеналкілсульфонілу}$, $C_1\text{-}C_6\text{-алкілсульфонілу}$, $C_1\text{-}C_6\text{-алкіламіно}$, $C_1\text{-}C_6\text{-діалкіламіно}$, $C_3\text{-}C_8\text{-циклоалкіламіно}$, $C_1\text{-}C_6\text{-алкіл}\text{-}C_3\text{-}C_8\text{-циклоалкіламіно}$, $C_1\text{-}C_6\text{-алкілкарбонілу}$, $C_1\text{-}C_6\text{-алкоксикарбонілу}$, $C_1\text{-}C_6\text{-алкіламінокарбонілу}$, $C_1\text{-}C_6\text{-діалкіламінокарбонілокси}$, $C_1\text{-}C_6\text{-алкоксикарбонілокси}$, $C_1\text{-}C_6\text{-алкіламінокарбонілокси}$, $C_1\text{-}C_6\text{-діалкіламінокарбонілокси}$, 5-11-членного спіроциклічного кільца і 3-6-членного карбоциклічного або гетероциклічного кільца;

де 5-11-членне спіроциклічне кільце і 3-6-членне карбоциклічне або гетероциклічне кільце можуть бути необов'язково заміщені одним або більше ідентичними або різними замісниками,

вибраними із групи, що складається з галогену, ціано, нітро, гідрокси, $C_1\text{-}C_6\text{-алкілу}$, $C_2\text{-}C_6\text{-алкенілу}$, $C_2\text{-}C_6\text{-алкінілу}$, $C_3\text{-}C_8\text{-циклоалкілу}$, $C_3\text{-}C_8\text{-циклоалкілалкілу}$, $C_1\text{-}C_6\text{-алкоксиалкілу}$, $C_1\text{-}C_6\text{-гідроксиалкілу}$, $C_2\text{-}C_6\text{-галогеналкенілу}$, $C_2\text{-}C_6\text{-галогеналкінілу}$, $C_3\text{-}C_8\text{-галогенциклоалкілу}$, $C_1\text{-}C_6\text{-алкокси}$, $C_1\text{-}C_6\text{-алкілтіо}$, $C_1\text{-}C_6\text{-галогеналкілтіо}$, $C_1\text{-}C_6\text{-галогеналкілсульфінілу}$, $C_1\text{-}C_6\text{-алкілсульфонілу}$, $C_1\text{-}C_6\text{-алкіламіно}$, $C_1\text{-}C_6\text{-алкілсульфонілу}$, $C_1\text{-}C_6\text{-алкіламінокарбонілу}$, $C_1\text{-}C_6\text{-алкіламінокарбонілокси}$, $C_1\text{-}C_6\text{-алкіламінокарбонілокси}$, $C_1\text{-}C_6\text{-алкіламінокарбонілокси}$; або

два R^A разом із атомами, до яких вони приєднані, можуть утворювати 3-10-членні ароматичні або неароматичні карбоциклічні кільце або систему кілець, або ароматичні або неароматичні гетероциклічні кільце або систему кілець; де вказане кільце або система кілець можуть бути необов'язково заміщені однією або більше ідентичними або різними групами R^A ,

вибраними із групи, що складається з галогену, ціано, нітро, $C_1\text{-}C_6\text{-алкілу}$, $C_1\text{-}C_6\text{-галогеналкілу}$, $C_1\text{-}C_6\text{-алкокси}$, $C_1\text{-}C_6\text{-галогеналкокси}$, $C_1\text{-}C_6\text{-алкілтіо}$, $C_1\text{-}C_6\text{-галогеналкілтіо}$, $C_3\text{-}C_8\text{-циклоалкілу}$,

$C_1\text{-}C_6\text{-алкокси}\text{-}C_1\text{-}C_4\text{-алкілу}$, $C_3\text{-}C_8\text{-галогенциклоалкілу}$, $C_1\text{-}C_6\text{-алкіламіно}$, $di\text{-}C_1\text{-}C_6\text{-алкіламінокарбонілу}$, $C_1\text{-}C_6\text{-алкоксикарбонілокси}$, $C_1\text{-}C_6\text{-алкіламінокарбонілокси}$ і $di\text{-}C_1\text{-}C_6\text{-алкіламінокарбонілокси}$; або

де один або більше атомів С неароматичного карбоциклічного кільца можуть бути необов'язково замінені $C(=O)$, $C(=S)$, $C(=CR^{2b}R^{3b})$ і $C=NR^{6a}$;

де гетероатом ароматичного гетероциклічного кільца вибраний із N , O і S ; де гетероатом неароматичного гетероциклічного кільца вибраний із N , O , $S(=O)_{0-2}$ і $S(=O)_{0-1}(=NR^{6a})$, і один або більше атомів С неароматичного гетероциклічного кільца можуть бути необов'язково замінені $C(=O)$, $C(=S)$, $C(=CR^{2b}R^{3b})$ і $C=NR^{6a}$;

R^{4a} , R^{4b} , R^{6a} і R^{6b} незалежно вибрані із групи, що складається із водню, ціано, гідрокси, NR^bR^c , $(C=O)\text{-}R^d$, $S(O)_{0-2}R^e$, $C_1\text{-}C_6\text{-алкілу}$, $C_1\text{-}C_6\text{-галогеналкілу}$, $C_1\text{-}C_6\text{-алкокси}$, $C_1\text{-}C_6\text{-галогеналкокси}$, $C_1\text{-}C_6\text{-алкіламіно}$, $di\text{-}C_1\text{-}C_6\text{-алкіламініо}$ і $C_3\text{-}C_8\text{-циклоалкілу}$;

R^b і R^c незалежно вибрані із групи, що складається з водню, гідроксу, ціано, $C_1\text{-}C_4\text{-алкілу}$, $C_1\text{-}C_4\text{-галогеналкілу}$, $C_1\text{-}C_4\text{-алкокси}$, $C_3\text{-}C_8\text{-циклоалкілу}$ і $C_3\text{-}C_8\text{-галогенциклоалкілу}$;

R^d вибраний із групи, що складається з водню, гідрокси, галогену, NR^bR^c , $C_1\text{-}C_6\text{-алкілу}$, $C_1\text{-}C_6\text{-галогеналкілу}$, $C_1\text{-}C_6\text{-алкокси}$, $C_1\text{-}C_6\text{-галогеналкокси}$, $C_3\text{-}C_8\text{-циклоалкілу}$ і $C_3\text{-}C_8\text{-галогенциклоалкілу}$;

R^e вибраний із групи, що складається з водню, галогену, ціано, $C_1\text{-}C_6\text{-алкілу}$, $C_1\text{-}C_6\text{-галогеналкілу}$, $C_1\text{-}C_6\text{-алкокси}$, $C_1\text{-}C_6\text{-галогеналкокси}$, $C_3\text{-}C_8\text{-циклоалкілу}$ і $C_3\text{-}C_8\text{-галогенциклоалкілу}$;

R^f , R^g , R^{2a} , R^{3a} , R^{2b} , R^{3b} , R^{2c} , R^{3c} , R^{2d} , R^{3d} , R^{2e} , R^{3e} , R^{2f} і R^{3f} незалежно вибрані із групи, що складається з водню, галогену, ціано, $C_1\text{-}C_4\text{-алкілу}$, $C_2\text{-}C_4\text{-алкенілу}$, $C_2\text{-}C_4\text{-алкінілу}$, $C_1\text{-}C_4\text{-галогеналкілу}$, $C_2\text{-}C_4\text{-галогеналкенілу}$, $C_2\text{-}C_4\text{-галогеналкінілу}$, $C_3\text{-}C_6\text{-циклоалкілу}$, $C_3\text{-}C_6\text{-галогенциклоалкілу}$, $C_1\text{-}C_4\text{-алкокси}$ і $C_1\text{-}C_4\text{-галогеналкокси}$; або

R^2 і R^3 ; R^{2a} і R^{3a} ; R^{2b} і R^{3b} ; R^{2c} і R^{3c} ; R^{2d} і R^{3d} ; та/або R^{2f} і R^{3f} разом з атомами, до яких вони приєднані, можуть утворювати 3-5-членне неароматичне карбоциклічне кільце або

гетероциклічне кільце, які можуть бути необов'язково заміщені галогеном, $C_1\text{-}C_2\text{-алкілом}$, $C_1\text{-}C_2\text{-галогеналкілом}$ або $C_1\text{-}C_2\text{-алкокси}$;

W^1 являє собою О або S;

Q являє собою прямий зв'язок, O, $S(=O)_{0-2}$, $S(=O)_{0-1}(=NR^{4b})$, NR^{4b} , $CR^{2e}R^{3e}$, $-N=S(=NR^{8a})(R^{8b})-$, $-N=S(=O)_{0-1}(R^{8c})-$;

R^{10} вибраний із групи групи, що складається з водню, галогену, гідрокси, ціано, $C_1\text{-}C_6\text{-алкілу}$,

або більше групами R^7 ; або

Q^1 вибраний із 3-7-членного неароматичного карбоциклічного кільця, 4-, 5-, 6- або 7-членного неароматичного гетероциклічного кільця, 8-15-членної неароматичної поліциклічної кільцевої системи, 5-15-членної спіроциклічної кільцевої системи або 8-15-членної неароматичної конденсованої кільцевої системи, де гетероатом у неароматичних кільцях вибраний із N, O або S(O)₀₋₂, і член кільця, що являє собою C, неароматичних карбоциклічних або неароматичних гетероциклічних кілець або кільцевих систем може бути замінений C(O), C(S), C(=CR^{2c}R^{3c}) або C(=NR^{6b}), і кожні кільце або кільцева система можуть бути необов'язково заміщені однією або більше групами R⁷;

NR¹³C(=S)R¹⁵, -O(C=S)R¹⁵, -O(C=S)NR¹³R¹⁴, -O(C=S)SR¹⁶, -N=C(R¹⁵)₂, -NHCN, -SO₂NHCN, -C(=O)NHCN, -C(=S)NHCN, -C(=S(O))NHCN і -SO₂NR¹²R¹³; або R^{8a} і R^{8b}; R^{8a} і R¹⁰; R^{8b} і R¹⁰; R^{8c} і R¹⁰; R^{4b} і R¹⁰; R^{2f} і R¹⁰; і або R^{3f} і R¹⁰ разом із атомами, до яких вони приєднані, можуть утворювати 3-8-членні гетероциклічні кільце або кільцеву систему, де гетероатом вибраний із групи, що складається з N, O і S(O)₀₋₂, і член кільця, що являє собою C, гетероциклічного кільця або кільцевої системи може бути замінений C(O), C(S), C(=CR^{2c}R^{3c}) або C(=NR^{6b}), і вказані гетероциклічні кільце або кільцева система можуть бути необов'язково заміщені галогеном, ціано, C₁-C₄-алкілом, C₂-C₄-алкенілом, C₂-C₄-алкінілом, C₁-C₄-галогеналкілом, C₂-C₄-галогеналкенілом, C₂-C₄-галогеналкінілом, C₃-C₆-циклоалкілом, C₃-C₆-галогенциклоалкілом, C₁-C₄-алкокси або C₁-C₄-галогеналкокси;

5 R¹² вибраний із групи, що складається із C₁-C₆-алкілу, C₁-C₆-галогеналкілу, C₃-C₈-циклоалкілу і C₃-C₈-галогенциклоалкілу;

10 R¹³ і R¹⁴ незалежно вибрані із групи, що складається з водню, гідроксилу, ціано, C₁-C₆-алкілу, C₁-C₆-галогеналкілу, C₁-C₆-алкокси, C₃-C₈-циклоалкілу, C₃-C₈-галогенциклоалкілу, фенілу і 5- або 6-членного гетероциклічного кільця; де вказаний феніл, 5- або 6-членне гетероциклічне кільце можуть бути необов'язково заміщені галогеном, C₁-C₆-алкілом, C₁-C₆-галогеналкілом, C₃-C₈-циклоалкілом, C₃-C₈-галогенциклоалкілом і C₁-C₆-алкілтіо; або

15 R¹³ і R¹⁴ разом із атомом N, до якого вони приєднані, можуть утворювати 3-7-членні гетероциклічні кільце; де гетероатом гетероциклічного кільця вибраний із N, O або S(O)₀₋₂, і член кільця, що являє собою C, гетероциклічного кільця може бути замінений C(O) і C(S), де вказане гетероциклічне кільце може бути необов'язково заміщене галогеном, C₁-C₆-алкілом, C₁-C₆-галогеналкілом, C₁-C₆-алкокси, C₃-C₈-циклоалкілом, C₃-C₈-галогенциклоалкілом і C₁-C₆-алкілтіо;

20 R¹⁵ являє собою водень, гідрокси, галоген, аміно, C₁-C₆-алкіламіно, ди-C₁-C₆-алкіламіно, C₁-C₆-алкіл, C₁-C₆-галогеналкіл, C₁-C₆-алкокси, C₁-C₆-галогеналкокси, C₃-C₈-циклоалкіл, C₃-C₈-циклоалкіл, феніл, 5- або 6-членне гетероциклічне кільце, де вказаний феніл, 3-6-членні гетероциклічні кільце можуть бути необов'язково заміщені галогеном, C₁-C₆-алкілом, C₁-C₆-галогеналкілом, C₁-C₆-алкокси, C₃-C₈-циклоалкілом, C₃-C₈-галогенциклоалкілом і C₁-C₆-алкілтіо;

25 R¹⁶ являє собою водень, галоген, ціано, C₁-C₆-алкіл, C₁-C₆-галогеналкіл, C₁-C₆-алкокси, C₁-C₆-галогеналкокси, C₃-C₈-циклоалкіл і C₃-C₈-циклоалкіл;

30 та/або її N-оксиди, комплекси з металами, ізомери, поліморфи або прийнятні з погляду сільського господарства солі.

В одному варіанті здійснення в даному винаході передбачена сполука формули (I), де

35 R¹ являє собою C₁-галогеналкіл, де галоген являє собою хлор або фтор;

L¹ являє собою прямий зв'язок;

L² являє собою прямий зв'язок;

40 А являє собою 3-6-членні ароматичне карбоциклічне кільце або ароматичне гетероциклічне кільце, де гетероатом ароматичного гетероциклічного кільця вибраний із N, O і S; і A необов'язково заміщений однією або більше ідентичними або різними групами R^A;

R^A вибраний із групи, що складається з водню, галогену, ціано, нітро, аміно, гідрокси, SF₅, C₁-C₆-алкілу, C₂-C₆-алкенілу, C₂-C₆-алкінілу, C₃-C₈-циклоалкілу, C₃-C₈-циклоалкілалкілу, C₁-C₆-галогеналкілу, C₁-C₆-алкокси-С₁-C₄-алкілу, C₁-C₆-гідроксиалкілу, C₂-C₆-галогеналкенілу, C₂-C₆-галогеналкіну, C₃-C₈-галогенциклоалкілу, C₁-C₆-алкокси, C₁-C₆-галогеналкокси, C₁-C₆-галогеналкоксикарбонілу і C₁-C₆-алкілтіо;

45 W¹ являє собою O;

Q являє собою прямий зв'язок, O, S(=O)₀₋₂, S(=O)₀₋₁(=NR^{4b}), NR^{4b}, CR^{2e}R^{3e}, -N=S(=NR^{8a})(R^{8b})-; -N=S(=O)₀₋₁(R^{8c})-.

50 R¹⁰ вибраний із групи, що складається з галогену, гідрокси, ціано, C₁-C₆-алкілу, C₂-C₆-алкенілу, C₂-C₆-алкінілу, C₁-C₆-галогеналкілу, C₂-C₆-галогеналкенілу, C₂-C₆-галогеналкінілу, C₃-C₈-циклоалкілу, C₃-C₈-галогенциклоалкілу, C₁-C₆-алкіл-С₃-C₈-циклоалкілу, C₃-C₈-циклоалкіл-С₁-C₆-алкілу, C₁-C₆-алкіл-С₃-C₈-циклоалкіл-С₁-C₆-алкілу, C₃-C₈-циклоалкенілу, C₁-C₆-алкокси, C₁-C₆-алкокси-С₁-C₆-алкілу, C₃-C₈-циклоалкокси-С₁-C₆-алкілу, C₁-C₆-алкіл-С₁-C₆-тіоалкілу, C₁-C₆-алкілсульфіл-С₁-C₆-алкілу, C₁-C₆-алкілсульфоніл-С₁-C₆-алкілу, C₁-C₆-алкіламіно, ди-C₁-C₆-алкіламіно, C₁-C₆-алкіламіно-С₁-C₆-алкілу, ди-C₁-C₆-алкіламіно-С₁-C₆-алкілу, C₁-C₆-галогеналкіламіно-С₁-C₆-алкілу, C₃-C₈-циклоалкіламіно, C₃-C₈-циклоалкіламіно-С₁-C₆-алкілу, C₁-C₆-алкілкарбонілу, C₁-C₆-гідроксиалкілу, C₂-C₆-гідроксиалкенілу, C₂-C₆-гідроксиалкінілу, C₂-C₆-алкенілокси, C₂-C₆-галогеналкенілокси, C₁-C₆-алкілкарбонілалкокси, C₁-C₆-алкілтіо, C₁-C₆-галогеналкілтіо, C₃-C₈-циклоалкілтіо, C₁-C₆-алкілсульфілілу, C₁-C₆-галогеналкілсульфілілу, C₁-C₆-алкілсульфонілілу, C₃-C₈-циклоалкілсульфонілілу;

55 60 C₁-C₆-алкілсульфонілілу, C₁-C₆-галогеналкілсульфонілілу, C₃-C₈-циклоалкілсульфонілілу.

циклоалкілсульфінілу, три-С₁-С₆-алкілсилілу, С₁-С₆-алкілсульфоніламіно, С₁-С₆-галогеналкілсульфоніламіно, С₁-С₆-алкілкарбонілтіо, С₁-С₆-алкілсульфонілокси, С₁-С₆-арилсульфонілокси, С₆-С₁₀-арилсульфонілокси, С₆-С₁₀-арилсульфінілокси, С₆-С₁₀-арилсульфоніламіно, С₆-С₁₀-арилсульфініламіно, С₆-С₁₀-арилтіо, С₁-С₆-ціаноалкілу, С₂-С₆-алкінілтіо, С₂-С₆-алкеніламіно, С₂-С₆-алкініламіно, С₁-С₆-галогеналкіламіно, С₁-С₆-алкоксиаміно, С₁-С₆-галогеналкоксиаміно, С₁-С₆-алкоксикарбоніламіно, С₂-С₆-алкенілтіо, SF₅, -OR¹², -NR¹³R¹⁴, нітро, -SH, -SCN, -C(=O)R¹⁵, -C(=O)OR¹², -C(=O)NR¹³R¹⁴, -NR¹³C(=O)R¹⁵ і Z¹Q¹.

В іншому варіанті здійснення в даному винаході передбачена сполука формули (I), де R¹ являє собою С₁-галогеналкіл, де галоген являє собою хлор або фтор;

L¹ являє собою прямий зв'язок;

L² являє собою прямий зв'язок;

А являє собою феніл або піridил; де вказане фенільне або піридильне кільце може бути необов'язково заміщене однією або більше ідентичними або різними групами R^A;

R^A вибраний із групи, що складається з водню, галогену, ціано, нітро, аміно, гідрокси, SF₅, С₁-С₆-алкілу, С₃-С₈-циклоалкілу, С₁-С₆-галогеналкілу, С₁-С₆-гідроксиалкілу, С₃-С₈-галогенциклоалкілу, С₁-С₆-алкокси і С₁-С₆-галогеналкокси;

W¹ являє собою О;

Q являє собою прямий зв'язок, O, S(=O)₀₋₂, S(=O)₀₋₁(=NR^{4b}), NR^{4b} і CR^{2e}R^{3e};

R¹⁰ вибраний із групи, що складається з галогену, гідрокси, ціано, С₁-С₆-алкілу, С₂-С₆-алкенілу, С₂-С₆-алкінілу, С₁-С₆-галогеналкілу, С₂-С₆-галогеналкенілу, С₂-С₆-галогеналкінілу, С₃-С₈-циклоалкілу, С₃-С₈-галогенциклоалкілу, С₁-С₆-алкіл-С₃-С₈-циклоалкілу, С₃-С₈-циклоалкіл-С₁-С₆-алкілу, С₁-С₆-алкіл-С₃-С₈-циклоалкіл-С₁-С₆-алкілу, С₃-С₈-циклоалкенілу, С₁-С₆-алкокси, С₁-С₆-алкокси-С₁-С₆-алкілу, С₃-С₈-циклоалкокси-С₁-С₆-алкілу, С₁-С₆-алкіл-С₁-С₆-тіоалкілу, С₁-С₆-алкілсульфініл-С₁-С₆-алкілу, С₁-С₆-алкілсульфоніл-С₁-С₆-алкілу, С₁-С₆-алкіламіно, ди-С₁-С₆-алкіламіно, С₁-С₆-алкіламіно-С₁-С₆-алкілу, С₁-С₆-галогеналкіламіно-С₁-С₆-алкілу, С₃-С₈-циклоалкіламіно, С₁-С₆-циклоалкіламіно-С₁-С₆-алкілу, С₁-С₆-алкілкарбонілу, С₁-С₆-гідроксиалкілу, С₂-С₆-гідроксиалкенілу, С₂-С₆-гідроксиалкінілу, С₂-С₆-алкенілопокси, С₂-С₆-галогеналкенілопокси, С₁-С₆-алкілкарбонілалкокси, С₁-С₆-алкілтіо, С₁-С₆-галогеналкілтіо, С₁-С₆-циклоалкілтіо, С₁-С₆-алкілсульфінілу, С₁-С₆-галогеналкілсульфінілу, С₁-С₆-алкілсульфонілу, С₃-С₈-циклоалкілсульфонілу, С₁-С₆-алкілсульфонілу, три-С₁-С₆-алкілсилілу, С₁-С₆-алкілсульфоніламіно, С₁-С₆-галогеналкіламіно, С₁-С₆-алкоксиаміно, С₁-С₆-галогеналкоксиаміно, С₁-С₆-алкоксикарбоніламіно, С₂-С₆-алкенілтіо, SF₅, -OR¹², -NR¹³R¹⁴, нітро, -SH, -SCN, -C(=O)R¹⁵, -C(=O)OR¹², -C(=O)NR¹³R¹⁴, -NR¹³C(=O)R¹⁵ і Z¹Q¹.

У переважному варіанті здійснення сполука формули (I) вибрана із 2-фенокси-1-(4-(5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл)феніл)етан-1-ону; 2-(2-фторфенокси)-1-(4-(5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл)феніл)етан-1-ону; 2-(4-метоксифенокси)-1-(4-(5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл)феніл)етан-1-ону; 2-(4-бромфенокси)-1-(4-(5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл)феніл)етан-1-ону; 2-(4-хлорфенокси)-1-(4-(5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл)феніл)етан-1-ону; 2-(2,6-дихлорфенокси)-1-(4-(5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл)феніл)етан-1-ону; 2-(3-бром-4-метилфенокси)-1-(4-(5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл)феніл)етан-1-ону; 2-(3-фторфенокси)-1-(4-(5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл)феніл)етан-1-ону; 2-(4-фторфенокси)-1-(4-(5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл)феніл)етан-1-ону; 2-(2-(м-толілокси)-1-(4-(5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл)феніл)етан-1-ону; 2-(2-(метоксифенокси)-1-(4-(5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл)феніл)етан-1-ону; 2-(4-бром-3-фторфенокси)-1-(4-(5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл)феніл)етан-1-ону; 2-(4-хлор-3-(трифторметил)фенокси)-1-(4-(5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл)феніл)етан-1-ону; 2-((2,6-дихлорфеніл)тіо)-1-(4-(5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл)феніл)етан-1-ону; 2-((3-метоксифеніл)тіо)-1-(4-(5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл)феніл)етан-1-ону; 2-(3,5-дихлорфенокси)-1-(4-(5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл)феніл)етан-1-ону; 2-(2,5-диметилфенокси)-1-(4-(5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл)феніл)етан-1-ону; 2-(5-хлор-2-метилфенокси)-1-(4-(5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл)феніл)етан-1-ону; 2-(2,4-дифторфенокси)-1-(4-(5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл)феніл)етан-1-ону; 2-(2-хлор-4-фторфенокси)-1-(4-(5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл)феніл)етан-1-ону; 2-(2,4-дихлорфенокси)-1-(4-(5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл)феніл)етан-1-ону; 2-(піridин-3-ілокси)-1-(4-(5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-

(5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл)феніл)-2-(3,3,3-трифторпропокси)етан-1-ону; 1-(3-фтор-4-(5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл)феніл)-2-метоксietан-1-ону; 2-етокси-1-(3-фтор-4-(5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл)феніл)-2-ізопропоксиетан-1-ону; 1-(3-фтор-4-(5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл)феніл)-2-(2-метоксietокси)етан-1-ону; 2-(цикlopропілметокси)-1-(3-фтор-4-(5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл)феніл)-2-(піridin-3-ілокси)етан-1-ону; 1-(2-фтор-4-(5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл)феніл)-2-(2-хлор-4-(трифторметил)фенокси)-1-(2-фтор-4-(5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл)феніл)-2-(2-хлор-4-фторфенокси)-1-(2-фтор-4-(5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл)феніл)-2-(4-фторфенокси)етан-1-ону; 2-(бензилокси)-1-(2-фтор-4-(5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл)феніл)-2-(2-хлор-4-(5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл)феніл)-2-((4-метилбензил)окси)етан-1-ону; 1-(2-фтор-4-(5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл)феніл)-2-((4-метилбензил)окси)етан-1-ону; 2-(2,6-дихлорфенокси)-1-(2-фтор-4-(5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл)феніл)-2-((2-хлорбензил)окси)-1-(2-фтор-4-(5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл)феніл)-2-(2-хлор-6-метоксифенокси)-1-(2-фтор-4-(5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл)феніл)-2-((2-фтор-4-(5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл)феніл)-2-4-(трифторметокси)фенокси)етан-1-ону; 1-(2-фтор-4-(5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл)феніл)-2-((1-метил-1Н-імідазол-4-іл)метокси)етан-1-ону; 2-(3-хлор-4-(трифторметил)фенокси)-1-(2-фтор-4-(5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл)феніл)-2-((2,4-дифторфенокси)-1-(2-фтор-4-(5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл)феніл)-2-((1-метил-1Н-піразол-4-іл)метокси)етан-1-ону; 1-(2-фтор-4-(5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл)феніл)-2-((1-метил-1Н-піразол-4-іл)метокси)етан-1-ону; 1-(2-фтор-4-(5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл)феніл)-2-феноксietан-1-ону; 1-(2-фтор-4-(5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл)феніл)-2-(тіазол-4-ілметокси)етан-1-ону; 1-(2-фтор-4-(5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл)феніл)-2-(оксазол-4-ілметокси)етан-1-ону; 2-((1,2,4-оксадіазол-3-іл)метокси)-1-(2-фтор-4-(5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл)феніл)-2-((1-метил-1Н-1,2,4-триазол-3-іл)метокси)етан-1-ону; 1-(2-фтор-4-(5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл)феніл)-2-(3,3,3-трифторпропокси)етан-1-ону; 1-(2-фтор-4-(5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл)феніл)-2-метокsietan-1-ону; 2-етокси-1-(2-фтор-4-(5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл)феніл)-2-ізопропоксиетан-1-ону; 1-(2-фтор-4-(5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл)феніл)-2-(2-метокsietoksi)етан-1-ону; 2-(цикlopропілметокси)-1-(2-фтор-4-(5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл)феніл)-2-(2-оксо-2-(4-(5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл)феніл)піперазин-2-ону і 4-метил-1-(2-оксо-2-(4-(5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл)феніл)піперазин-2-ону.

Сполука за даним винаходом може існувати у вигляді одного або більше стереоізомерів. Різні стереоізомери включають енантіомери, діастереомери, атропоізомери та геометричні ізомери. Фахівець в даній галузі зрозуміє, що один стереоізомер може бути більш активним та/або може проявляти сприятливі ефекти у разі збагачення відносно іншого(-их) стереоізомера(-ів) або у разі відділення від іншого(-их) стереоізомера(-ів). Крім того, фахівцю у даний галузі техніки відомо, як розділяти, збагачувати та/або селективно одержувати вказані стереоізомери. Сполука за даним винаходом може знаходитися у вигляді суміші стереоізомерів, окремих стереоізомерів або у вигляді оптично активної форми.

Аніонна частина солі, у випадку коли сполука формули I є катіонною або здатною до утворення катіона, може бути неорганічною або органічною. Альтернативно катіонна частина солі у випадку, коли сполука формули (I) є аніонною або здатною до утворення аніона, може бути неорганічною або органічною. Приклади неорганічної аніонної частини солі включають без обмеження хлорид, бромід, йодид, фторид, сульфат, фосфат, нітрат, нітрит, гідрокарбонати, гідросульфат. Приклади органічної аніонної частини солі включають без обмеження форміат, алканоати, карбонати, ацетати, трифторацетат, трихлорацетат, пропіонат, гліколят, тіоціанат, лактат, сукцинат, малат, цитрати, бензоати, цинамати, оксалати, алкілсульфати, алкілсульфонати, арилсульфонати, арилдисульфонати, алкілфосфонати, арилфосфонати, арилдифосфонати, п-толуолсульфонат і саліцилат. Приклади неорганічної катіонної частини солі включають без обмеження лужні та лужноземельні метали. Приклади органічної катіонної частини солі включають без обмеження піridин, метиламін, імідазол, бензимідазол, пітидин,

фосфазен, тетраметиламоній, тетрабутиламоній, холін і триметиламін.

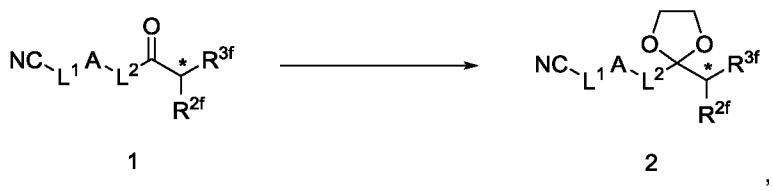
Іоni металів у комплексах металів зі сполукою формули (I), зокрема, являють собою йоni елементів другої головної групи, особливо кальцію та магнію, третьої та четвертої головної групи, особливо алюмінію, олова та свинцю, а також першої – восьмої перехідних груп, особливо хрому, марганцю, заліза, кобальту, нікелю, міді, цинку та інших. Особливу перевагу надають юnam металів із елементів четвертого періоду та першої – восьмої перехідних груп. В даному документі метали може бути присутніми в різних валентностях, яких вони можуть набувати.

Сполука, вибрана із формули (I) (включаючи всi її стереоізомери, N-оксиди та солі), загалом може існувати в бiльше нiж однiй формi. Формула I таким чином включає всi кристалiчнi та некристалiчнi форми сполуки, якi представленi формулою (I). Некристалiчнi форми включають варiанти здiйснення, якi являють собою твердi речовини, такi як воски та смоли, а також варiанти здiйснення, якi являють собою рiдини, такi як розчини та розплавi. Кристалiчнi форми включають варiанти здiйснення, якi являють собою по сuti монокристалiчний тип, i варiанти здiйснення, якi являють собою сумiш полiморfiv (тобто рiзних кристалiчних типiв). Термiн "полiморf" вiдноситься до конкретної кристалiчної форми хiмiчної сполуки, яка може кристалiзуватися у рiзнi кристалiчнi формi, при цьому цi форми характеризуються рiзними варiантами розташування та/або конформацiями молекули в кристалiчнiй ґратцi. Хоча полiморfi можуть характеризуватися однаковим хiмiчним складом, вони також можуть вiдрiзнятися за складом внаслiдок присутностi або вiдсутностi сумiсно кристалiзованої води або iнших молекул, якi можуть бути слабко або мiцно зв'язанi в ґратцi. Полiморfi можуть вiдрiзнятися за хiмiчними, фiзичними та бiологiчними властивостями, такими як форма кристалu, густина, твердiсть, колiр, хiмiчна стабiльнiсть, точка плавлення, гiроскопiчнiсть, здатнiсть до суспендування, швидкiсть розчинення та бiологiчна доступнiсть. Фахiвець у данiй галузi зрозумiє, що полiморf сполуки, представленої формулою (I), може демонструвати кориснi ефекти (наприклад, придатнiсть до одержання застосовних складiв, полiпшенi бiологiчнi показники) порiвняно з iншим полiморfom або сумiшшю полiморfiv тiєї самої сполуки, представленої формулою (I). Одержання та видiлення конкретного полiморfa сполуки, представленої формулою (I), можна досягнути за допомогою способiв, вiдомих фахiвцям у данiй галузi технiки, включаючи, наприклад, кристалiзацiю iз застосуванням вибраних розчинникiв i температур.

В одному варiантi здiйснення в даному винаходi передбачений спосiб одержання сполуки формули (I).

В одному варiантi здiйснення в даному винаходi передбачений спосiб одержання сполуки формули (I), який передбачає стадii:

а) введення захисної групи на карбонiльну групу сполуки формули 1 iз застосуванням придатного захисного засобу з одержанням сполуки формули 2;



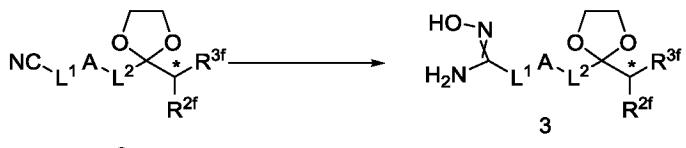
1

2

,

де L^1 являє собою прямий зв'язок; А являє собою арил, і L^2 являє собою прямий зв'язок;

б) здiйснення реакцiї сполуки формули 2 з гiдроксиламiном iз одержанням сполуки формули 3;



2

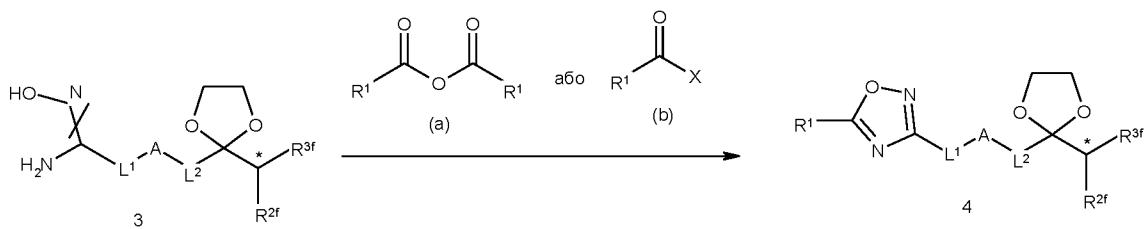
3

,

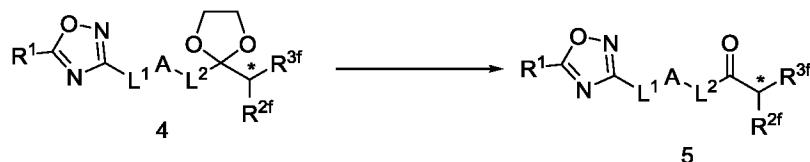
де L^1 являє собою прямий зв'язок; А являє собою арил, і L^2 являє собою прямий зв'язок;

с) здiйснення реакцiї сполуки формули 3 iз придатним ангiдридом карбонової кислоти формули а або хлоридом карбонової кислоти формули b iз одержанням сполуки формули 4;

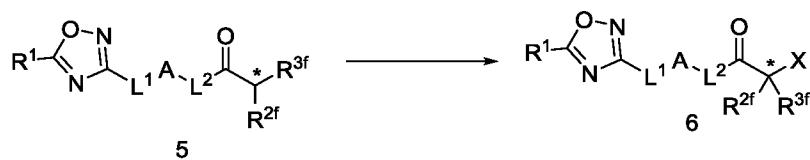
50



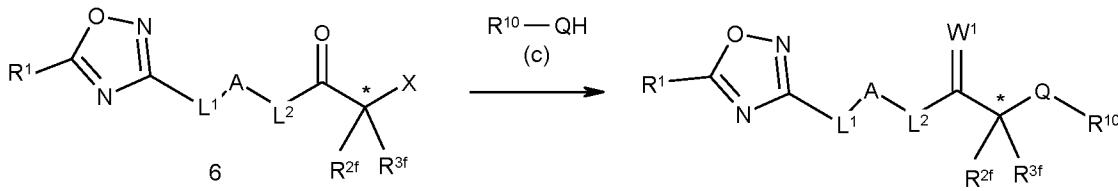
- 5 де L^1 являє собою прямий зв'язок; А являє собою арил, і L^2 являє собою прямий зв'язок;
д) видалення захисної групи зі сполуки формули 4 у присутності придатного засобу для видалення захисної групи з одержанням сполуки формули 5;



- 10 де L^1 являє собою прямий зв'язок; А являє собою арил, і L^2 являє собою прямий зв'язок;
е) галогенування сполуки формули 5 у присутності придатного засобу для галогенування з одержанням сполуки формули 6;



- 15 де L^1 являє собою прямий зв'язок; А являє собою арил, і L^2 являє собою прямий зв'язок;
ф) здійснення реакції сполуки формули 6 зі сполукою формули (c) з одержанням сполуки формули (l);



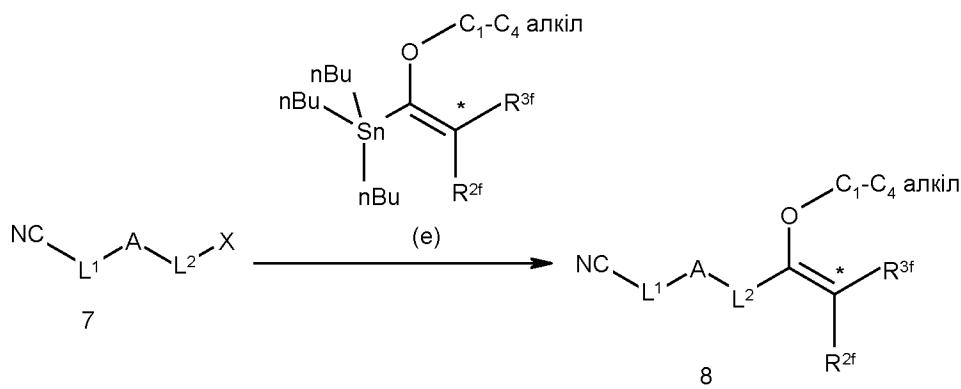
Формула 1

- 20 де L^1 являє собою прямий зв'язок; А являє собою арил; L^2 являє собою прямий зв'язок; Х являє собою Br, Cl або I; W^1 являє собою O; R^1 , W^1 , R^{2f} , R^{3f} , Q і R^{10} мають такі самі значення, як визначено в детальному описі вище.

- 25 В іншому варіанті здійснення в даному винаході передбачений спосіб одержання сполуки формули (l), який передбачає стадії:

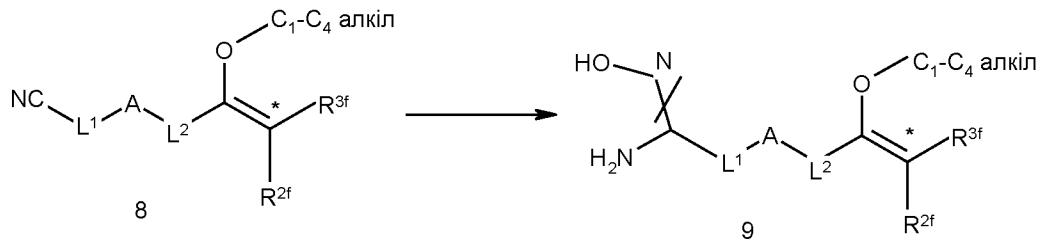
алкіл

- а) здійснення реакції сполуки формули 7 зі сполукою формули (e) з одержанням сполуки формули 8;



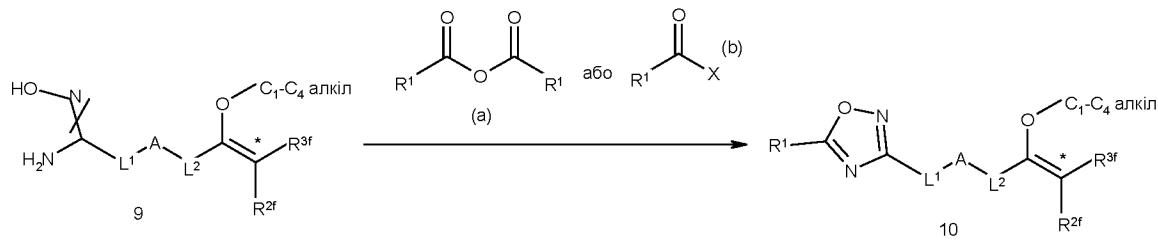
де L^1 являє собою прямий зв'язок; А являє собою арил або піridил; L^2 являє собою прямий зв'язок, і X являє собою Br, Cl або I;

- 5 b) здійснення реакції сполуки формули 8 з гідроксиламіном із одержанням сполуки формули 9;



- 10 де L^1 являє собою прямий зв'язок; А являє собою арил або піridил, і L^2 являє собою прямий зв'язок;

c) здійснення реакції сполуки формули 9 із придатним ангідридом карбонової кислоти формули a або хлоридом карбонової кислоти формули b із одержанням сполуки формули 10;

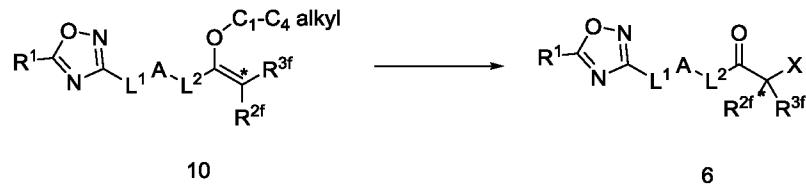


15

де L^1 являє собою прямий зв'язок; А являє собою арил або піridил, і L^2 являє собою прямий зв'язок;

алкіл

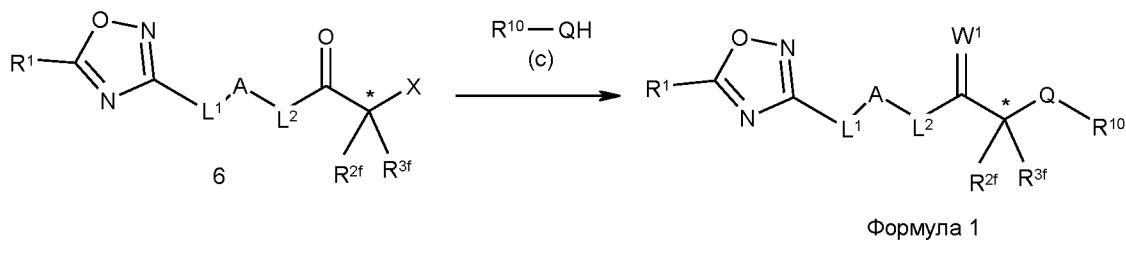
- 20 d) галогенування сполуки формули 10 у присутності придатного засобу для галогенування з одержанням сполуки формули 6;



25

де L^1 являє собою прямий зв'язок; А являє собою арил або піridил; L^2 являє собою прямий зв'язок, і X являє собою Br, Cl або I;

e) здійснення реакції сполуки формули 6 зі сполукою формули (c) з одержанням сполуки формули (l);

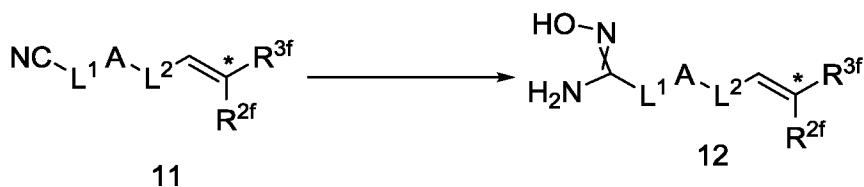


де L^1 являє собою прямий зв'язок; A являє собою арил або піridил; L^2 являє собою прямий зв'язок; X являє собою Br, Cl або I; W^1 являє собою O; R^1 , R^{2f} , R^{3f} , Q і R^{10} мають такі самі значення, як визначено в детальному описі вище.

У ще іншому варіанті здійснення в даному винаході передбачений спосіб одержання сполуки формули (I), який передбачає стадії:

а) здійснення реакції сполуки формули 11 з гідроксиміном із одержанням сполуки формули 12;

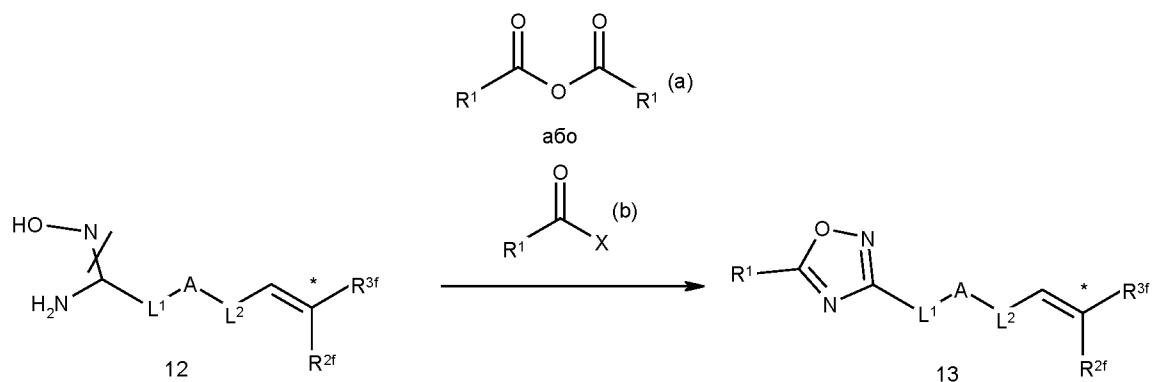
10



де L^1 являє собою прямий зв'язок; A являє собою арил або піridил, і L^2 являє собою прямий зв'язок;

15

б) здійснення реакції сполуки формули 12 із придатним ангідридом карбонової кислоти формули а або хлоридом карбонової кислоти формули б із одержанням сполуки формули 13;



20

де L^1 являє собою прямий зв'язок; A являє собою арил або піridил, і L^2 являє собою прямий зв'язок;

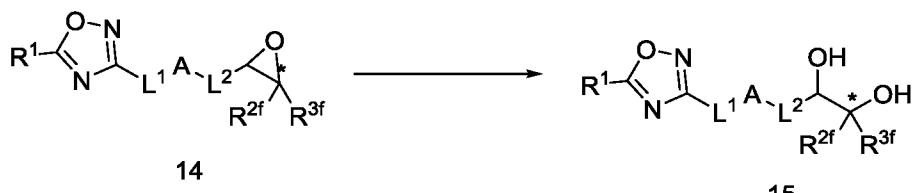
с) здійснення реакції сполуки формули 13 із придатним окиснювальним засобом із одержанням сполуки формули 14;



25

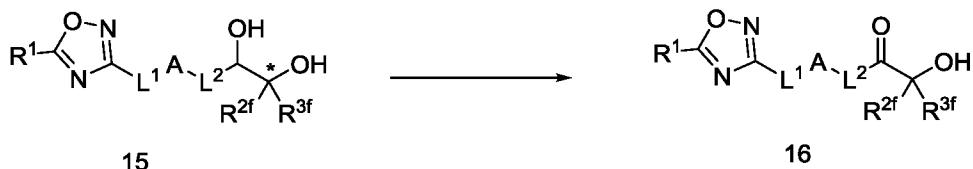
де L^1 являє собою прямий зв'язок; A являє собою арил або піridил, і L^2 являє собою прямий зв'язок;

д) здійснення гідролізу сполуки формули 14 у присутності придатного гідролізувального засобу з одержанням сполуки формули 15;



де L^1 являє собою прямий зв'язок; A являє собою арил або піридил, і L^2 являє собою прямий зв'язок;

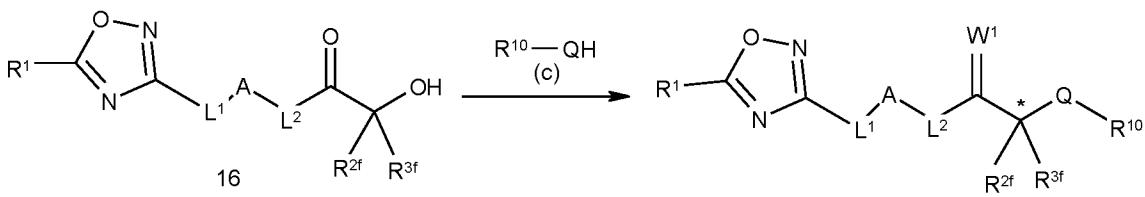
- 5 e) окислення сполуки формули 15 у присутності придатного окиснювального засобу з одержанням сполуки формули 16;



- 10 де L^1 являє собою прямий зв'язок; A являє собою арил або піридил, і L^2 являє собою прямий зв'язок;

f) здійснення реакції сполуки формули 16 зі сполукою формули (c) з одержанням сполуки формули (I);
формула I

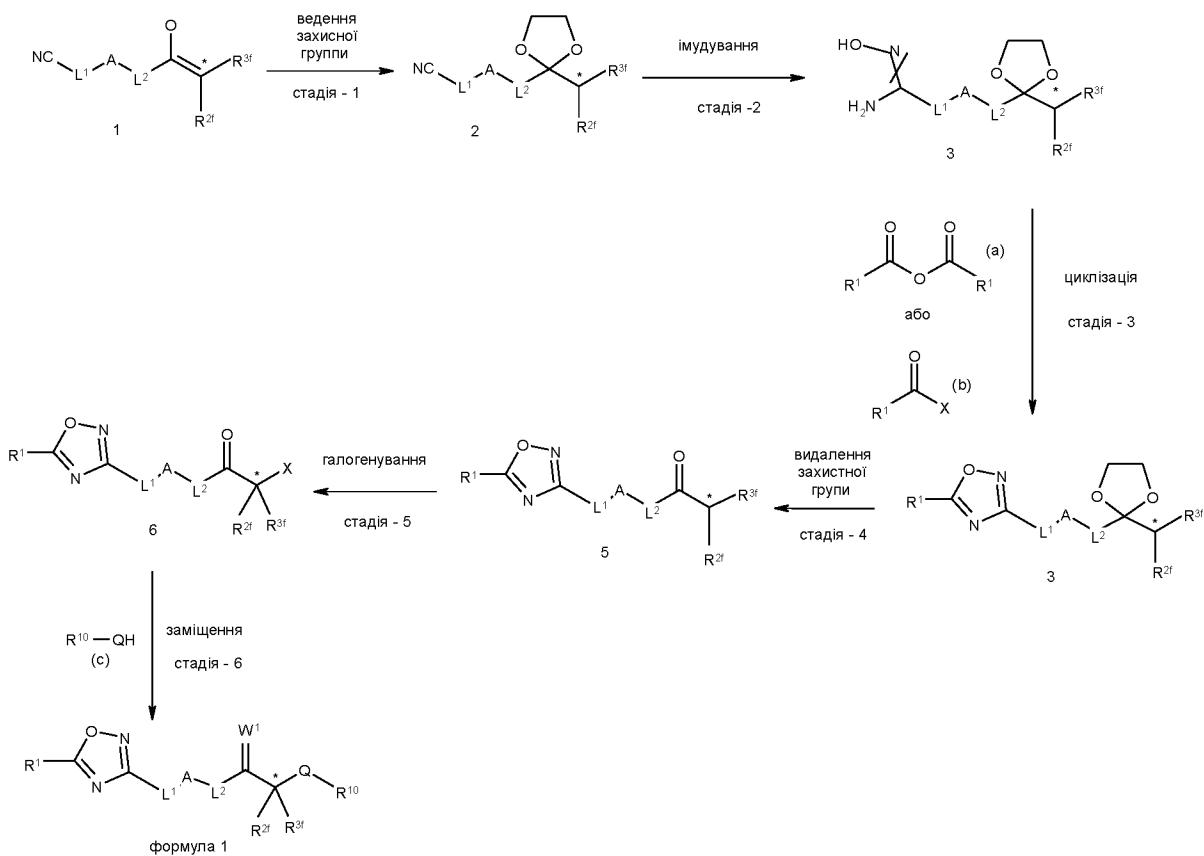
15



- 20 де L^1 являє собою прямий зв'язок; A являє собою арил або піридил; L^2 являє собою прямий зв'язок; W^1 являє собою O; R^1 , R^{2f} , R^{3f} , Q і R^{10} мають такі самі значення, як визначені в детальному описі вище.

Сполуки за даним винаходом, визначені загальною формулою (I) та/або в таблицях 1-8, можна одержувати відомим способом різними шляхами, описаними на схемах 1-3.

Схема 1



5 де L^1 являє собою прямий зв'язок; А являє собою арил; L^2 являє собою прямий зв'язок; Х являє собою Br, Cl або I, і W^1 являє собою O; R^1 , R^{2f} , R^{3f} , R^{10} і Q мають такі самі значення, як визначено в детальному описі вище.

Сполуча формули 2 може бути одержана за допомогою захисту карбонільної сполуки формули 1 етиленгліколем у присутності N-бромускциніміду і триметилортотформіату при температурі від температури навколошнього середовища до температури нагрівання зі зворотним холодильником.

Сполуча формули 3 може бути одержана за допомогою здійснення реакції нітрильної сполуки формули 2 з гідроксиламіном у полярних протонних розчинниках, таких як етанол, метанол тощо. Альтернативно ця реакція може також бути здійснена з використанням гідроксиламіну гідрохлориду в присутності органічних та неорганічних основ, таких як триетиламін, діїзопропіламін, бікарбонат натрію тощо.

Сполуча формули 4 може бути одержана за допомогою здійснення реакції сполучки формули 3 та ангідриду карбонової кислоти формули а. Альтернативно сполуча формули 4 може також бути одержана за допомогою здійснення реакції із хлоридом карбонової кислоти формули б. Такі реакції, як правило, проводять в апротонних розчинниках, таких як тетрагідрофуран, 1,4-діоксан, дихлорметан тощо. Необов'язково в присутності основ, таких як триетиламін, діїзопропіламін тощо при 0-50 °C.

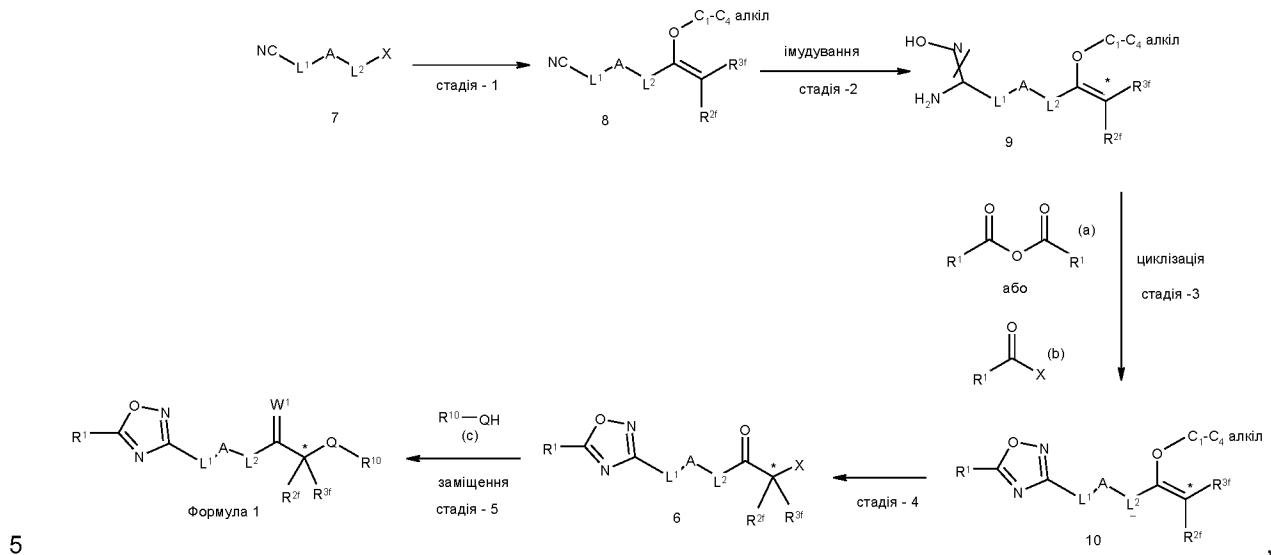
Сполуча формули 5 може бути одержана за допомогою видалення захисної групи сполучки кеталю формули 4 у присутності придатного засобу для видалення захисної групи, такого як каталітичний йод або кислота в розчинниках, таких як ацетон. Як правило, цю реакцію здійснюють при 0-30 °C.

Сполуча формули 6 може бути одержана за допомогою альфа-галогенування карбонільної сполучки 5 із застосуванням придатного засобу для галогенування, такого як бром, N-бромускцинімід, N-хлорускцинімід тощо. Ця реакція, як правило, здійснюється в розчинниках, таких як дихлорметан при 0-30 °C.

Сполуча формули (I) може бути одержана за допомогою здійснення реакції альфа-галогенової сполучки формули 6 зі сполучкою формули $R^{10}-QH$ у присутності неорганічної основи, такої як карбонат калію, бікарбонат натрію в розчинниках, таких як ацетонітріл, диметилформамід, етанол тощо. Ця реакція може здійснюватися при 0-25 °C необов'язково у

присутності йодиду калію, йодиду натрію тощо.

Схема 2



де L^1 являє собою прямий зв'язок; А являє собою арил або піридил; L^2 являє собою прямий зв'язок; X являє собою Br, Cl або I, і W^1 являє собою O; R^1 , R^{2f} , R^{3f} , R^{10} і Q мають такі самі значення, як визначено в детальному описі вище.

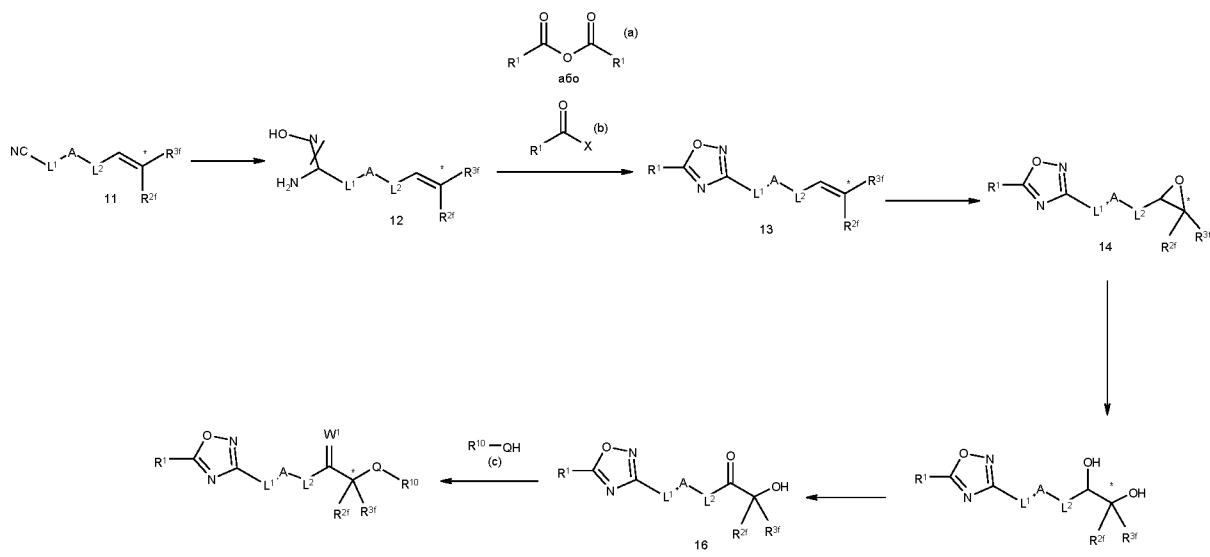
Сполука формулі 8 може бути одержана за допомогою здійснення реакції сполуки формулі 7 із оловоорганічною сполукою формулі е у присутності реагенту $\text{Pd}(\text{II})$, такого як біс(трифенілфосфін)паладій(ІІ)дихлорид. Ця реакція, як правило, здійснюється в розчинниках, таких як толуол, при температурі 50-80 °C.

Сполука формулі 9 може бути одержана за допомогою реакції нітрильної сполуки формулі 8 з гідроксиламіном у полярних протонних розчинниках, таких як етанол, метанол тощо. Альтернативно ця реакція може також бути здійснена з використанням гідроксиламіну гідрохлориду в присутності органічних та неорганічних основ, таких як триетиламін, діїзопропіламін, бікарбонат натрію тощо.

Сполука формулі 10 може бути одержана за допомогою здійснення реакції сполуки формулі 9 та ангідриду карбонової кислоти формулі а. Альтернативно сполука формулі 10 може також бути одержана за допомогою здійснення реакції із хлоридом карбонової кислоти формулі б. Такі реакції, як правило, проводять в апротонних розчинниках, таких як тетрагідрофуран, 1,4-діоксан, дихлорметан тощо. Необов'язково в присутності основ, таких як триетиламін, діїзопропіламін тощо при 0-50 °C.

Сполука формулі 6 може бути одержана за допомогою реакції сполуки формулі 10 с галогенувальним реагентом, таким як N-бромусукцинімід, у присутності води. Ця реакція, як правило, здійснюється в розчинниках, таких як тетрагідрофуран, при 0-25 °C.

Схема 3



15

де L^1 являє собою прямий зв'язок; А являє собою арил або піridил; L^2 являє собою прямий зв'язок; Х являє собою Br, Cl або I, і W^1 являє собою O; R^1 , R^{2f} , R^{3f} , R^{10} і Q мають такі самі значення, як визначено в детальному описі вище.

Сполучка формули 12 може бути одержана за допомогою реакції нітрильної сполучки формули 11 з гідроксиламіном у полярних протонних розчинниках, таких як етанол, метанол тощо. Альтернативно ця реакція може також бути здійснена з використанням гідроксиламіну гідрохлориду в присутності органічних та неорганічних основ, таких як триетиламін, діїзопропіламін, бікарбонат натрію тощо.

Сполучка формули 13 може бути одержана за допомогою здійснення реакції сполучки формули 12 та ангідриду карбонової кислоти формули а. Альтернативно сполучка формули 13 може також бути одержана за допомогою здійснення реакції із хлоридом карбонової кислоти формули b. Такі реакції, як правило, проводять в апротонних розчинниках, таких як тетрагідрофуран, 1,4-діоксан, дихлорметан тощо. Необов'язково в присутності основ, таких як триетиламін, діїзопропіламін тощо при 0-50 °C.

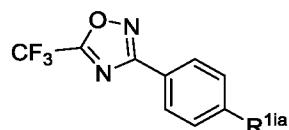
Сполучка формули 14 може бути одержана за допомогою реакції сполучки формули 13 із придатним окиснювальним засобом, таким як *t*-хлорпероксибензойна кислота. Ця реакція, як правило, здійснюється в розчинниках, таких як дихлорметан, при 0-30 °C.

Сполучку формули 15 може бути одержана за допомогою реакції сполучки формули 14 із придатним гідролізуvalьним засобом, таким як вода, у присутності нітрату церію амонію при 10-30 °C.

Сполучка формули 16 може бути одержана за допомогою реакції сполучки формули 15 із придатним окиснювальним засобом, таким як оксон, у присутності броміду натрію і води. Ця реакція, як правило, здійснюється в розчинниках, таких як ацетонітрил, при 0-25 °C.

Сполучка формули (I) може бути одержана за допомогою здійснення реакції сполучки формули 16 зі сполучкою формули $R^{10}-QH$ за допомогою умов реакції Міцунобу. Реакція, як правило, здійснюється у присутності трифенілфосфіну, діїзопропілу азодикарбоксилату або діетилазодикарбоксилату в розчинниках, таких як тетрагідрофуран, дихлорметан тощо.

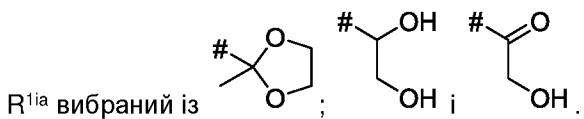
В одному варіанті здійснення даний винахід передбачає сполучку формули (B):



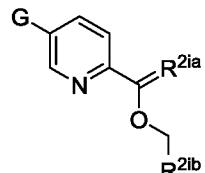
формула (B),

де

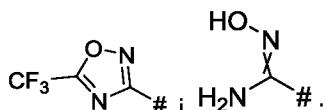
35



В іншому варіанті здійснення даний винахід передбачає сполуку формули (С):



формула (С),



де G вибраний із групи, що складається з

R^{2ia} вибраний із групи, що складається з CH_2 і O ;

R^{2ib} вибраний із групи, що складається з метилу і галогену.

В іншому варіанті здійснення даний винахід відноситься до композиції, яка містить сполуку формули (І), її прийнятні з погляду сільського господарства солі, комплекси з металами, конституційні ізомери, стереоізомери, діастереоізомери, енантіомери, хіральні ізомери, атропоізомери, конформери, ротамери, таутомери, оптичні ізомери, поліморфи, геометричні ізомери або N -оксиди, необов'язково з одним або більше додатковими активними інгредієнтами, з допоміжною речовиною, такою як інертний носій, або будь-яким іншим необхідним інгредієнтом, таким як поверхнево-активні речовини, добавки, тверді розріджувачі та рідкі розріджувачі.

Сполука формули (І) і композиція згідно з даним винаходом відповідно є придатними як фунгіциди. Вони відрізняються чудовою ефективністю проти широкого спектра фітопатогенних грибів, включаючи гриби, які поширяються через ґрунт, які походять, зокрема, із класів *Plasmodiophoromycetes*, *Peronosporomycetes* (син. *Oomycetes*), *Chytridiomycetes*, *Zygomycetes*, *Ascomycetes*, *Basidiomycetes* і *Deuteromycetes* (син. *Fungi imperfecti*). Деякі з них є системно ефективними, й їх можна застосовувати як фунгіциди в захисті сільськогосподарських культур щодо листя, фунгіциди для проправлювання насіння та фунгіциди щодо ґрунту. Більш того, вони є придатними для контролю шкідливих грибів, які серед іншого з'являються на деревині або коренях рослин.

Сполука формули I і композиція згідно з даним винаходом, зокрема, є важливими для здійснення контролю численних фітопатогенних грибів на різних культурних рослинах, таких як злакові культури, наприклад, пшениця, жито, ячмінь, тритикале, овес або рис; буряк, наприклад, цукровий буряк або кормовий буряк; плоди, такі як багатонасінні, кістянкові плоди або соковиті плоди, наприклад, види яблуні, груші, сливи, персика, мигдалю, вишні, суніці, малини, ожини або аґрусу; бобові рослини, такі як види сочевиці, гороху, люцерна або види сої; олійні рослини, такі як ріпак, гірчиця, види оливок, соняшника, кокос, какао-боби, рицина, олійні пальми, земляні горіхи або соя; гарбузові культури, такі як види кабачка, огірок або види дині; волокнисті рослини, такі як бавовник, льон, коноплі або джут; цитрусові плоди, такі як види апельсина, лимона, грейпфрута або мандарина; овочі, такі як шпинат, салат-латук, спаржа, види капусти, моркви, цибулі, томату, картоплі, гарбуза або паприка; лаврові рослини, такі як види авокадо, кориця або камфора; рослини для одержання енергії та сировинних матеріалів, такі як кукурудза, соя, ріпак, цукрова тростина або олійна пальма; кукурудза; тютюн; горіхи; кавове дерево; чайна рослина; види банана; виткі рослини (столові сорти винограду та виноградний сік із виноградної лози); хміль; дерніна; солодкий листок (також називаний стевією); рослини, що містять природний каучук, або декоративні та лісові рослини, такі як квіти, кущі, широколисті дерева або вічнозелені рослини, наприклад хвойні; і матеріал для розмноження рослин, такий як насіння, та сільськогосподарський матеріал таких рослин. Зокрема, сполука формули I та композиція за даним винаходом є важливими для здійснення контролю фітопатогенних грибів на видах сої і матеріалі для розмноження рослин, такому як насіння, та сільськогосподарському матеріалі, одержаному із видів сої. Відповідно, даний винахід також включає композицію, яка містить щонайменше одну сполуку формули I та насінину. Кількість сполуки формули I в композиції знаходитьться в діапазоні від 0,1 г а. і. (грам на активний інгредієнт) до 10 кг а.і.

(кілограм на активний інгредієнт) на 100 кг насіння.

Переважно, сполуку формули (I) та композицію на її основі відповідно застосовують для контролю багатьох грибів на польових культурах, таких як види картоплі, цукрових буряків, тютюн, пшениця, жито, ячмінь, овес, рис, кукурудза, бавовник, види сої, ріпак, бобові, види соняшника, кавове дерево або цукрова тростина; плодові рослини; виткі рослини; декоративні рослини або овочеві рослини, такі як види огірка, томатів, бобових або кабачків.

Термін "матеріал для розмноження рослин" слід розуміти як такий, що означає всі генеративні або репродуктивні частини рослини, такі як насіння, і вегетативний рослинний матеріал, такий як живці та коренеплоди (наприклад, бульби), які можна використовувати для розмноження рослини. Він включає насіння, корені, плоди, коренеплоди, цибулини, кореневища, пагони, паростки, гілки, квітки та інші частини рослин, включаючи сходи та молоді рослини, які підлягають пересадженню після проростання або після появи з ґрунту.

Такі молоді рослини також можна захищати перед пересадженням за допомогою повної або часткової обробки шляхом занурення або поливання.

Переважно, обробку матеріалів для розмноження рослин сполукою формули I, комбінацією та/або композицією на її основі відповідно застосовують для контролю багатьох грибів на злакових культурах, таких як пшениця, жито, ячмінь та овес; рис, кукурудза, бавовник і види сої.

Термін "вирощувані рослини" слід розуміти як такий, що включає рослини, які були модифіковані за допомогою селекції, мутагенезу або генетичної інженерії, включаючи без обмеження продукти сільськогосподарської біотехнології на ринку або в розробці (див. <http://cera-gmc.org/>, див. базу даних сільськогосподарських культур GM на сайті). Генетично модифіковані рослини являють собою рослини, генетичний матеріал яких був модифікований шляхом застосування методик рекомбінантної ДНК таким чином, що в природних умовах не можливо легко одержати за допомогою перехресного схрещування, мутацій або природної рекомбінації. Як правило, один або більше генів інтегруються в генетичний матеріал генетично модифікованої рослини з метою поліпшення певних властивостей рослини. Такі генетичні модифікації також включають без обмеження націлену посттрансляційну модифікацію білка(-ів), оліго- або поліпептидів, наприклад, шляхом гліказилювання або приєдань полімерів, таких як пренільовані, ацетильовані або фарнезильовані фрагменти або фрагменти PEG. Рослини, які були модифіковані за допомогою селекції, мутагенезу або генетичної інженерії, наприклад, їм була надана стійкість до нанесень конкретних класів гербіцидів, таких як ауксинові гербіциди, такі як дикамба або 2,4-D; знебарвлювальні гербіциди, такі як інгібтори гідроксилфенілпіруватдіоксигенази (HPPD) або інгібтори фітоенідесатурази (PDS); інгібтори ацетолактатсінтази (ALS), такі як сульфонілсечовини або імідазолінони; інгібтори енолпірувілшикімат-3-фосфатсінтази (EPSPS), такі як гліфосат; інгібтори глутамінсінтетази (GS), такі як гліофосинат; інгібтори протопорфіриноген-IX-оксидази; інгібтори біосинтезу ліпідів, такі як інгібтори ацетил-СоА-карбоксилази (ACCase); або оксинілові гербіциди (тобто бромоксиніл або іоксиніл) як результат загальноприйнятих способів селекції або генетичної інженерії. Крім того, рослинам була надана стійкість до багатьох класів гербіцидів внаслідок багатьох генетичних модифікацій, таких як стійкість як до гліфосату, так і до гліофосинату або як до гліфосату, так і до гербіциду з іншого класу, такого як інгібтори ALS, інгібтори HPPD, гербіциди ауксинового ряду або інгібтори ACCase. Ці технології стійкості до гербіцидів, наприклад, описані в Pest Managem. Sci. 61, 2005, 246; 61, 2005, 258; 61, 2005, 277; 61, 2005, 269; 61, 2005, 286; 64, 2008, 326; 64, 2008, 332; Weed Sci. 57, 2009, 108; Austral. J. Agricult. Res. 58, 2007, 708; Science 316, 2007, 1 185 і посиланнях, цитованих у них. Декільком вирощуваним рослинам була надана стійкість до гербіцидів за допомогою загальноприйнятих способів селекції (мутагенезу), наприклад, сурпіця Clearfield® (Canola, BASF SE, Німеччина) є стійкою до імідазолінонів, наприклад імазамоксу, або види соняшнику ExpressSun® (DuPont, США) є стійкими до сульфонілсечовин, наприклад трибенурону. Способи генетичної інженерії застосовувалися для надання культурним рослинам, таким як соя, бавовник, кукурудза, види буряку та ріпак, стійкості до гербіцидів, таких як гліфосат і гліофосинат, деякі з яких є комерційно доступними під торгововою назвою RoundupReady® (стійкий до гліфосату, Monsanto, США), Cultivance® (стійкий до імідазоліну, BASF SE, Німеччина) та LibertyLink® (стійкий до гліофосинату, Bayer CropScience, Німеччина).

Крім того, також охоплюються рослини, які в результаті застосування технології рекомбінантних ДНК здатні синтезувати один або більше з інсектицидних білків, особливо тих, які відомі з роду бактерій *Bacillus*, зокрема з *Bacillus thuringiensis*, таких як δ-ендотоксини, наприклад, CryIA(b), CryIA(c), CryIF, CryIF(a2), CryIIA(b), CryIIIa, CryIIIb(bl) або Cry9c; рослинних інсектицидних білків (VIP), наприклад, VIP1, VIP2, VIP3 або VIP3A; інсектицидних білків бактерій, які колонізують нематод, наприклад, *Photorhabdus* spp. або *Xenorhabdus* spp.;

токсинів, продукованих тваринами, таких як токсини скорпіона, токсини павукоподібних, токсини осі або інші нейротоксини, специфічні щодо комах; токсинів, продукованих грибами, таких як токсини Streptomycetes, рослинні лектини, такі як лектини гороху або ячменю; аглютинінів; інгібіторів протеїназ, таких як інгібітори трипсину, інгібітори серинової протеази, інгібітори пататину, цистатин або папаїн; білків, що інактивують рибосоми (RIP), таких як рицин, RIP маїсу, абрин, луфін, сапорин або бріодин; ферментів метаболізму стероїдів, таких як З-гідроксистероїдоксидаза, екдистероїд-ІДР-глікозил-трансфераза, холестериноксидаза, інгібітори екдизону або HMG-СоА-редуктаза; блокаторів іонних каналів, таких як блокатори натрієвих або кальцієвих каналів; естерази ювенільного гормону; рецепторів діуретичного гормону (гелікокінінові рецептори); стильбенсінтази, бібензилсінтази, хітинази або глуканази. У контексті даного винаходу такі інсектицидні білки або токсини слід явно розуміти також як претоксини, гіbridні білки, усічені або іншим чином модифіковані білки. Гіbridні білки характеризуються новою комбінацією білкових доменів (див., наприклад, WO02/015701). Додаткові приклади таких токсинів або генетично модифікованих рослин, здатних синтезувати такі токсини, розкриті, наприклад, у EP374753, WO93/007278, WO95/34656, EP427 529, EP451 878, WO03/18810 і WO03/52073. Способи одержання таких генетично модифікованих рослин загалом відомі фахівцеві у даній галузі техніки та описані, наприклад, у вищезгаданих публікаціях. Ці інсектицидні білки, що містяться в генетично модифікованих рослинах, надають рослинам, які продукують такі білки, стійкості до небезпечних шкідників з усіх таксономічних 20 груп членистоногих, особливо до жуків (Coeloptera), двокрилих комах (Diptera) і метеликів (Lepidoptera) та до нематод (Nematoda). Генетично модифіковані рослини, здатні синтезувати один або більше інсектицидних білків, наприклад, описані у вищезгаданих публікаціях, і деякі з них є комерційно доступними, такі як YieldGard® (сорти кукурудзи, які продукують токсин Cry1Ab), YieldGard® Plus (сорти кукурудзи, які продукують токсини Cry1Ab і Cry3Bb1), Starlink® (сорти 25 кукурудзи, які продукують токсин Cry9c), Herculex® RW (сорти кукурудзи, які продукують Cry34Ab1, Cry35Ab1 і фермент фосфінотрицин-N-ацетилтрансферазу [PAT]); NuCOTN® 33B (сорти бавовнику, які продукують токсин Cry1Ac), Bollgard® I (сорти бавовнику, які продукують токсин Cry1 Ac), Bollgard® II (сорти бавовнику, які продукують токсини Cry1Ac і Cry2Ab2); VIPCOT® (сорти бавовнику, які продукують VIP-токсин); NewLeaf® (сорти картоплі, які 30 продукують токсин Cry3A); Bt-Xtra®, NtuaireGard®, KnockOut®, BiteGard®, Protecta®, Bt1 1 (наприклад, Agrisure® CB) і Bt176 від Syngenta Seeds SAS, Франція (сорти кукурудзи, які продукують токсин Cry1Ab і фермент PAT), MIR604 від Syngenta Seeds SAS, Франція (сорти кукурудзи, які продукують модифіковану версію токсину Cry3A, див. WO 03/018810), MON 863 від Monsanto Europe S.A., Бельгія (сорти кукурудзи, які продукують токсин Cry3Bb1), IPC 531 від 35 Monsanto Europe S.A., Бельгія (сорти бавовнику, які продукують модифіковану версію токсину Cry1Ac) і 1507 від Pioneer Overseas Corporation, Бельгія (сорти кукурудзи, які продукують токсин Cry1 F і фермент PAT).

Крім того, також включені рослини, які в результаті застосування технології рекомбінантних ДНК здатні синтезувати один або більше білків для збільшення опірності або стійкості цих рослин до патогенів-бактерій, патогенів-вірусів або патогенів-грибів. Прикладами таких білків є так звані "білки, пов'язані з патогенезом" (PR-білки, див., наприклад, EP392225), гени стійкості до захворювань рослин (наприклад, сорти картоплі, які експресують гени стійкості, що діють проти Phytophthora infestans, одержані з мексиканського пасльону Solanum bulbocastanum) або T4-лізоцим (наприклад, сорти картоплі, здатні синтезувати такі білки з підвищеною стійкістю до бактерій, таких як Erwinia amylovora). Способи одержання таких генетично модифікованих рослин загалом відомі фахівцеві у даній галузі техніки та описані, наприклад, у вищезгаданих публікаціях.

Крім того, також охоплюються ті рослини, які в результаті застосування технології рекомбінантних ДНК здатні синтезувати один або більше білків для підвищення продуктивності (наприклад, одержання біомаси, урожайності зерна, вмісту крохмалю, вмісту жиру або вмісту білка), стійкості до посухи, засolenня або інших факторів навколошнього середовища, які обмежують ріст, або стійкості до шкідників і грибкових, бактеріальних або вірусних патогенів таких рослин.

Крім того, також охоплюються ті рослини, які в результаті застосування технології рекомбінантних ДНК містять змінену кількість речовин у складі або нові речовини у складі, зокрема для поліпшення харчування людини або тварини, наприклад олійні культури, які продукують корисні для здоров'я довголанцюгові омега-3 жирні кислоти або ненасичені омега-9 жирні кислоти (наприклад, ріпак Nexera®, DOW Agro Sciences, Канада).

Крім того, також охоплюються ті рослини, які в результаті застосування технології рекомбінантних ДНК містять змінену кількість речовин у складі або нові речовини у складі,

зокрема для поліпшення продукування сирого матеріалу, наприклад, сорти картоплі, які продукують підвищенні кількості амілопектину (наприклад, картопля Amflora® BASF SE, Німеччина).

Даний винахід також відноситься до способу контролю або попередження зараження рослин фітопатогенними мікроорганізмами щодо сільськогосподарських культур та/або садових культур, де ефективна кількість щонайменше однієї сполуки формули I, або комбінації за даним винаходом, або композиції за даним винаходом застосовується щодо насіння рослин. Сполуку, комбінацію та композицію за даним винаходом можна застосовувати для контролю або попередження захворювань рослин. Сполука формули I, комбінація та або композиція на її основі відповідно, зокрема, є придатними для контролю наступних захворювань рослин:

Albugo spp. (біла іржа) на декоративних рослинах, овочевих культурах (наприклад A. candida) та видах соняшнику (наприклад A. tragopogonis); Alternaria spp. (альтернаріоз) на овочевих культурах, ріпаку (A. brassicola або brassicae), видах цукрового буряка (A. tenuis), плодових культурах, рисі, видах сої, видах картоплі (наприклад, A. solani або A. alternata), видах томату (наприклад, A. solani або A. alternata) та пшениці; Aphanomyces spp. на видах цукрового буряка та овочевих культурах; Ascochyta spp. на злакових культурах та овочевих культурах, наприклад, A. tritici (антракноз) на пшениці та A. hordei на ячмені; Bipolaris і Drechslera spp. (телеоморфа: Cochliobolus spp.), наприклад, вічкова плямистість листя (D. maydis) або гельмінтоспоріоз (B. zeicola) на кукурудзі, наприклад, гельмінтоспоріозна гниль (C. sorokiniana) на злакових культурах і, наприклад, B. огузє на рисі та дерністих покривах; Blumeria (раніше Erysiphe) graminis (борошниста роса) на злакових культурах (наприклад, на пшениці або ячмені); Botrytis cinerea (телеоморфа: Botryotinia fuckeliana: сира пліснява) на плодових культурах та ягідних культурах (наприклад, видах суниці), овочевих культурах (наприклад, салаті-латуку, видах моркви, селері та видах капусти), ріпаку, квітах, витких рослинах, лісових рослинах та пшениці; Bremia lactucae (нестправжня борошниста роса) на салаті-латуку; Ceratocystis (син. Ophiostoma) spp. (гниль або в'янення) на широколистих деревах та вічнозелених рослинах, наприклад, C. ulmi (голландська хвороба в'яза) на в'язових; Cercospora spp. (церкоспорозна плямистість) на кукурудзі (наприклад, сіра плямистість листя: C. zea-maydis), рисі, видах цукрового буряка (наприклад, C. beticola), цукровій тростині, овочевих культурах, кавовому дереві, видах сої (наприклад, C. sojina або C. kikuchii) та рисі; Cladosporium spp. на видах томату (наприклад, C. fulvum: пліснява листків) і злакових культурах, наприклад, C. herbarum (чорна гниль) на пшениці; Claviceps purpurea (ріжки) на злакових культурах; Cochliobolus (анаморфа: Helminthosporium Bipolaris) spp. (плямистість листків) на кукурудзі (C. carbonum), злакових культурах (наприклад, C. sativus, анаморфа: B. sorokiniana) та рисі (наприклад, C. miyabeanus, анаморфа: H. oryzae); Colletotrichum (телеоморф: Glomerella) spp. (антракноз) на бавовнику (наприклад, C. gossypii), кукурудзі (наприклад, C. graminicola: антракнозна стеблова гниль), ягідних культурах, видах картоплі (наприклад, C. coccodes: точкова гниль), бобових культурах (наприклад, C. lindemuthianum) і видах сої (наприклад, C. truncatum або C. gloeosporioides); Corticum spp., наприклад, C. sasakii (захворювання епідермісу) на рисі; Corynespora cassiicola (плямистість листків) на видах сої та декоративних рослинах; Cycloconium spp., наприклад, C. oleaginum на оливкових деревах; Cylindrocarpon spp. (наприклад, рак плодових дерев або в'янення молодих витких рослин, телеоморфа: Nectria або Neonectria spp.) на плодових деревах, витких рослинах (наприклад, C. liriodendri, телеоморф: Neonectria liriodendri: захворювання чорна ніжка) та декоративних рослинах; Dematophora (телеоморф: Rosellinia) necatrix (коренева та стеблова гниль) на видах сої; Diaporthe spp., наприклад, D. phaseolorum (чорна ніжка) на видах сої; Drechslera (син. Helminthosporium, телеоморф: Pyrenophora) spp. на кукурудзі, злакових культурах, таких як ячмінь (наприклад, D. teres, сітчаста плямистість) і пшениця (наприклад, D. tritici-repentis: піrenoфороз), рисі та дерніні; Esca (відмирання верхівок, усихання) на витких рослинах, викликана Formitiporia (син. Phellinus) punctata, F. mediterranea, Phaeomoniella chlamydospora (раніше Phaeoacremonium chlamydosporum), Phaeoacremonium aleophilum та/або Botryosphaeria obtusa; Elsinoe spp. на багатонасінних плодових культурах (E. pyri), ягідних культурах (A. veneta: anthracnose) і витких рослинах (E. ampelina: anthracnose); Entyloma oryzae (сажка злаків) на рисі; Epicoccum spp. (чорна гниль) на пшениці; Erysiphe spp. (мучниста роса) видах цукрового буряка (E. betae), овочевих культурах (наприклад, E. pisii), таких як гарбузові (наприклад, E. cichoracearum), види капусти, ріпак (наприклад, E. cruciferarum); Eutypa lata (Eutypa canker або відмирання верхівок, анаморф: Cytosporina lata, син. Libertella blepharis) на фруктових деревах, витких рослинах і декоративних деревах; Exserohilum (син. Helminthosporium) spp. на кукурудзі (наприклад, E. turcicum); Fusarium (телеоморфа: Gibberella) spp. (в'янення, коренева або стеблова гниль) на різних рослинах, таких як F. graminearum або F. culmorum (коренева гниль, парша або фузаріоз)

на злакових культурах (наприклад, пшениці або ячмені), *F. oxysporum* на видах томату, *F. solani* (f. sp. *glycines*, зараз син. *F. virguliforme*), і *F. tucumaniae*, і *F. brasiliense*, кожний із яких викликає синдром несподіваної загибелі, на видах сої та *F. verticillioides* на кукурудзі; *Gaeumannomyces graminis* (випрівання) на злакових культурах (наприклад, пшениці або ячмені) та кукурудзі;

5 *Gibberella* spp. на злакових культурах (наприклад, *G. zea*) та рисі (наприклад, *G. fujikuroi*: гіберельоз рису); *Glomerella cingulata* на витких рослинах, багатонасінних культурах та інших рослинах і *G. gossypii* на бавовнику; комплекс забарвлення зерен на рисі; *Guignardia bidwellii* (чорна гниль) на витких рослинах; *Gymnosporangium* spp. на розоцвітих рослинах та ялівці, наприклад, *G. sabinae* (іржа) на видах груші; *Helminthosporium* spp. (син. *Drechslera*, телеоморф: *Cochliobolus*) на кукурудзі, злакових культурах і рисі; *Hemileia* spp., наприклад, *H. vastatrix* (іржа кавового листа) на кавовому дереві; *Isariopsis clavigpora* (син. *Cladosporium vitis*) на витких рослинах; *Macrophomina phaseolina* (син. *phaseoli*) (коренева та стеблова гниль) на видах сої та бавовнику; *Microdochium* (син. *Fusarium*) *nivale* (фузаріозна снігова пліснява) на злакових культурах (наприклад, пшениці або ячмені); *Microsphaera diffusa* (орошниста роса) на видах сої;

10 *Monilinia* spp., наприклад *M. laxa*, *M. fructicola* та *M. fructigena* (відмирання квіток і гілок, бура гниль) на кістянкових плодових культурах та інших розоцвітих рослинах; *Mycosphaerella* spp. на злакових культурах, бананових деревах, ягідних плодових культурах і видах земляного горіха, як наприклад, *M. graminicola* (анаморфа: *Septoria tritici*, *Septoria blotch*) на пшениці або *M. fijiensis* (захворювання чорна сигатока) на бананах; *Peronospora* spp. (мучниста роса) на капусті (наприклад, *P. brassicae*), ріпаку (наприклад, *P. parasitica*), видах цибулі (наприклад, *P. destructor*), тютюні (*P. tabacina*) та видах сої (наприклад, *P. manshurica*); *Phakopsora pachyrhizi* і *P. meibomiae* (іржа сої) на видах сої; *Phialophora* spp., наприклад, на витких рослинах (наприклад, *P. tracheiphila* і *P. tetraspora*) та видах сої (наприклад, *P. gregata*: стеблова гниль); *Phoma lingam* (коренева та стеблова гниль) на ріпаку та капусті і *P. beta* (коренева гниль, плямистість листків і чорна ніжка) на видах цукрового буряка; *Phomopsis* spp. на видах соняшнику, витких рослинах (наприклад, *P. viticola*: бляшана плямистість та плямистість листків) та видах сої (наприклад, стеблова гниль: *P. phaseoli*, телеоморф: *Diaporthe phaseolorum*); *Physoderma maydis* (бура плямистість) на кукурудзі; *Phytophthora* spp. (в'янення, коренева, листкова, плодова та стеблова гниль) на різних рослинах, таких як паприка та гарбузові (наприклад, *P. capsici*), види сої (наприклад, *P. megasperma*, син. *P. sojae*), видах сої, видах картоплі і томатів (наприклад, *P. infestans*: фітофтороз) і широколистих деревах (наприклад, *P. ramorum*: несподівана загиbelь дуба); *Plasmodiophora brassicae* (кіла) на капусті, ріпаку, редисі та інших рослинах; *Plasmopara* spp., наприклад, *P. viticola* (несправжня орошниста роса винограду) на витких рослинах і *P. halstedii* на видах соняшнику; *Podosphaera* spp. (орошниста роса) на розоцвітих рослинах, хмелі, багатонасінних та ягідних культурах, наприклад, *P. leucotricha* на видах яблуні; *Polymyxa* spp., наприклад, на злакових культурах, таких як ячмінь і пшениця (*P. graminis*), і видах цукрового буряка (*P. beta*) та вірусні захворювання, що передаються таким чином; *Pseudocercospora herpotrichoides* (вічкова плямистість, телеоморфа: *Tapesia yallundae*) на злакових культурах, наприклад, пшениці або ячмені; *Pseudoperonospora* (несправжня орошниста роса) на різних рослинах, наприклад, *P. cubensis* на гарбузових або *P. humili* на хмелі; *Pseudopezicula tracheiphila* (краснуха або "rotbrenner", анаморфа: *Phialophora*) на витких рослинах; *Puccinia* spp. (Види іржі) на різних рослинах, наприклад, *P. triticina* (бура або листкова іржа), *P. striiformis* (лінійна або жовта іржа), *P. hordei* (карликова іржа), *P. graminis* (стеблова або чорна іржа) або *P. recondita* (бура або листкова іржа) на злакових культурах, таких як, наприклад, пшениця, ячмінь або жито, *P. kuehnii* (оранжева іржа) на цукровій тростині та *P. asparagi* на спаржі; *Rugenophora* (анаморфа: *Drechslera* *tritici-repentis* (піrenoфороз) на пшениці або *P. teres* (сітчаста плямистість) на ячмені; *Pyricularia* spp., наприклад, *P. oryzae* (телеоморфа: *Magnaporthe grisea*, пікуляріоз рису) на рисі та *P. grisea* на дернині та злакових культурах; *Pythium* spp. (чорна ніжка) на дернині, рисі, кукурудзі, пшениці, бавовнику, ріпаку, видах соняшнику, сої, видах цукрового буряка, овочевих культурах і різних інших рослинах (наприклад, *P. ultimum* або *P. arphanidermatum*); *Ramularia* spp., наприклад *R. collo-cygne* (рамуляріоз, фізіологічна плямистість листків) на ячмені та *R. beticola* на видах цукрового буряка; *Rhizoctonia* spp. на бавовнику, рисі, видах картоплі, дернині, кукурудзі, ріпаку, видах картоплі, видах цукрового буряка, овочевих культурах і різних інших рослинах, наприклад, *R. solani* (коренева та стеблова гниль) на видах сої, *R. solani* (захворювання епідермісу) на рисі або *R. cerealis* (ризоктоніоз) на пшениці або ячмені; *Rhizophus stolonifer* (чорна пліснява, м'яка гниль) на видах сунціці, моркви, капусті, витких рослинах та видах томату; *Rhynchosporium secalis* (рінхоспоріоз) на ячмені, житі і тритикале; *Sarocladium oryzae* та *S. attenuatum* (гниль епідермісу) на рисі; *Sclerotinia* spp. (стеблова гниль або біла пліснява) на овочевих культурах і польових культурах, таких як ріпак, види соняшнику

(наприклад, *S. sclerotiorum*) і видах сої (наприклад, *S. rolfsii* або *S. sclerotiorum*); *Septoria* spp. на різних рослинах, наприклад *S. glycines* (бура плямистість) на сої, *S. tritici* (септоріозна плямистість листків) на пшениці та *S.* (син. *Stagonospora*) *nodorum* (стагноспороз) на злакових культурах; *Uncinula* (син. *Erysiphe*) *necator* (борошниста роса, анаморфа: *Oidium tuckeri*) на витких рослинах; *Setosphaeria* spp. (ураження листків) на кукурудзі (наприклад, *S. turicum*, син. *Helminthosporium turicum*) і дерніні; *Sphacelotheca* spp. (сажка) на кукурудзі (наприклад, *S. reiliana*: курна сажка), сорго та цукровій тростині; *Sphaerotheca fuliginea* (борошниста роса) на гарбузових; *Spongospora subterranea* (борошниста парша) на видах картоплі та вірусні захворювання, що передаються таким чином; *Stagonospora* spp. на злакових культурах, наприклад *S. nodorum* (стагноспороз, телеоморфа: *Leptosphaeria* [син. *Phaeosphaeria*] *nodorum*) на пшениці; *Synchytrium endobioticum* на видах картоплі (рак картоплі); *Taphrina* spp., наприклад, *T. deformans* (кучерявість листків) на видах персика та *T. pruni* ("кишеньок" сливи) на видах сливи; *Thielaviopsis* spp. (чорна коренева гниль) на тютюні, багатонасінних культурах, овочевих культурах, видах сої та бавовнику, наприклад, *T. basicola* (син. *Chalara elegans*); *Tilletia* spp. (тверда сажка або смердюча сажка) на злакових культурах, таких як, наприклад, *T. tritici* (син. *T. caries*, тверда сажка пшениці) та *T. controversa* (карпикова сажка) на пшениці; *Typhula incarnata* (сіра снігова пліснява) на ячмені або пшениці; *Urocystis* spp., наприклад, *U. occulta* (стеблова сажка) на житі; *Uromyces* spp. (іржа) на овочевих культурах, таких як бобові (наприклад, *U. appendiculatus*, син. *U. phaseoli*) та видах цукрового буряка (наприклад, *U. betae*); *Ustilago* spp. (летюча сажка) на злакових культурах (наприклад, *U. nuda* та *U. avaenae*), кукурудзі (наприклад, *U. maydis*: сажка кукурудзи) та цукровій тростині; *Venturia* spp. (парша) на видах яблуні (наприклад, *V. inaequalis*) і видах груші та *Verticillium* spp. (в'янення) на різних рослинах, таких як плодові культури та декоративні рослини, виткі рослині, ягідні культури, овочеві культури та польові культури, наприклад, *V. dahliae* на видах сунниць, ріпаку, видах картоплі і томату.

Сполучу формулу I, комбінацію або композицію на її основі можна застосовувати для лікування декількох захворювань, спричинених грибковими патогенами. Необмежувальні приклади патогенів, які зумовлюють розвиток грибкових хвороб, які можуть бути вилікувані згідно з даним винаходом, включають:

30 *Ustilaginales*, такі як *Ustilaginoidea virens*, *Ustilago nuda*, *Ustilago tritici*, *Ustilago zea*, види іржі, наприклад, ті, що спричинені *Pucciniales*, такими як *Cerotellium fici*, *Chrysomyxa arctostaphyli*, *Coleosporium ipomoeae*, *Hemileia vastatrix*, *Puccinia arachidis*, *Puccinia caccabata*, *Puccinia graminis*, *Puccinia recondita*, *Puccinia sorghi*, *Puccinia hordei*, *Puccinia striiformis* f.sp. *Hordei*, *Puccinia striiformis* f.sp. *Secalis*, *Pucciniastrum coryli* або *Uredinales*, такі як *Cronartium ribicola*, *Gymnosporangium juniperi-virginianae*, *Melampsora medusae*, *Phakopsora pachyrhizi*, *Phragmidium mucronatum*, *Physopella ampelosidis*, *Tranzschelia discolor* і *Uromyces viciae-fabae*; та інші види гнилі і захворювання, такі як ті, що спричинені *Cryptococcus* spp., *Exobasidium vexans*, *Marasmieillus inoderma*, *Mycena* spp., *Sphacelotheca reiliana*, *Typhula ishikariensis*, *Urocystis agropyri*, *Itersonilia perplexans*, *Corticium invisum*, *Laetisaria fuciformis*, *Waitea circinata*, *Rhizoctonia solani*, *Thanetephorus cucumeris*, *Entyloma dahliae*, *Entylomella microspora*, *Neovossia moliniae* і *Tilletia caries*. *Blastocladiomycetes*, такі як *Physoderma maydis*. *Mucoromycetes*, такі як *Choanephora cucurbitarum*; *Mucor* spp. і *Rhizopus arrhizus*.

В іншому варіанті здійснення захворювання, спричинені патогенами, які зумовлюють іржасті захворювання, наприклад, видами *Gymnosporangium*, наприклад, *Gymnosporangium sabinae*; видами *Hemileia*, наприклад *Hemileia vastatrix*; видами *Phakopsora*, наприклад, *Phakopsora pachyrhizi* або *Phakopsora meibomiae*; видами *Puccinia*, наприклад, *Puccinia recondita*, *Puccinia graminis* або *Puccinia striiformis*; видами *Uromyces*, наприклад *Uromyces appendiculatus*;

50 зокрема *Cronartium ribicola* (пухирчаста іржа); *Gymnosporangium juniperi-virginianae* (іржа яблуні і кедра); *Hemileia vastatrix* (кавова іржа); *Phakopsora meibomiae* та *P. pachyrhizi* (іржа сої); *Puccinia coronata* (корончаста іржа вівса та райграсу); *Puccinia graminis* (стеблова іржа пшениці) та тонконогу лучного або чорна іржа злакових культур); *Puccinia hemerocallidis* (іржа лілійника); *Puccinia persistens* subsp. *triticina* (іржа пшениці або "бура або червона іржа"); *Puccinia sorghi* (іржа кукурудзи); *Puccinia striiformis* ("жовта іржа" злакових культур); *Puccinia melanocephala*; *Uromyces appendiculatus* (іржа бобових); *Uromyces phaseoli* (іржа бобових); *Puccinia melanocephala* ("бура іржа" цукрової тростини); *Puccinia kuehnii* ("помаранчева іржа" цукрової тростини);

55 Рослини, які можна обробляти згідно з даним винаходом, включають наступні: бавовник, льон, виноград, плодові культури, овочеві культури, такі як *Rosaceae* sp (наприклад, багатонасінні культури, такі як види яблуні, груші, абрикосу, вишні, мигдалю та персиків), *Ribesioideae* sp., *Juglandaceae* sp., *Betulaceae* sp., *Anacardiaceae* sp., *Fagaceae* sp., *Moraceae* sp., *Oleaceae* sp., *Actinidiaceae* sp., *Lauraceae* sp., *Musaceae* sp. (наприклад, бананові дерева та

плантації), Rubiaceae sp. (наприклад, кавове дерево), Theaceae sp., Sterculiceae sp., Rutaceae sp. (наприклад, види лимона, апельсина та грейпфрута); Vitaceae sp. (наприклад, види винограду); Solanaceae sp. (наприклад, види томату, перцю), Liliaceae sp., Asteraceae sp. (наприклад, салат-латук), Umbelliferae sp., Cruciferae sp., Chenopodiaceae sp., Cucurbitaceae sp. (наприклад, огірок), Alliaceae sp. (наприклад, цибуля-порій, цибуля), Papilionaceae sp. (наприклад, види гороху); основні сільськогосподарські рослини, такі як Poaceae/Gramineae sp. (наприклад, майс, дернина, злакові культури, такі як пшениця, жито, рис, ячмінь, овес, просо і тритикале), Asteraceae sp. (наприклад, соняшник), Brassicaceae sp. (наприклад, капуста білоголова, капуста червоноголова, броколі, цвітна капуста, брюссельська капуста, пекінська капуста, кольрабі, види редису та олійний ріпак, гірчиця, хрін і крес-салат), Fabaceae sp. (наприклад, бобові, види арахісу), Papilionaceae sp. (наприклад, соя), Solanaceae sp. (наприклад, види картоплі), Chenopodiaceae sp. (наприклад, цукровий буряк, кормовий буряк, листовий буряк, червоний буряк); Malvaceae (наприклад, бавовник); корисні рослини та декоративні рослини для садів та лісистих ділянок і генетично модифіковані різновиди кожної з цих рослин.

Більшу перевагу надають контролю наступних захворювань сої. Грибкових захворювань на листках, стеблах, стручках і насінні, спричинених, наприклад, плямистістю листків, викликаною *Altemaria* (*Altemaria spec. atrans tenuissima*), антракнозом (*Colletotrichum gloeosporoides dematum* var. *truncatum*), бурою плямистістю (*Septoria glycines*), плямистістю листків та в'яненням, викликаним *Cercospora* (*Cercospora kikuchii*), в'яненням листків, викликаною *Choanephora* (*Choanephora infundibulifera trispore* (Syn.)), плямистістю листків, викликаною *Dactuliphora* (*Dactuliphora glycines*), несправжньою борошнистою росою (*Peronospora manshurica*), в'яненням, викликаним *Drechslera* (*Drechslera glycini*), селеноморфозною плямистістю листків (*Cercospora sojina*), плямистістю листків, викликаною *Leptosphaerulina* (*Leptosphaerulina trifolii*), плямистістю листків, викликаною *Phyllosticta* (*Phyllosticta sojaecola*), в'яненням стручків і стебел (*Phomopsis sojae*), борошнистою росою (*Microsphaera diffusa*), плямистістю листків, викликаною *Pyrenopeziza* (*Pyrenopeziza glycines*), в'яненням надземної частини, листків і диску, викликаних *Rhizoctonia* (*Rhizoctonia solani*), іржею (*Phakopsora pachyrhizi*, *Phakopsora meibomiae*), паршею (*Sphaceloma glycines*), в'яненням листків, викликаним *Stemphylium* (*Stemphylium botryosum*), мішенеподібною плямистістю (*Corynespora cassiicola*).

Грибкові хвороби на коренях і основі стебла, спричинені, наприклад, чорною кореневою гниллю (*Calonectria crotalariae*), вугільною гниллю (*Macrophomina phaseolina*), фузаріозною гниллю або в'яненням, кореневою гниллю та гниллю стручків і гілок (*Fusarium oxysporum*, *Fusarium orthoceras*, *Fusarium semitectum*, *Fusarium equiseti*), кореневою гниллю, спричиненою *Mycoleptodiscus* (*Mycoleptodiscus terrestris*), *Neocosmospora* (*Neocosmospora vasinfecta*), гниллю бобів і стебел (*Diaporthe phaseolorum*), раком стебла (*Diaporthe phaseolorum* var. *caulivora*), фітофторозною гниллю (*Phytophthora megasperma*), бурою гниллю стебла (*Phialophora gregata*), грибною гниллю (*Pythium aphanidermatum*, *Pythium irregularare*, *Pythium debaryanum*, *Pythium myriotylum*, *Pythium ultimum*), ризоктоніозною кореневою гниллю, гниттям стебла і чорною ніжкою (*Rhizoctonia solani*), гниттям стебла, спричиненим *Sclerotinia* (*Sclerotinia sclerotiorum*), південною гниллю, спричиненою *Sclerotinia* (*Sclerotinia rolfsii*), кореневою гниллю, спричиненою *Thielaviopsis* (*Thielaviopsis basicola*).

Даний винахід також відноситься до застосування сполуки формули I, комбінації або композиції на її основі для контролю або попередження наступних захворювань рослин: *Puccinia* spp. (види іржі) на різних рослинах, наприклад, без обмеження *P. triticina* (бура або листкова іржа), *P. striiformis* (лінійна або жовта іржа), *P. hordei* (карликова іржа), *P. graminis* (стеблова або чорна іржа) або *P. recondita* (бура або листкова іржа) на злакових культурах, таких як, наприклад, пшениця, ячмінь або жито, та *Phakopsoraceae* spp. на різних рослинах, зокрема *Phakopsora pachyrhizi* та *P. meibomiae* (іржа сої) на видах сої, *Hemileia vastatrix* (іржа кавового дерева), *Uromyces appendiculatus*, *Uromyces fabae* та *Uromyces phaseoli* (іржа бобових).

Даний винахід додатково відноситься до застосування сполуки формули I, комбінації або композиції на її основі для контролю або попередження проти фітопатогенних грибів, таких як *Phakopsora pachyrhizi*, *Phakopsora meibomiae*, сільськогосподарських культур та/або садових культур.

Сполука формули (I), комбінація та композиція на її основі відповідно є також придатними для контролю шкідливих грибів у захисті продуктів або врожаю, які зберігаються, та в захисті матеріалів. Термін "захист матеріалів" слід розуміти як такий, що означає захист технічних і неживих матеріалів, таких як клейкі матеріали, клеї, деревина, папір і картон, текстиль, шкіра,

фарбувальні дисперсії, пластмаси, фарбувальні мастильно-охолоджувальні речовини, волокна або тканини, від зараження та знищення шкідливими мікроорганізмами, такими як гриби і бактерії.

Щодо захисту дерева та інших матеріалів, особлива увага приділяється наступним шкідливим грибам: Ascomycetes, таким як *Ophiostoma spp.*, *Ceratocystis spp.*, *Aureobasidium pullulans*, *Sclerotinia spp.*, *Chaetomium spp.*, *Humicola spp.*, *Petriella spp.*, *Trichurus spp.*; Basidiomycetes, таким як *Coniophora spp.*, *Coriolus spp.*, *Gloeophyllum spp.*, *Lentinus spp.*, *Pleurotus spp.*, *Por/a spp.*, *Serpula spp.* і *Tyromyces spp.*, Deuteromycetes, таким як *Aspergillus spp.*, *Cladosporium spp.*, *Penicillium spp.*, *Trichoderma spp.*, *Alternaria spp.*, *Paecilomyces spp.* і *Zygomycetes*, таким як *Mucor spp.*, і додатково щодо захисту продуктів та врожаю, що зберігаються, варто зазначити наступні дріжджові гриби: *Candida spp.* і *Saccharomyces cerevisiae*.

В одному варіанті здійснення сполука формули (I), комбінація та композиція на її основі відповідно є, зокрема, придатними для здійснення контролю наступних захворювань рослин: *Phakopsora pachyrhizi* і *P. meibomiae* (іржа сої) на видах сої.

Даний винахід додатковий стосується способу контролю фітопатогенних грибів або попередження ураження ними. Способ включає обробку грибів або матеріалів, рослин, частин рослин, місця їх зростання, ґрунту або насіння, що мають бути захищені щодо ураження грибами, ефективною кількістю щонайменше однієї сполуки формули I, або комбінації, або композиції, які містять щонайменше одну сполуку формули I.

Способ обробки згідно з даним винаходом також можна застосовувати в галузі захисту продуктів або врожаю, що зберігаються, від ураження грибами та мікроорганізмами. Згідно з даним винаходом термін "продукти, що зберігаються" слід розуміти як такий, що означає природні речовини рослинного або тваринного походження та їхні перероблені форми, які були вилучені з природного життєвого циклу і для яких потрібний довготривалий захист. Продукти, що зберігаються, які походять від сільськогосподарських рослин, такі як рослини або їхні частини, наприклад, стебла, листки, коренеплоди, насіння, плоди або зерна, можна захищати в свіжозібраному стані або в переробленій формі, такий як попередньо висушена, зволожена, подрібнена, мелена, пресована або жарена, такий спосіб також відомий як післязбиральна обробка. Також під визначення продукти, що зберігаються, підпадають деревина, або у формі необробленої деревини, такої як будівельна деревина, електричні опори та бар'єри, або у формі готових виробів, таких як меблі або предмети, виготовлені з дерева. Продукти, що зберігаються, тваринного походження являють собою шкіряні сировини, шкіри, хутра, вовну тощо. Комбінація згідно з даним винаходом може запобігати несприятливим ефектам, таким як гниття, знебарвлення або утворення плісняви. Переважно термін "продукти, що зберігаються" розуміється як такий, що позначає природні речовини рослинного походження та їхні перероблені форми, більш переважно плоди та їхні перероблені форми, такі як яблука, кісточкові плоди, ягоди і цитрусові плоди та їхні перероблені форми.

Сполука формули (I), комбінація та композиція на її основі відповідно можуть застосовуватися для поліпшення життєздатності рослини. Даний винахід також відноситься до способу поліпшення життєздатності рослини за допомогою обробки рослини, матеріалу для її розмноження та/або місця, де рослина зростає або повинна зростати, ефективною кількістю сполуки I та композиції на її основі відповідно.

Термін "життєздатність рослини" слід розуміти як такий, що означає стан рослини та/або продуктів на її основі, який визначений декількома показниками окремо або в комбінації один з одним, такими як урожайність (наприклад, підвищена біомаса та/або підвищений вміст цінних інградієнтів), сила рослини (наприклад, поліпшений ріст рослини та/або більш зелені листки ("ефект озеленення")), якість (наприклад, поліпшений вміст або композиція певних інградієнтів) і стійкість до абіотичного та/або біотичного стресу. Вказані вище показники стану життєздатності рослини можуть бути незалежними один від одного або можуть виникати один з одного.

Сполука формули (I) може знаходитись у формі різних кристалічних модифікацій або поліморфів, біологічна активність яких може відрізнятися. Вони також є об'єктом даного винаходу.

Сполуку формули I застосовують як таку або у формі композиції для обробки грибів або рослин, матеріалу для розмноження рослин, такого як насіння, ґрунту, поверхонь, матеріалів або приміщень, які потребують захисту від ураження грибами, фунгіцидно ефективною кількістю активних інградієнтів. Нанесення можна здійснювати як до, так і після зараження рослин, матеріалів для розмноження рослин, таких як насіння, ґрунту, поверхонь, матеріалів або приміщень грибами.

Матеріали для розмноження рослин можна обробляти сполукою формули I, комбінацією та

композицією на її основі з метою захисту або під час, або до висаджування або пересаджування.

Даний винахід також відноситься до агрохімічної композиції, що містить допоміжну речовину і щонайменше одну сполуку формули I.

Агрохімічна композиція містить фунгіцидно ефективну кількість сполуки формули (I). Термін "ефективна кількість" позначає кількість композиції або сполуки формули (I), яка є достатньою для контролю шкідливих грибів на вирощуваних рослинах або для захисту матеріалів і яка не спричиняє суттєвої шкоди оброблюваним рослинам. Така кількість може варіюватися у широкому діапазоні і залежить від різних факторів, таких як вид гриба, який підлягає контролю, оброблювана культурна рослина або матеріал, кліматичні умови та конкретна застосувана сполука формули I.

Сполуку формули (I), її оксиди, комплекси з металами, ізомери, поліморфи або прийнятні з погляду сільського господарства солі можна перетворювати у звичайні типи агрохімічних композицій, наприклад розчини, емульсії, суспензії, пилоподібні форми, порошки, пасти, 15 гранули, пресовані форми, капсули та їх суміші. Прикладами типів композицій є суспензії (наприклад, SC, OD, FS), здатні до емульгування концентрати (наприклад, EC), емульсії (наприклад, EW, EO, ES, ME), капсули (наприклад, CS, ZC), пасти, пастилки, змочувані порошки або пилоподібні форми (наприклад, WP, SP, WS, DP, DS), пресовані форми (наприклад, BR, TB, 20 DT), гранули (наприклад, WG, SG, GR, FG, GG, MG), інсектицидні вироби (наприклад, LN), а також гелеподібні склади для обробки матеріалів для розмноження рослин, таких як насіння (наприклад, GF). Такі і додаткові типи композицій визначені в "Catalogue of pesticide Formulation types and international coding system", Technical Monograph No. 2, 6th Ed. May 2008, CropLife International.

Композиції одержують відомим способом, таким як описаний у Mollet and Grubemann, 25 Formulation technology, Wiley VCH, Weinheim, 2001; або Knowles, New developments in crop protection product Formulation, Agrow Reports DS243, T&F Informa, London, 2005.

Придатні допоміжні речовини являють собою розчинники, рідкі носії, тверді носії або наповнювачі, поверхнево-активні речовини, диспергувальні речовини, емульгатори, змочувальні речовини, допоміжні засоби, солюбілізатори, засоби, що посилюють проникання, 30 захисні колоїди, адгезійні засоби, загусники, зволожувальні засоби, відлякувальні речовини, приваблювальні речовини, стимулятори поїдання, засоби, що забезпечують сумісність, бактерицидні речовини, засоби, що запобігають заморожуванню, засоби, що запобігають спінюванню, забарвлювальні речовини, речовини, що підвищують клейкість, і зв'язувальні 35 речовини.

Придатні розчинники та рідкі носії являють собою воду та органічні розчинники, такі як фракції мінерального масла від середньої до високої точки кипіння, наприклад, гас, дизельна оліва; олії рослинного або тваринного походження; аліфатичні, циклічні та ароматичні вуглеводні, наприклад, толуол, парафін, тетрагідронафталін, алкіловані нафталіни; спирти, наприклад, етанол, пропанол, бутанол, бензиловий спирт, циклогексанол; гліколі; DMSO; 40 кетони, наприклад циклогексанон; естери, наприклад, лактати, карбонати, естери жирних кислот, гамма-бутиролактон; жирні кислоти; фосфонати; аміни; аміди, наприклад, N-метилпіролідон, диметиламіди жирних кислот; та їх суміші. Придатні тверді носії або наповнювачі являють собою неорганічні речовини, наприклад, силікати, силікагелі, тальк, 45 каоліни, вапняк, вапно, крейду, глини, доломіт, діатомову землю, бентоніт, сульфат кальцію, сульфат магнію, оксид магнію; полісахариди, наприклад, целюлозу, крохмаль; добрева, наприклад, сульфат амонію, фосфат амонію, нітрат амонію, сечовини; продукти рослинного походження, наприклад, борошно зі злакових культур, борошно з кори дерев, борошно з деревини, борошно з горіхової шкаралупи та їх суміші.

Придатні поверхнево-активні речовини являють собою поверхнево-активні сполуки, такі як 50 аніонні, катіоннні, нейонні та амфотерні поверхнево-активні речовини, блок-співполімери, поліелектроліти та їх суміші. Такі поверхнево-активні речовини можна застосовувати як емульгатор, диспергувальну речовину, солюбілізатор, змочувальну речовину, засіб, що посилює проникання, захисний колоїд або допоміжний засіб. Приклади поверхнево-активних речовин перелічені в McCutcheon's, Vol.1: Emulsifiers & Detergents, McCutcheon's Directories, 55 Glen Rock, USA, 2008 (International Ed. or North American Ed.).

Придатні аніонні поверхнево-активні речовини являють собою солі лужних, лужноземельних металів або амонію сульфонатів, сульфатів, фосфатів, карбоксилатів та їх суміші. Приклади 60 сульфонатів являють собою алкіларилсульфонати, дифенілсульфонати, альфа-олефінсульфонати, лігнінсульфонати, сульфонати жирних кислот і масел, сульфонати етоксилованих алкілфенолів, сульфонати алкоксилованих арилфенолів, сульфонати

конденсованих нафталінів, сульфонати додецил- і тридецилбензолів, сульфонати нафталінів та алкілнафталінів, сульфосукцинати або сульфосукцинати. Прикладами сульфатів є сульфати жирних кислот і масел, етоксилованих алкілфенолів, спиртів, етоксильованих спиртів або естерів жирних кислот. Прикладами фосфатів є фосфатні естери. Прикладами карбоксилатів є алкілкарбоксилати та карбоксильної спирти або алкілфенолетоксилати.

Придатні нейонні поверхнево-активні речовини являють собою алкооксилати, N-заміщенні аміди жирних кислот, оксида амінів, естери, поверхнево-активні речовини на основі цукрів, полімерні поверхнево-активні речовини та їх суміші. Прикладами алкооксилатів є сполуки, такі як спирти, алкілфеноли, аміни, аміди, арилфеноли, жирні кислоти або естери жирних кислот, які були алкооксильної 1-50 еквівалентами. Для алкооксилування можна використовувати оксид етилену та/або оксид пропілену, переважно оксид етилену.

Прикладами N-заміщених амідів жирних кислот є глукаміди жирних кислот або алканоламіди жирних кислот. Прикладами естерів є естери жирних кислот, естери гліцерину або моногліцериди. Прикладами поверхнево-активних речовин на основі цукрів є сорбітани, етоксильної сорбітани, естери сахарози та глукози або алкілполіглюкозиди. Прикладами полімерних поверхнево-активних речовин є гомо- або співполімери вінілпіролідону, вінілові спирти або вінілацетат.

Придатні катіонні поверхнево-активні речовини являють собою четвертинні поверхнево-активні речовини, наприклад, сполуки четвертинного амонію з однією або двома гідрофобними групами, або солі довголанцюгових первинних амінів. Пригадані амфотерні поверхнево-активні речовини являють собою алкілбетаїни та імідазоліни. Пригадані блок-полімери являють собою блок-співполімери типу А-В або А-В-А, які містять блоки, що складаються з оксиду поліетилену та оксиду поліпропілену, або типу А-В-С, які містять алканол, оксид поліетилену та оксид поліпропілену. Пригадані поліелектроліти являють собою полікислоти або поліօօнови. Прикладами полікислот є солі лужних металів і поліакрилової кислоти або гребенеподібні співполімери полікислоти. Прикладами поліօօнов є полівініламіни або поліетиленаміни.

Придатні допоміжні засоби являють собою сполуки, які самі по собі характеризуються незначною або навіть відсутньою пестицидною активністю та які покращують біологічну ефективність сполуки формули (I) щодо мішені. Прикладами є поверхнево-активні речовини, мінеральні або рослинні олії та інші допоміжні речовини. Додаткові приклади перелічені в Knowles, Adjuvants and additives, Agrow Reports DS256, T&F Informa UK, 2006, chapter 5.

Придатні загусники являють собою полісаходи (наприклад, ксантанову камедь, карбоксиметилцелюлозу), неорганічні глини (органічно модифіковані або немодифіковані), полікарбоксилати та силікати.

Придатні бактерицидні речовини являють собою похідні бронополу та ізотіазоліну, такі як алкілізотіазоліони та бензізотіазоліони.

Придатні засоби, що запобігають заморожуванню, являють собою етиленгліколь, пропіленгліколь, сечовину та гліцерин.

Придатні засоби, що запобігають спінюванню, являють собою силікони, довголанцюгові спирти та солі жирних кислот.

Придатні забарвлювальні речовини (наприклад, у червоний, синій або зелений колір) являють собою пігменти з низькою розчинністю у воді та водорозчинні барвники. Прикладами є неорганічні забарвлювальні речовини (наприклад, оксид заліза, оксид титану, гексаціаноферат заліза) та органічні забарвлювальні речовини (наприклад, забарвлювальні речовини на основі алізарин-, азо- та фталоціаніну).

Придатні речовини, що підвищують клейкість, або зв'язувальні речовини являють собою полівінілпіролідони, полівінілацетати, полівінілові спирти, поліакрилати, біологічні або синтетичні воски та етери целюлози.

Прикладами типів композицій та їх одержання є наступні.

i) Водорозчинні концентрати (SL, LS)

Розчиняють 10-60 ваг. % сполуки формули (I) та 5-15 ваг. % змочувального засобу (наприклад, алкооксилатів спирту) у воді та/або у водорозчинному розчиннику (наприклад, спиртах) до 100 ваг. %. Активна речовина розчиняється під час розбавлення водою.

ii) Диспергувальні концентрати (DC)

Розчиняють 5-25 ваг. % сполуки формули (I) та 1-10 ваг. % диспергувальної речовини (наприклад, полівінілпіролідону) в органічному розчиннику (наприклад, циклогексаноні) до 100 ваг. %. За допомогою розбавлення водою одержують дисперсію.

iii) Емульгувальні концентрати (EC)

Розчиняють 15-70 ваг. % сполуки формули (I) та 5-10 ваг. % емульгаторів (наприклад, додецилбензольсульфонату кальцію та етоксилату рицинової олії) в нерозчинному у воді

органічному розчиннику (наприклад, ароматичному вуглеводні) до 100 ваг. %. За допомогою розбавлення водою одержують емульсію.

iv) Емульсії (EW, EO, ES)

Розчиняють 5-40 ваг. % сполуки формули (I) та 1-10 ваг. % емульгаторів (наприклад, додецилбензопульфонату кальцію та етоксилату рицинової олії) у 20-40 ваг. % нерозчинного у воді органічного розчинника (наприклад, ароматичного вуглеводню). Цю суміш вносять у воду до 100 ваг. % за допомогою приладу для емульгування і перетворюють на гомогенну емульсію. За допомогою розбавлення водою одержують емульсію.

v) Сусpenзії (SC, OD, FS)

У перемішуваному кульовому млині тонко подрібнюють 20-60 ваг. % сполуки формули I із додаванням 2-10 ваг. % диспергувальних речовин та змочувальних засобів (наприклад, лігносульфонату натрію та етоксилату спирту), 0,1-2 ваг. % загусника (наприклад, ксантанової камеді) та води до 100 ваг. % з одержанням тонкоподрібненої сусpenзії активної речовини. За допомогою розбавлення водою одержують стійку сусpenзію активної речовини. Для композиції типу FS додають не більше ніж 40 ваг. % зв'язувальної речовини (наприклад, полівінілового спирту).

vi) Дисперговані у воді гранули та водорозчинні гранули (WG, SG)

Тонко подрібнюють 50-80 ваг. % сполуки формули I із додаванням диспергувальних речовин та змочувальних засобів (наприклад, лігносульфонату натрію та етоксилату спирту) до 100 ваг. % та одержують у вигляді диспергованих у воді або водорозчинних гранул за допомогою технічних електричних побутових приладів (наприклад, екструзії, вежі з розплююальним зрошенням, псевдозрідженою шару). За допомогою розбавлення водою одержують стійку дисперсію або розчин активної речовини. vii) Дисперговані у воді порошки та водорозчинні порошки (WP, SP, WS) 50-80 ваг. % сполуки формули I подрібнюють у роторно-статорному млині з додаванням 1-5 ваг. % диспергувальних речовин (наприклад, лігносульфонату натрію), 1-3 ваг. % змочувальних засобів (наприклад, етоксилату спирту) та твердого носія (наприклад, силікагелю) до 100 ваг. %. За допомогою розбавлення водою одержують стійку дисперсію або розчин активної речовини.

viii) Gel (GW, GF)

У перемішуваному кульовому млині 5-25 ваг. % сполуки формули (I) подрібнюють із додаванням 3-10 ваг. % диспергувальних речовин (наприклад, лігносульфонату натрію), 1-5 ваг. % загусника (наприклад, карбоксиметилцелюзози) та води до 100 ваг. % з одержанням тонкоподрібненої сусpenзії активної речовини. За допомогою розбавлення водою одержують стійку сусpenзію активної речовини.

ix) Мікроемульсія (ME)

Додають 5-20 ваг. % сполуки формули (I) до 5-30 ваг. % суміші органічних розчинників (наприклад, диметиламіду жирної кислоти та циклогексанону), 10-25 ваг. % суміші поверхнево-активних речовин (наприклад, етоксилату спирту та арилфенолетоксилату) та води до 100 %. Цю суміш перемішують протягом 1 год. зі спонтанним одержанням термодинамічно стійкої мікроемульсії.

x) Мікрокапсули (CS)

Масляну фазу, що містить 5-50 ваг. % сполуки формули (I), 0-40 ваг. % нерозчинного у воді органічного розчинника

(наприклад, ароматичного вуглеводню), 2-15 ваг. % акрилових мономерів (наприклад, метилметакрилату, метакрилової кислоти та ді- або триакрилату), диспергують у водний розчин захисного колоїду (наприклад, полівінілового спирту). Радикальна полімеризація зумовлює утворення мікрокапсул полі(мет)акрилату. Альтернативно масляну фазу, що містить 5-50 ваг. % сполуки формули I за даним винаходом, 0-40 ваг. % нерозчинного у воді органічного розчинника (наприклад, ароматичного вуглеводню) та мономер ізоцінату (наприклад, дифенілметен-4,4'-діїзоцінату) диспергують у водний розчин захисного колоїду (наприклад, полівінілового спирту). Додавання поліаміну (наприклад, гексаметилендіаміну) приводить у результаті до утворення мікрокапсул полісечовини. Кількість мономерів становить не більше ніж 1-10 ваг. %. Ваг. % відноситься до загальної композиції CS.

xi) Здатні до пилоутворення порошки (DP, DS)

1-10 ваг. % сполуки формули (I) тонко подрібнюють і ретельно змішують із твердим носієм (наприклад, тонкоподрібненим каоліном) до 100 ваг. %.

xii) Гранули (GR, FG)

Тонко подрібнюють 0,5-30 ваг. % сполуки формули (I) та з'єднують із твердим носієм (наприклад, силікатом) до 100 ваг. %. Здійснюють грануляцію за допомогою екструзії, висушування розпиленням або псевдозрідженою шару.

xiii) Рідини наднизького об'єму (UL)

Розчиняють 1-50 ваг. % сполуки формули (I) в органічному розчиннику (наприклад, ароматичному углеводні) до 100 ваг. %.

Композиції типів i) – xii) можуть необов'язково містити додаткові допоміжні речовини, такі як 5 0,1-1 ваг. % бактерицидних речовин, 5-15 ваг. % засобів, що запобігають заморожуванню, 0,1-1 ваг. % засобів, що запобігають спінюванню, та 0,1-1 ваг. % забарвлювальних речовин.

Агрохімічні композиції загалом містять від 0,01 до 95 %, переважно від 0,1 до 90 % i, зокрема, від 0,5 до 75 % за вагою активного інгредієнта (a.i.). Активні інгредієнти (a.i.) використовують за чистоти від 90 % до 100 %, переважно від 95 % до 100 % (згідно зі спектром ЯМР).

Для цілей обробки матеріалів для розмноження рослин, зокрема насіння, зазвичай застосовують розчини для обробки насіння (LS), суспензії (SE), текучі концентрати (FS), порошки для сухої обробки (DS), дисперговані у воді порошки для обробки за допомогою зависі (WS), водорозчинні порошки (SS), емульсії (ES), емульгувальні концентрати (EC) та гелі (GF).

15 Композиції, що розглядаються, після дво-десятикратного розведення забезпечують концентрації активної речовини, що становлять від 0,01 до 60 % за вагою, переважно від 0,1 до 40 %, в препаратах, готових до застосування.

20 Нанесення можна здійснювати до або під час висівання. Способи нанесення сполуки формули (I), комбінації та композиції на її основі, відповідно, щодо матеріалу для розмноження рослин, особливо насіння, включають протруювання, нанесення покриття, дражування, напилювання та просочування, а також способи застосування щодо борозни. Переважно сполуку формули (I), комбінацію та композицію на її основі відповідно застосовують щодо матеріалу для розмноження рослин за допомогою способу так, щоб не відбувалась індукція проростання, наприклад, за допомогою протруювання, дражування, нанесення покриття та напилювання щодо насінини.

25 У разі застосування для захисту рослин кількості застосовуваних активних речовин становлять від 0,001 до 2 кг на га, переважно від 0,005 до 2 кг на га, більш переважно від 0,05 до 1,0 кг на га і, зокрема, від 0,1 до 1,0 кг на га, залежно від типу потрібного ефекту.

30 Під час обробки матеріалів для розмноження рослин, таких як насінини, наприклад, за допомогою напилювання, нанесення покриття або просочування насіння зазвичай потребуються кількості активної речовини, що становлять від 0,1 до 1000 г, переважно від 1 до 1000 г, більш переважно від 1 до 100 г і найбільш переважно від 5 до 100 г на 100 кг матеріалу для розмноження рослин (переважно насіння).

35 У разі використання для захисту матеріалів або продуктів, що зберігаються, кількість нанесеної активної речовини залежить від типу ділянки для нанесення та потрібного ефекту. Кількості, які зазвичай наносяться для захисту матеріалів, становлять від 0,001 г до 2 кг, переважно від 0,005 г до 1 кг активної речовини на метр кубічний оброблюваного матеріалу.

40 Можна додавати різні типи масел, змочувальних речовин, допоміжних засобів, добрив або поживних мікроелементів і додаткових пестицидів (наприклад, гербіцидів, інсектицидів, фунгіцидів, регуляторів росту, антидотів, біопестицидів) до активних речовин або композицій, які містять їх як попередньо змішану суміш, або, якщо необхідно, тільки безпосередньо перед застосуванням (бакова суміш). Такі засоби можна змішувати з композицією за даним винаходом у ваговому співвідношенні від 1:100 до 100:1, переважно від 1:20 до 20:1.

45 Пестицид загалом являє собою хімічний або біологічний засіб (такий як пестицидно активний інгредієнт, сполука, композиція, вірус, бактерія, протимікробний або дезінфікувальний засіб), який своїм ефектом відлякує, нейтралізує, знищує або іншим чином перешкоджає шкідникам. Цільові шкідники можуть включати комах, патогени рослин, бур'яни, молюсків, птахів, ссавців, риб, нематод (круглих черв'яків) і мікроорганізми, які руйнують власність, спричиняють незручності, поширяють хвороби або є переносниками хвороби. Термін "пестицид" включає також регулятори росту рослин, які змінюють очікувані швидкість росту, цвітіння або розмноження рослини; дефоліанти, які зумовлюють опадання листків або інших листяних частин із рослини, зазвичай для полегшення збору врожаю; висушувальні засоби, які сприяють висушуванню живих тканин, таких як небажані верхівки рослин; активатори рослин, які активують фізіологічні властивості рослини для захисту від певних шкідників; антидоти, які знижують небажану гербіцидну дію пестицидів щодо культурних рослин; і речовини, що сприяють росту рослин, які впливають на фізіологічні властивості рослини для підвищення росту, біomasи, врожаю рослини або будь-яких інших параметрів якості врожаю культурної рослини.

55 Користувач зазвичай застосовує композицію згідно з даним винаходом за допомогою пристрою з попереднім дозуванням, ранцевого обприскувача, бака для обприскування, літака

для обприскування або іригаційної системи. Зазвичай агрохімічну композицію складають із додаванням води, буфера та/або додаткових допоміжних речовин для забезпечення потрібної концентрації для застосування, і в такий спосіб одержують готові до застосування розчини для обприскування або агрохімічну композицію згідно з даним винаходом. Зазвичай наносять від 20 до 2000 літрів, переважно від 50 до 400 літрів готового до застосування розчину для обприскування на гектар сільськогосподарської корисної площі.

Згідно з одним варіантом здійснення окремі компоненти композиції за даним винаходом, такі як частини набору або частини двокомпонентної або трикомпонентної суміші, може змішувати сам користувач в резервуарі для обприскування або в посудині будь-якого іншого типу, застосовуваних для нанесення (наприклад, барабанні прилади для обробки насіння, обладнання для дражування насіння, ранцевий обприскувач), і, якщо необхідно, можна додавати додаткові допоміжні речовини.

Отже, в одному варіанті здійснення даного винаходу передбачений набір для одержання придатної пестицидної композиції, при цьому набір містить а) композицію, що містить компонент 1), визначений у даному документі, та щонайменше одну допоміжну речовину; і б) композицію, що містить компонент 2), визначений у даному документі, і щонайменше одну допоміжну речовину; і необов'язково с) композицію, що містить щонайменше одну допоміжну речовину та необов'язково додатковий активний компонент 3), визначений у даному документі.

Сполука формули I, комбінація та композиція на її основі, що містить їх, під час застосування як фунгіцидів з іншими фунгіцидами може зумовлювати розширення одержуваного фунгіцидного спектра активності або попередження розвитку стійкості до фунгіцидів. Крім того, у багатьох випадках одержують незвичайні ефекти.

Даний винахід також відноситься до комбінації, що містить щонайменше одну сполуку формули (I) та щонайменше одну додаткову пестицидно активну речовину, вибрану із групи, що складається з фунгіцидів, інсектицидів, нематицидів, акарицидів, біопестицидів, гербіцидів, антидотів, регуляторів росту рослин, антибіотиків, добрив та поживних речовин. Пестицидно активні речовини, описані у WO2015185485, сторінки 36-43, і WO2017093019, сторінки 42-56, можна застосовувати сумісно зі сполукою формули (I).

Активні речовини, називані компонентом 2, їх одержання та їхня активність, наприклад, щодо шкідливих грибів є відомими (див.: <http://www.alanwood.net/pesticides/>); такі речовини є комерційно доступними. Сполуки, описані за допомогою номенклатури РАС, їх одержання та їхня пестицидна активність є також відомими (див. Can. J. Plant Sci. 48(6), 587-94, 1968; EP141317; EP152031; EP226917; EP243970; EP256503; EP428941; EP532022; EP1028125; EP1035122; EP1201648; EP1122244, JP2002316902; DE19650197; DE10021412; DE102005009458; US3296272; US3325503; WO9846608; WO9914187; WO9924413; WO9927783; WO0029404; WO0046148; WO0065913; WO0154501; WO 0156358; WO0222583; WO0240431; WO0310149; WO0311853; WO0314103; WO0316286; WO0353145; WO0361388; WO0366609; WO0374491; WO0449804; WO0483193; WO05120234; WO05123689; WO05123690; WO0563721; WO0587772; WO0587773; WO0615866; WO0687325; WO0687343; WO0782098; WO0790624; WO11028657; WO2012168188; WO2007006670; WO201177514; WO13047749; WO10069882; WO13047441; WO0316303; WO0990181; WO13007767; WO1310862; WO13127704; WO13024009; WO13024010; WO13047441; WO13162072; WO13092224 і WO11135833.

Крім того даний винахід відноситься до агрохімічної суміші, що містить щонайменше одну сполуку формули (I) (компонент 1) і щонайменше одну додаткову активну речовину, застосовну для захисту рослин.

За допомогою нанесення сполуки формули (I) разом із щонайменше однією пестицидно активною сполукою можна одержувати додатковий ефект.

Вказане можна одержувати шляхом застосування сполуки(-ук) формули I і щонайменше однієї додаткової пестицидно активної речовини одночасно або сумісно (наприклад, як бакової суміші) або окремо, або послідовно, при цьому часовий інтервал між окремими застосуваннями вибирають так, щоб переконатися, що активна речовина, нанесена першою, все ще присутня в ділянці дії в достатній кількості в момент часу застосування додаткової(-их) пестицидно активної(-их) речовини(-ин). Порядок нанесення не важливий для здійснення даного винаходу.

У разі послідовного застосування сполуки формули (I) та пестицидно активної речовини час між двома застосуваннями може варіюватися, наприклад, від 2 годин до 7 днів. Також можливий ширший діапазон від 0,25 години до 30 днів, переважно від 0,5 години до 14 днів, зокрема від 1 години до 7 днів або від 1,5 години до 5 днів, ще більше переважно від 2 годин до 1 дня. В двокомпонентних сумішах і композиції згідно з даним винаходом вагове співвідношення компонента 1) та компонента 2) загалом залежить від властивостей застосовуваних активних компонентів, звичайно воно знаходитьться у діапазоні від 1:1000 до 1000:1, часто у діапазоні від

1:100 до 100:1, зазвичай у діапазоні від 1:50 до 50:1, переважно у діапазоні від 1:20 до 20:1, більш переважно у діапазоні від 1:10 до 10:1, ще більш переважно у діапазоні від 1:4 до 4:1, зокрема, у діапазоні від 1:2 до 2:1.

Згідно з додатковим варіантом здійснення двокомпонентних сумішей та композиції на їх основі вагове співвідношення компонента 1) та компонента 2) звичайно знаходиться у діапазоні від 1000:1 до 1:1000, часто у діапазоні від 100:1 до 1:100, зазвичай у діапазоні від 50:1 до 1:50, переважно у діапазоні від 20:1 до 1:20, більш переважно у діапазоні від 10:1 до 1:10, ще більш переважно у діапазоні від 4:1 до 1:4 і, зокрема, у діапазоні від 2:1 до 1:2.

У трикомпонентних сумішах, тобто в композиції згідно з даним винаходом, яка містить компонент 1), і компонент 2), і сполуку III (компонент 3), вагове співвідношення компонента 1) та компонента 2) залежить від властивостей застосовуваних активних речовин, звичайно воно знаходиться у діапазоні від 1:100 до 100:1, зазвичай у діапазоні від 1:50 до 50:1, переважно у діапазоні від 1:20 до 20:1, більш переважно у діапазоні від 1:10 до 10:1 і, зокрема, у діапазоні від 1:4 до 4:1, і вагове співвідношення компонента 1) та компонента 3) звичайно знаходиться у діапазоні від 1:100 до 100:1, зазвичай у діапазоні від 1:50 до 50:1, переважно у діапазоні від 1:20 до 20:1, більш переважно у діапазоні від 1:10 до 10:1 і, зокрема, у діапазоні від 1:4 до 4:1.

За потреби додають будь-які додаткові активні компоненти у співвідношенні від 20:1 до 1:20 щодо компонента 1).

Такі співвідношення також є придатними для сумішей за даним винаходом, застосовуваних під час обробки насіння.

Даний винахід також відноситься до способу одержання сполуки за даним винаходом. Способ одержання сполуки за даним винаходом описаний в експериментальному розділі більш докладно.

Далі винахід, розкритий у даному документі, буде уточнений за допомогою необмежувальних схем і прикладів.

ХІМІЧНІ ПРИКЛАДИ

Приклад 1. Одержання 2-(2-хлор-5-метилфенокси)-1-(4-(5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл)феніл)етан-1-ону (сполука № 33)

а) Стадія 1. 4-(2-Метил-1,3-діоксолан-2-іл)бензонітрил

До перемішуваного розчину 4-ацетилбензонітрилу (10 г, 69 ммоль) і етиленгліколю (80 мл, 1,4 моль) додавали триметил-ортотформіат (50 мл, 0,9 моль) і N-бромуsuccінімід (1,2 г, 7 ммоль) при 25 °C. Одержану в результаті реакційну суміш перемішували при 65 °C протягом 12 год. Після завершення реакції реакційну суміш розбавляли дихлорметаном (120 мл) і промивали водою (80 мл). Шар дихлорметану висушували над безводним сульфатом натрію і концентрували при зниженному тиску з одержанням 4-(2-метил-1,3-діоксолан-2-іл)бензонітрилу (12 г, вихід 92 %).

б) Стадія 2. N'-Гідрокси-4-(2-метил-1,3-діоксолан-2-іл)бензімідамід

До перемішуваного розчину 4-(2-метил-1,3-діоксолан-2-іл)бенzonітрилу (12 г, 63 ммоль) і етанолу (80 мл) додавали бікарбонат натрію (9,6 г, 114 ммоль) і гідрохлорид гідроксиламіну (5,3 г, 76 ммоль) при 0 °C. Одержану в результаті реакційну суміш перемішували при 65 °C протягом 4 год. Після завершення реакції реакційну суміш фільтрували і концентрували при зниженному тиску з одержанням N'-гідрокси-4-(2-метил-1,3-діоксолан-2-іл)бензімідаміду (12 г, вихід 85 %).

с) Стадія 3. 3-(4-(2-Метил-1,3-діоксолан-2-іл)феніл)-5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол

До перемішуваного розчину N'-гідрокси-4-(2-метил-1,3-діоксолан-2-іл)бензімідаміду (0,3 г, 1,4 ммоль) і тетрагідрофурану (30 мл) додавали трифтороцтовий ангідрид (0,25 мл, 1,8 ммоль) при 0 °C і перемішували при 25 °C протягом 16 год. Реакційну суміш розбавляли етилацетатом (40 мл) і двічі промивали розчином бікарбонату натрію (40 мл). Шар етилацетату висушували над безводним сульфатом натрію і концентрували при зниженному тиску з одержанням неочищеного продукту. Неочищений продукт очищали за допомогою колонкової хроматографії із застосуванням 30 % етилацетату в гексані як елюенту на силікагелі з одержанням 3-(4-(2-метил-1,3-діоксолан-2-іл)феніл)-5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазолу (0,2 г, вихід 49 %).

д) Стадія 4. 1-(4-(5-(Трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл)феніл)етан-1-он

До перемішуваного розчину 3-(4-(2-метил-1,3-діоксолан-2-іл)феніл)-5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазолу (10 г, 33 ммоль) і ацетону (50 мл) додавали йод (0,5 г, 2 ммоль) при 25 °C протягом 3 год. Після завершення реакції реакційну суміш концентрували при зниженному тиску, розбавляли етилацетатом (80 мл) і промивали водою (40 мл). Шар етилацетату висушували над безводним сульфатом натрію і концентрували при зниженному тиску з одержанням неочищеного продукту. Неочищений залишок очищали за допомогою колонкової хроматографії із застосуванням 30 % етилацетату в гексані як елюенту на силікагелі з одержанням 1-(4-(5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл)феніл)етан-1-ону (6 г, вихід 70 %).

e) Стадія 5. 2-Бром-1-(4-(5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл)феніл)етан-1-он

До перемішуваного розчину 1-(4-(5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл)феніл)етан-1-ону (16 г, 63 ммоль) і дихлорметану (100 мл) додавали бром (2,3 мл, 43 ммоль) при 0 °C. Одержану в результаті реакційну суміш перемішували протягом 3 год. при 25 °C. Після завершення реакції 5 реакційну суміш розбавляли дихлорметаном (120 мл) і промивали водою (80 мл). Шар дихлорметану висушували над безводним сульфатом натрію та концентрували при зниженному тиску. Неочищений залишок очищали за допомогою колонкової хроматографії із застосуванням 10 % етилацетату в гексані як елюенту на силікагелі з одержанням 2-бром-1-(4-(5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл)феніл)етан-1-ону (11 г, вихід 53 %).

10 f) Стадія-6. 2-(2-хлор-5-метилфенокси)-1-(4-(5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл)феніл)етан-1-он

До перемішуваного розчину 2-бром-1-(4-(5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл)феніл)етан-1-ону (0,2 г, 0,6 ммоль) і ацетонітрилу (8 мл) додавали карбонат калію (0,18 г, 1,3 ммоль) і 2-хлор-5-метилфенол (0,17 г, 1,2 ммоль) при 0 °C в атмосфері азоту. Одержану в результаті 15 реакційну суміш перемішували протягом 1 год. при 25 °C. Після завершення реакції реакційну суміш розбавляли етилацетатом (10 мл) і промивали водою (10 мл). Шар етилацетату висушували над безводним сульфатом натрію та концентрували при зниженному тиску. Неочищений залишок очищали за допомогою колонкової хроматографії із застосуванням 20 % етилацетату в гексані як елюенту на силікагелі з одержанням 2-(2-хлор-5-метилфенокси)-1-(4-(5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл)феніл)етан-1-ону (0,15 г, вихід 63 %). ¹H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 8,26-8,21 (m, 4H), 7,30 (d, 1H), 7,00 (d, 1H), 6,77 (dd, 1H), 5,75 (s, 2H), 2,24 (s, 3H).

Таблиця 1

Наступні сполуки одержували за допомогою аналогічної процедури, описаної у прикладі 1

№ сполуки	Назва згідно IUPAC	Аналітичні дані
1	2-(2-Фторфенокси)-1-(4-(5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл)феніл)етан-1-он	¹ H-ЯМР (400 МГц, хлороформ-D) δ 8,28-8,14 (m, 4H), 7,14-6,94 (m, 4H), 5,36 (s, 2H); LCMS (M-H): 365
2	2-(4-Метоксифенокси)-1-(4-(5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл)феніл)етан-1-он	¹ H-ЯМР (400 МГц, хлороформ-D) δ 8,24-8,27 (m, 2H), 8,15 (d, 2H), 6,81-6,92 (m, 4H), 5,23 (s, 2H), 3,77 (s, 3H); LCMS (M-H): 377,05
3	2-(3-Фторфенокси)-1-(4-(5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл)феніл)етан-1-он	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 8,26-8,21 (m, 4H), 7,31 (td, 1H), 6,94 (dt, 1H), 6,87-6,84 (m, 1H), 6,80-6,75 (m, 1H), 5,68 (s, 2H); LCMS (M-H): 364,9
4	2-(4-Фторфенокси)-1-(4-(5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл)феніл)етан-1-он	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 8,25-8,21 (m, 4H), 7,14-7,08 (m, 2H), 7,04-7,00 (m, 2H), 5,62 (s, 2H); LCMS (M-H): 364,9
5	2-(4-Бромфенокси)-1-(4-(5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл)феніл)етан-1-он	¹ H-ЯМР (400 МГц, хлороформ-D) δ 8,26-8,28 (m, 2H), 8,12-8,15 (m, 2H), 7,37-7,41 (m, 2H), 6,82-6,85 (m, 2H), 5,27 (s, 2H); LCMS (M-H): 426,85
6	2-(4-Хлорфенокси)-1-(4-(5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл)феніл)етан-1-он	¹ H-ЯМР (400 МГц, хлороформ-D) δ 8,27 (d, 2H), 8,15-8,12 (m, 2H), 7,27-7,23 (m, 2H), 6,90-6,86 (m, 2H), 5,27 (s, 2H); LCMS (M-H): 380,9
7	2-(2,6-Дихлорфенокси)-1-(4-(5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл)феніл)етан-1-он	¹ H-ЯМР (400 МГц, хлороформ-D) δ 8,29-8,26 (m, 2H), 8,21-8,18 (m, 2H), 7,34 (d, 2H), 7,07 (dd, 1H), 5,29 (s, 2H); LCMS (M-H): 414,9
8	2-(3-Бром-4-метилфенокси)-1-(4-(5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл)феніл)етан-1-он	¹ H-ЯМР (400 МГц, хлороформ-D) δ 8,29-8,23 (m, 2H), 8,15-8,12 (m, 2H), 7,16-7,13 (m, 2H), 6,82 (dd, 1H), 5,25 (s, 2H), 2,29-2,33 (m, 3H); LCMS (M-H): 440,85
9	2-(4-Хлор-3-(трифторметил)фенокси)-1-(4-(5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл)феніл)етан-1-он	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 8,26-8,21 (m, 4H), 7,62 (d, 1H), 7,47 (d, 1H), 7,36 (dd, 1H), 5,82 (s, 2H); LCMS (M-H): 449,1
10	2-(m-Толілокси)-1-(4-(5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл)феніл)етан-1-он	¹ H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 8,26-8,22 (m, 4H), 7,15 (t, 1H), 6,83 (s, 1H), 6,78-6,76 (m, 2H), 5,59 (s, 2H), 2,26 (s, 3H); LCMS (M-H): 361,15

Таблиця 1

Наступні сполуки одержували за допомогою аналогічної процедури, описаної у прикладі 1

№ сполуки	Назва згідно IUPAC	Аналітичні дані
11	2-(2-Метоксифенокси)-1-(4-(5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл)феніл)етан-1-он	^1H -ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 8,25-8,23 (m, 4H), 6,99 (dd, 1H), 6,92 (qd, 2H), 6,83 (td, 1H), 5,58 (s, 2H), 3,78 (s, 3H); LCMS (M-H): 379,15
12	2-(4-Бром-3-фторфенокси)-1-(4-(5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл)феніл)етан-1-он	^1H -ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 8,26-8,20 (m, 4H), 7,60-7,56 (m, 1H), 7,20-7,16 (m, 1H), 6,89-6,86 (m, 1H), 5,71 (s, 2H); LCMS (M-H): 442,95
15	2-(3,5-Дихлорфенокси)-1-(4-(5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл)феніл)етан-1-он	^1H -ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 8,26-8,21 (m, 4H), 7,19-7,17 (m, 3H), 5,76 (s, 2H); LCMS (M-H): 415
16	2-(2,5-Диметилфенокси)-1-(4-(5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл)феніл)етан-1-он	^1H -ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 8,26-8,24 (m, 4H), 7,02 (d, 1H), 6,77 (s, 1H), 6,66 (d, 1H), 5,60 (s, 2H), 2,22 (s, 3H), 2,16 (s, 3H); LCMS (M-H): 375,2
17	2-(5-Хлор-2-метилфенокси)-1-(4-(5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл)феніл)етан-1-он	^1H -ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 8,22 (d, J=8,8 Гц, 4H), 7,19-7,11 (m, 2H), 6,91 (dd, 1H), 5,71 (s, 2H), 2,20 (s, 3H)
18	2-(2,4-Дифторфенокси)-1-(4-(5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл)феніл)етан-1-он	^1H -ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 8,26-8,20 (m, 4H), 7,34-7,20 (m, 2H), 7,01-6,95 (m, 1H), 5,75 (s, 2H); LCMS (M-H): 383,1
19	2-(2-Хлор-4-фторфенокси)-1-(4-(5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл)феніл)етан-1-он	^1H -ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 8,26-8,21 (m, 4H), 7,48-7,44 (m, 1H), 7,25-7,15 (m, 2H), 5,78 (s, 2H); LCMS (M-H): 398,65
20	2-(2,4-Дихлорфенокси)-1-(4-(5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл)феніл)етан-1-он	^1H -ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 8,26-8,19 (m, 4H), 7,60-7,59 (m, 1H), 7,32 (dd, 1H), 7,19-7,17 (m, 1H), 5,84-5,80 (m, 2H); LCMS (M-H): 414,65
21	2-(Піридин-3-ілокси)-1-(4-(5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл)феніл)етан-1-он	^1H -ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 8,29 (ddd, 4H), 7,38-7,31 (m, 3H), 6,97 (td, 1H), 6,06 (s, 2H); LCMS (M+H): 349,35
30	2-Фенокси-1-(4-(5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл)феніл)етан-1-он	^1H -ЯМР (400 МГц, хлороформ-D) δ 8,28-8,25 (m, 2H), 8,16 (d, 2H), 7,33-7,28 (m, 2H), 7,03-6,99 (m, 1H), 6,97-6,94 (m, 2H), 5,28 (s, 2H); LCMS (M-H): 346,95
34	2-(п-Толілокси)-1-(4-(5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл)феніл)етан-1-он	^1H -ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 8,27-8,22 (m, 4H), 7,09 (dd, 2H), 6,91-6,88 (m, 2H), 5,59 (s, 2H), 2,29 (d, 3H)
35	2-(3-Хлорфенокси)-1-(4-(5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл)феніл)етан-1-он	^1H -ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 8,26 (dd, 4H), 7,33 (t, 1H), 7,17 (t, 1H), 7,05-6,99 (m, 2H), 5,72 (s, 2H); LCMS (M-H): 380,7
36	1-(4-(5-(Трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл)феніл)-2-(4-(трифторметил)фенокси)етан-1-он	^1H -ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 8,26 (dd, 4H), 7,67 (d, 2H), 7,21 (d, 2H), 5,81 (s, 2H); LCMS (M-H): 415
37	2-(3-Метоксифенокси)-1-(4-(5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл)феніл)етан-1-он	^1H -ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 8,28-8,18 (m, 4H), 7,21-7,17 (m, 1H), 6,60-6,54 (m, 3H), 5,62 (s, 2H), 3,72 (d, 3H); LCMS (M-H): 377
38	2-(2,4-Диметилфенокси)-1-(4-(5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл)феніл)етан-1-он	^1H -ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 8,27-8,22 (m, 4H), 6,98 (s, 1H), 6,91 (d, 1H), 6,81 (d, 1H), 5,58 (s, 2H), 2,34-2,20 (m, 6H); LCMS (M-H): 375
39	2-(o-Толілокси)-1-(4-(5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл)феніл)етан-1-он	^1H -ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 8,30-8,19 (m, 4H), 7,18-7,03 (m, 2H), 6,98-6,68 (m, 2H), 5,65 (s, 2H), 2,29-2,24 (m, 3H); LCMS (M-H): 361
40	1-(4-(5-(Трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл)феніл)-2-(3-(трифторметил)фенокси)етан-1-он	^1H -ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 8,27-8,22 (m, 4H), 7,52 (t, 1H), 7,37 (s, 1H), 7,33-7,30 (m, 2H), 5,79 (s, 2H)

Таблиця 1

Наступні сполуки одержували за допомогою аналогічної процедури, описаної у прикладі 1

№ сполуки	Назва згідно IUPAC	Аналітичні дані
41	2-(3-Фтор-5-метилфенокси)-1-(4-(5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл)феніл)етан-1-он	^1H -ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 8,26-8,21 (m, 4H), 6,74-6,71 (m, 2H), 6,62 (d, 1H), 5,65 (s, 2H), 2,27 (s, 3H); LCMS (M-1): 378,75
42	2-(3-Хлор-5-фторфенокси)-1-(4-(5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл)феніл)етан-1-он	^1H -ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 8,26-8,21 (m, 4H), 7,06-7,05 (m, 1H), 7,01-6,97 (m, 2H), 5,75 (s, 2H); LCMS (M-1): 398,85
43	2-(2-Хлор-4-метоксифенокси)-1-(4-(5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл)феніл)етан-1-он	^1H -ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 8,26-8,13 (m, 4H), 7,08-7,05 (m, 2H), 6,82 (dd, 1H), 5,66 (d, 2H), 3,71 (s, 3H); LCMS (M-1): 410,95
44	2-((2-Хлорпіridин-4-іл)окси)-1-(4-(5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл)феніл)етан-1-он	^1H -ЯМР (400 МГц, хлороформ-D) δ 8,29 (d, 2H), 8,22 (d, 1H), 8,11 (d, 2H), 6,86 (d, 1H), 6,81 (d, 1H), 5,40 (s, 2H); LCMS (M-1): 381,80
45	2-((6-Метил-3-(трифторметил)піридин-2-іл)окси)-1-(4-(5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл)феніл)етан-1-он	^1H -ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 8,19-8,25 (m, 4H), 8,00 (d, 1H), 7,02 (d, 1H), 5,86 (s, 2H), 2,29 (s, 3H); LCMS (M+1): 431,85
46	2-((2-Хлорпіridин-3-іл)окси)-1-(4-(5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл)феніл)етан-1-он	^1H -ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 8,24 (ddd, 4H), 7,99 (dd, 1H), 7,60 (dd, 1H), 7,35 (dd, 1H), 5,88 (s, 2H); LCMS (M-1): 381,70
47	2-((6-Фторпіridин-3-іл)окси)-1-(4-(5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл)феніл)етан-1-он	^1H -ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 8,26-8,20 (m, 4H), 7,99 (dd, 1H), 7,71-7,66 (m, 1H), 7,14-7,11 (m, 1H), 5,76 (s, 2H); LCMS (M+1): 367,70
48	2-((5-Бромпіridин-3-іл)окси)-1-(4-(5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл)феніл)етан-1-он	^1H -ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 8,41 (d, 1H), 8,33 (d, 1H), 8,23-8,29 (m, 4H), 7,90 (dd, 1H), 5,83 (s, 2H); LCMS (M+1): 429,70
49	2-((6-Бромпіridин-3-іл)окси)-1-(4-(5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл)феніл)етан-1-он	^1H -ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 8,28-8,22 (m, 5H), 7,57 (dd, 1H), 7,50 (dd, 1H), 5,81 (s, 2H); LCMS (M+1): 429,65
50	2-((1-Метил-1Н-піразол-3-іл)окси)-1-(4-(5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл)феніл)етан-1-он	^1H -ЯМР (400 МГц, хлороформ-D) δ 8,24 (dt, 2H), 8,15-8,12 (m, 2H), 7,13 (d, 1H), 5,74 (d, 1H), 5,46 (s, 2H), 3,70 (s, 3H); LCMS (M+1): 352,27
51	2-((4-Хлорпіridин-3-іл)окси)-1-(4-(5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл)феніл)етан-1-он	^1H -ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 8,46 (s, 1H), 8,27-8,21 (m, 4H), 8,17 (d, 1H), 7,57 (d, 1H), 5,95 (s, 2H); LCMS (M+1): 383,85

Приклад 2. Одержання 2-((4-метоксифеніл)тіо)-1-(4-(5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл)феніл)етан-1-ону (сполука 23)

- До перемішуваного розчину 2-бром-1-(4-(5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл)феніл)етан-1-ону (0,3 г, 0,9 ммоль) і ацетонітрилу (8 мл) додавали карбонат калію (0,27 г, 2 ммоль) і 4-метоксибензолтіол (0,13 г, 0,9 ммоль) при 0 °C. Одержану в результаті реакційну суміш перемішували протягом 1 год. при 25 °C. Після завершення реакції реакційну суміш розбавляли етилацетатом (10 мл) і промивали водою (10 мл). Шар етилацетату висушували над безводним сульфатом натрію та концентрували при зниженному тиску. Неочищений залишок очищали за допомогою колонкової хроматографії із застосуванням 20 % етилацетату в гексані як елюенту на силікагелі з одержанням 2-((4-метоксифеніл)тіо)-1-(4-(5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл)феніл)етан-1-ону (0,19 г, вихід 54 %).

Таблиця 2

Наступні сполуки одержували за допомогою аналогічної процедури, описаної у прикладі 2

№ сполуки	Назва згідно IUPAC	Аналітичні дані
13	2-((2,6-Дихлорфеніл)тіо)-1-(4-(5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл)феніл)етан-1-он	^1H -ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 8,23 (dd, 4H), 7,67 (d, 1H), 7,55 (d, 1H), 7,35 (dd, 1H), 4,90 (s, 2H); LCMS (M-1): 430,80
14	2-((3-Метоксифеніл)тіо)-1-(4-(5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл)феніл)етан-1-он	^1H -ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 8,24-8,19 (m, 4H), 7,23-7,19 (m, 1H), 6,91-6,89 (m, 2H), 6,78-6,75 (m, 1H), 4,73 (s, 2H), 3,72 (s, 3H); LCMS (M-H): 392,9
22	2-(п-Толілтіо)-1-(4-(5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл)феніл)етан-1-он	^1H -ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 8,24-8,19 (m, 4H), 7,27 (d, 2H), 7,13 (d, 2H), 4,63 (s, 2H), 2,27 (s, 3H); LCMS (M-H): 377
24	2-(Цикlopентилтіо)-1-(4-(5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл)феніл)етан-1-он	^1H -ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 8,24-8,19 (m, 4H), 4,09 (s, 2H), 3,13-3,06 (m, 1H), 1,99-1,91 (m, 2H), 1,68-1,38 (m, 6H); LCMS (M-H): 354,7
25	2-(Бензо[д]оксазол-2-ілтіо)-1-(4-(5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл)феніл)етан-1-он	^1H -ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 8,33-8,27 (m, 4H), 7,67-7,60 (m, 2H), 7,36-7,31 (m, 2H), 5,27 (s, 2H); LCMS (M+H): 406,1
26	2-((4-Метилтіазол-2-іл)тіо)-1-(4-(5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл)феніл)етан-1-он	^1H -ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 8,28-8,23 (m, 4H), 7,18 (t, 1H), 5,01 (s, 2H), 2,26 (d, 3H); LCMS (M+H): 386,35
52	2-((3,4-Дихлорфеніл)тіо)-1-(4-(5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл)феніл)етан-1-он	^1H -ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 8,23 (dd, 4H), 7,67 (d, 1H), 7,55 (d, 1H), 7,35 (dd, 1H), 4,90 (s, 2H); LCMS (M-1): 430,80
53	2-((4-Хлорфеніл)тіо)-1-(4-(5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл)феніл)етан-1-он	^1H -ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 8,21 (s, 4H), 7,35-7,39 (m, 4H), 4,77 (s, 2H); LCMS (M-1): 396,80
54	2-((3-Хлорфеніл)тіо)-1-(4-(5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл)феніл)етан-1-он	^1H -ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 8,20-8,26 (m, 4H), 7,45-7,46 (m, 1H), 7,31-7,32 (m, 2H), 7,23-7,26 (m, 1H), 4,86 (s, 2H); LCMS (M-1): 396,70
55	2-((3,4-Дифторфеніл)тіо)-1-(4-(5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл)феніл)етан-1-он	^1H -ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 8,17-8,23 (m, 4H), 7,51-7,56 (m, 1H), 7,34-7,42 (m, 1H), 7,18-7,22 (m, 1H), 4,81 (s, 2H); LCMS (M-1): 398,95
56	2-(Бензилтіо)-1-(4-(5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл)феніл)етан-1-он	^1H -ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 8,15-8,21 (m, 4H), 7,22-7,32 (m, 5H), 3,95 (s, 2H), 3,73 (d, 2H); LCMS (M-1): 376,80
57	2-((4-Метоксибензил)тіо)-1-(4-(5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл)феніл)етан-1-он	^1H -ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 8,17-8,23 (m, 4H), 7,22-7,27 (m, 2H), 6,87-6,90 (m, 2H), 3,95 (s, 2H), 3,74 (d, 3H), 3,70 (d, 2H); LCMS (M-1): 406,80
58	2-((1-Фенілєтил)тіо)-1-(4-(5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл)феніл)етан-1-он	^1H -ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 8,16-8,19 (m, 2H), 8,09-8,12 (m, 2H), 7,29-7,35 (m, 4H), 7,21-7,26 (m, 1H), 3,98-4,08 (m, 2H), 3,72 (d, 1H), 1,51 (d, 3H); LCMS (M-1): 390,80
59	2-(Циклогексилтіо)-1-(4-(5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл)феніл)етан-1-он	^1H -ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 8,17-8,23 (m, 4H), 4,07 (s, 2H), 2,66-2,72 (m, 1H), 1,88-1,91 (m, 2H), 1,52-1,66 (m, 3H), 1,16-1,30 (m, 5H); LCMS (M-1): 368,80
60	2-(Фенілтіо)-1-(4-(5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл)феніл)етан-1-он	^1H -ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 8,18-8,23 (m, 4H), 7,28-7,37 (m, 4H), 7,18-7,22 (m, 1H), 4,72 (s, 2H); LCMS (M-1): 362,80
61	2-(Алілтіо)-1-(4-(5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл)феніл)етан-1-он	^1H -ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 8,17-8,23 (m, 4H), 5,71-5,81 (m, 1H), 5,09-5,17 (m, 2H), 4,00 (s, 2H), 3,14 (ddt, 2H); LCMS (M-1): 326,80

Таблиця 2

Наступні сполуки одержували за допомогою аналогічної процедури, описаної у прикладі 2

№ сполуки	Назва згідно IUPAC	Аналітичні дані
62	1-(4-(5-(Трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл)феніл)-2-((3-(трифторметил)феніл)тіо)етан-1-он	^1H -ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 8,20-8,25 (m, 4H), 7,71 (d, 1H), 7,64-7,67 (m, 1H), 7,50-7,55 (m, 2H), 4,87-4,95 (m, 2H); LCMS (M-1): 430,80
63	2-((2-Метоксифеніл)тіо)-1-(4-(5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл)феніл)етан-1-он	^1H -ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 8,18-8,22 (m, 4H), 7,18-7,26 (m, 2H), 6,87-6,99 (m, 2H), 4,56 (s, 2H), 3,78 (s, 3H); LCMS (M-1): 392,75
64	2-((3-Фторфеніл)тіо)-1-(4-(5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл)феніл)етан-1-он	^1H -ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 8,23 (qd, 4H), 7,33 (td, 1H), 7,26 (dt, 1H), 7,17 (dq, 1H), 6,98-7,03 (m, 1H), 4,85 (s, 2H); LCMS (M-1): 380,90
65	2-((2-Фторфеніл)тіо)-1-(4-(5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл)феніл)етан-1-он	^1H -ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 8,17-8,21 (m, 4H), 7,42 (td, 1H), 7,12-7,30 (m, 3H), 4,70 (s, 2H); LCMS (M-1): 380,95
66	2-(o-Толілтіо)-1-(4-(5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл)феніл)етан-1-он	^1H -ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 7,37-7,42 (m, 4H), 6,50 (dd, 1H), 6,37-6,38 (m, 1H), 6,27-6,36 (m, 2H), 3,85 (s, 2H), 1,44 (s, 3H); LCMS (M-1): 376,75
67	2-(m-Толілтіо)-1-(4-(5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл)феніл)етан-1-он	^1H -ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 8,18-8,23 (m, 4H), 7,13-7,20 (m, 3H), 7,00-7,02 (m, 1H), 4,69 (s, 2H), 2,25 (s, 3H); LCMS (M-1): 376,95
68	2-(Піридин-4-ілтіо)-1-(4-(5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл)феніл)етан-1-он	^1H -ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 8,36 (dd, 2H), 8,27-8,30 (m, 2H), 8,22-8,25 (m, 2H), 7,32 (dd, 2H), 4,98 (s, 2H); LCMS (M-1): 363,95
69	2-(Ізопропілтіо)-1-(4-(5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл)феніл)етан-1-он	^1H -ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 8,20 (s, 4H), 4,09 (s, 2H), 2,87-2,94 (m, 1H), 1,20 (d, 6H); LCMS (M-1): 329,00
70	2-(трет-Бутилтіо)-1-(4-(5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл)феніл)етан-1-он	^1H -ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 8,16-8,22 (m, 4H), 4,13 (s, 2H), 1,29 (s, 9H); LCMS (M-1): 343,00
71	1-(4-(5-(Трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл)феніл)-2-((4-(трифторметил)феніл)тіо)етан-1-он	^1H -ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 8,21-8,27 (m, 4H), 7,63 (d, 2H), 7,54 (d, 2H), 4,94 (s, 2H); LCMS (M-1): 430,90
72	1-(4-(5-(Трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл)феніл)-2-((4-(трифторметил)піrimідин-2-іл)тіо)етан-1-он	^1H -ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 8,94 (d, 1H), 8,23-8,28 (m, 4H), 7,69 (d, 1H), 4,93 (s, 2H); LCMS (M-1): 432,90
73	2-(Тіазол-2-ілтіо)-1-(4-(5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл)феніл)етан-1-он	^1H -ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 8,24 (dd, 4H), 7,67 (d, 1H), 7,64 (d, 1H), 5,05 (s, 2H); LCMS (M-1): 369,90
74	2-(Піридин-2-ілтіо)-1-(4-(5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл)феніл)етан-1-он	^1H -ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 8,30 (dq, 1H), 8,17-8,27 (m, 4H), 7,62-7,66 (m, 1H), 7,37-7,42 (m, 1H), 7,09 (ddd, 1H), 4,85 (s, 2H); LCMS (M-1): 363,70
75	2-((4-Метил-4Н-1,2,4-триазол-3-іл)тіо)-1-(4-(5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл)феніл)етан-1-он	^1H -ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 8,53 (s, 1H), 8,22 (s, 4H), 4,91 (s, 2H), 3,60 (s, 3H); LCMS (M-1): 367,75
76	2-((1,3,4-Тіадіазол-2-іл)тіо)-1-(4-(5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл)феніл)етан-1-он	^1H -ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 9,50 (s, 1H), 8,24-8,29 (m, 4H), 5,21 (s, 2H); LCMS (M+1): 372,95
149	2-((1Н-1,2,4-Триазол-5-іл)тіо)-1-(4-(5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл)феніл)етан-1-он	^1H -ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 13,98 (s, 1H), 8,39 (s, 1H), 8,22 (s, 4H), 4,85 (s, 2H), LCMS (M-1): 353,70
150	2-((5-Метил-1,3,4-оксадіазол-2-іл)тіо)-1-(4-(5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл)феніл)етан-1-он	^1H -ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 8,25 (s, 4H), 5,13 (s, 2H), 2,47 (s, 3H); LCMS (M+1): 370,95

Таблиця 2

Наступні сполуки одержували за допомогою аналогічної процедури, описаної у прикладі 2

№ сполуки	Назва згідно IUPAC	Аналітичні дані
151	2-((4-Метилпіридин-2-іл)тіо)-1-(4-(5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл)феніл)етан-1-он	^1H -ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 8,21-8,26 (m, 4H), 8,16 (dd, 1H), 7,22 (t, 1H), 6,92-6,93 (m, 1H), 4,82 (s, 2H), 2,25 (s, 3H); LCMS (M+1): 380,00
152	2-((2-Гідроксіетил)тіо)-1-(4-(5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл)феніл)етан-1-он	^1H -ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 8,17-8,22 (m, 4H), 4,80 (t, 1H), 4,08 (s, 2H), 3,50-3,55 (m, 2H), 2,57 (t, 2H); LCMS (M+1): 330,95

Приклад 3. Одержання 2-((3,4-дифторфеніл)аміно)-1-(4-(5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл)феніл)етан-1-ону (сполука 27)

До перемішуваного розчину 3,4-дифтораніліну (0,1 г, 0,8 ммоль) і N, N-диметилформаміду (8 мл) додавали бікарбонат натрію (0,11 г, 1,3 ммоль) і йодид калію (0,02 г, 0,1 ммоль) при 0 °C. Суміш перемішували протягом 15 хв. при 25 °C. Потім додавали 2-бром-1-(4-(5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл)феніл)етан-1-он (0,22 г, 0,7 ммоль) при 0 °C і одержану в результаті реакційну суміш перемішували при 25 °C протягом 1 год. Після завершення реакції реакційну суміш розбавляли етилацетатом (10 мл) і промивали водою (10 мл). Шар етилацетату висушували над безводним сульфатом натрію та концентрували при зниженому тиску. Неочищений залишок очищали за допомогою колонкової хроматографії із застосуванням 20 % етилацетату в гексані як елюента на силікагелі з одержанням 2-((3,4-дифторфеніл)аміно)-1-(4-(5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл)феніл)етан-1-ону (0,12 мг, 0,3 ммоль, вихід 47 %).

Таблиця 3

Наступні сполуки одержували за допомогою аналогічної процедури, описаної у прикладі 3

№ сполуки	Назва згідно IUPAC	Аналітичні дані
28	1-(4-(5-(Трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл)феніл)-2-((4-(трифторметил)феніл)аміно)етан-1-он	^1H -ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 8,31-8,25 (m, 4H), 7,40 (d, 2H), 6,83 (d, 2H), 6,71-6,68 (m, 1H), 4,87 (d, 2H); LCMS (M+H): 415,95

Приклад 4. Синтез 2-(феніламіно)-1-(4-(5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл)феніл)етан-1-ону (сполука 137)

До перемішуваного розчину 2-бром-1-(4-(5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл)феніл)етан-1-ону (0,2 г, 0,6 ммоль) і етанолу (10 мл) в атмосфері азоту додавали анілін (0,056 г, 0,6 ммоль) і бікарбонат натрію (0,060 г, 0,72 ммоль) при 25 °C. Одержану в результаті реакційну суміш перемішували протягом при 25 °C протягом 12 год. Після завершення реакції реакційну суміш гасили за допомогою додавання води (10 мл) і продукт тричі екстрагували за допомогою етилацетату (20 мл). Об'єднані шари етилацетату висушували над безводним сульфатом натрію і концентрували при зниженному тиску з одержанням неочищеного продукту. Неочищений продукт очищали за допомогою препаративної HPLC з одержанням 2-(феніламіно)-1-(4-(5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл)феніл)етан-1-ону (0,14 г, 0,4 ммоль, вихід 67 %).

Таблиця 4

Наступні сполуки одержували за допомогою аналогічної процедури, описаної у прикладі 4

№ сполуки	Назва згідно IUPAC	Аналітичні дані
32	2-((3-Метоксифеніл)аміно)-1-(4-(5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл)феніл)етан-1-он	^1H -ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 8,27-8,29 (m, 2H), 8,22 (dd, 2H), 6,97 (t, 1H), 6,27-6,30 (m, 2H), 6,15 (ddd, 1H), 5,90 (t, 1H), 4,72 (d, 2H), 3,67 (s, 3H); LCMS (M+H) 377,95
138	2-((4-Фторфеніл)аміно)-1-(4-(5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл)феніл)етан-1-он	^1H -ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 8,25 (ddd, 4H), 6,89-6,95 (m, 2H), 6,67-6,72 (m, 2H), 5,86 (t, 1H), 4,72 (d, 2H); LCMS (M+H): 363,75
139	2-((2,4-Дифторфеніл)аміно)-1-(4-(5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл)феніл)етан-1-он	^1H -ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 8,25 (dd, 4H), 7,09-7,15 (m, 1H), 6,83-6,87 (m, 1H), 6,76 (td, 1H), 5,49 (s, 1H), 4,79 (d, 2H); LCMS (M+H) 384
140	2-((4-Хлор-3-(трифторметил)феніл)аміно)-1-(4-(5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл)феніл)етан-1-он	^1H -ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 8,17-8,31 (m, 5H), 7,37 (d, 1H), 7,21 (d, 1H), 6,98 (dd, 1H), 6,66 (t, 1H), 4,87 (t, 2H); LCMS (M+H) 450
141	1-(4-(5-(Трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл)феніл)-2-((3-(трифторметил)феніл)аміно)етан-1-он	^1H -ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 8,29 (dd, 2H), 8,24 (dd, 2H), 7,28 (t, 1H), 7,03 (s, 1H), 6,96-6,99 (m, 1H), 6,85 (d, 1H), 6,43 (t, 1H), 4,85 (d, 2H); LCMS (M+H): 415,95
143	2-((3-Фторфеніл)аміно)-1-(4-(5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл)феніл)етан-1-он	^1H -ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 8,28 (dd, 2H), 8,23 (dd, 2H), 7,04-7,10 (m, 1H), 6,50-6,56 (m, 2H), 6,30-6,34 (m, 1H), 6,26 (t, 1H), 4,77 (d, 2H); LCMS (M+H): 366
144	2-(м-Толіламіно)-1-(4-(5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл)феніл)етан-1-он	^1H -ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 8,26-8,29 (m, 2H), 8,21-8,24 (m, 2H), 6,95 (t, J=7,7 Гц, 1H), 6,48-6,51 (m, 2H), 6,39 (d, 1H), 5,78 (t, 1H), 4,72 (d, 2H), 2,18 (s, 3H); LCMS (M+H): 361,75
145	2-((4-Метоксифеніл)аміно)-1-(4-(5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл)феніл)етан-1-он	^1H -ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 8,26-8,28 (m, 2H), 8,21-8,23 (m, 2H), 6,70-6,74 (m, 2H), 6,62-6,67 (m, 2H), 5,50 (t, 1H), 4,68 (d, 2H), 3,63 (s, 3H); LCMS (M+H): 377,75
146	2-(o-Толіламіно)-1-(4-(5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл)феніл)етан-1-он	^1H -ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 8,29 (ddd, 4H), 7,01 (t, 2H), 6,54-6,58 (m, 2H), 5,18 (t, 1H), 4,79 (d, 2H), 2,18 (s, 3H); LCMS (M+H): 361,75
147	2-((2-Метоксифеніл)аміно)-1-(4-(5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл)феніл)етан-1-он	^1H -ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 8,28-8,31 (m, 2H), 8,23 (dd, 2H), 6,85 (dd, 1H), 6,78 (td, 1H), 6,64 (dd, 1H), 6,60 (td, 1H), 5,32 (t, 1H), 4,77 (d, 2H), 3,83-3,88 (m, 3H); LCMS (M+H) 377,8
148	4-Аміно-1-(2-оксо-2-(4-(5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл)феніл)етил)піridин-1-ію бромід	^1H -ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 8,30 (dd, 2H), 8,24 (dd, 2H), 7,62-7,65 (m, 2H), 7,23-7,27 (m, 2H), 7,16 (t, 1H), 6,96 (t, 1H), 6,82-6,84 (m, 1H), 6,72 (dd, 1H), 6,01 (t, 1H), 4,84 (d, 2H); LCMS (M+H) 441,95

Приклад 5. Одержання 2-((4-хлорфеніл)сульфініл)-1-(4-(5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл)феніл)етан-1-ону (сполука 78).

- 5 До перемішуваного розчину 2-((4-хлорфеніл)тіо)-1-(4-(5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл)феніл)етан-1-ону (0,2 г, 0,502 ммоль) в метанолі (6 мл) додавали водний (1 мл) розчин оксону (0,262 г, 0,426 ммоль) при 0 °C. Реакційну суміш перемішували протягом 30 хв. при 0 °C. Після завершення реакції реакційну суміш розводили етилацетатом (8 мл) і промивали водою (10 мл). Шар етилацетату висушували над безводним сульфатом натрію і концентрували при зниженому тиску з одержанням неочищеного продукту. Неочищений залишок очищали за допомогою колонкової хроматографії із застосуванням 15 % етилацетату в гексані як елюента на силікагелі 10 3 одержанням 2-((4-хлорфеніл)сульфініл)-1-(4-(5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-

іл)феніл)етан-1-ону (115 мг, 0,277 ммоль, вихід 55 %). ^1H -ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 8,15-8,20 (m, 4H), 7,76 (dt, 2H), 7,66 (dt, 2H), 4,91 (d, 1H), 4,80 (d, 1H); LCMS (M-1) 412,85.

Таблиця 5

Наступні сполуки одержували за допомогою процедури, аналогічної описаній у прикладі 5

№ сполуки	Назва згідно IUPAC	Аналітичні дані
79	2-((3,4-Дифторфеніл)сульфініл)-1-(4-(5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл)феніл)етан-1-он	^1H -ЯМР (400 МГц, DMSO-D6) δ 8,16-8,21 (m, 4H), 7,83-7,88 (m, 1H), 7,66-7,73 (m, 1H), 7,60-7,64 (m, 1H), 4,94 (d, 1H), 4,85 (d, 1H); LCMS (M-1): 414,80
80	2-(Бензилсульфініл)-1-(4-(5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл)феніл)етан-1-он	^1H -ЯМР (400 МГц, DMSO-D6) δ 8,19-8,25 (m, 4H), 7,33-7,42 (m, 5H), 4,71 (d, 1H), 4,60 (d, 1H), 4,35 (d, 1H), 4,16 (d, 1H); LCMS (M-1): 393
81	2-((4-Метоксибензил)сульфініл)-1-(4-(5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл)феніл)етан-1-он	^1H -ЯМР (400 МГц, DMSO-D6) δ 8,18-8,25 (m, 4H), 7,26-7,35 (m, 2H), 6,92-6,98 (m, 2H), 4,66 (d, 1H), 4,54 (d, 1H), 4,28 (d, 1H), 4,10 (d, 1H), 3,74 (s, 3H); LCMS (M-1): 422,85
82	2-((1-Фенілетил)сульфініл)-1-(4-(5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл)феніл)етан-1-он	^1H -ЯМР (400 МГц, DMSO-D6) δ 8,18-8,22 (m, 2H), 8,12-8,16 (m, 2H), 7,32-7,42 (m, 5H), 4,52 (d, 1H), 4,42 (d, 1H), 4,33 (q, 1H), 1,67 (dd, 3H); LCMS (M-1): 406,80
83	2-((5-Метилтіазол-2-іл)сульфініл)-1-(4-(5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл)феніл)етан-1-он	^1H -ЯМР (400 МГц, DMSO-D6) δ 8,16-8,21 (m, 4H), 7,69 (d, 1H), 5,11 (dd, 2H), 2,41 (dd, 3H); LCMS (M-1): 399,75
84	2-(Фенілсульфініл)-1-(4-(5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл)феніл)етан-1-он	^1H -ЯМР (400 МГц, DMSO-D6) δ 8,15-8,20 (m, 4H), 7,72-7,75 (m, 2H), 7,52-7,60 (m, 3H), 4,85 (d, 1H), 4,79 (d, 1H); LCMS (M-1): 378,85
85	1-(4-(5-(Трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл)феніл)-2-((3-(трифторметил)феніл)сульфініл)етан-1-он	^1H -ЯМР (400 МГц, DMSO-D6) δ 8,14-8,19 (m, 4H), 8,03-8,08 (m, 2H), 7,92 (dd, 1H), 7,82 (t, 1H), 4,99 (d, 1H), 4,90 (d, 1H); LCMS (M-1): 446,80
86	2-(п-Толілсульфініл)-1-(4-(5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл)феніл)етан-1-он	^1H -ЯМР (400 МГц, DMSO-D6) δ 8,14-8,20 (m, 4H), 7,61-7,63 (m, 2H), 7,38 (d, 2H), 4,78 (dd, 2H), 2,32-2,39 (m, 3H); LCMS (M-1): 392,80
87	2-((3-Фторфеніл)сульфініл)-1-(4-(5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл)феніл)етан-1-он	^1H -ЯМР (400 МГц, DMSO-D6) δ 8,16-8,21 (m, 4H), 7,57-7,66 (m, 3H), 7,37-7,41 (m, 1H), 4,92 (d, 1H), 4,84 (d, 1H); LCMS (M-1): 396,85
88	2-((2-Фторфеніл)сульфініл)-1-(4-(5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл)феніл)етан-1-он	^1H -ЯМР (400 МГц, DMSO-D6) δ 8,15-8,20 (m, 4H), 7,74 (td, 1H), 7,60-7,66 (m, 1H), 7,46 (td, 1H), 7,36-7,40 (m, 1H), 4,97 (d, 1H), 4,84 (d, 1H); LCMS (M-1): 396,85
89	2-(o-Толілсульфініл)-1-(4-(5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл)феніл)етан-1-он	^1H -ЯМР (400 МГц, DMSO-D6) δ 8,14-8,20 (m, 4H), 7,78 (dt, 1H), 7,41-7,46 (m, 2H), 7,29-7,32 (m, 1H), 4,81 (d, 1H), 4,66 (d, 1H), 2,38 (s, 3H); LCMS (M-1): 392,90
90	2-(m-Толілсульфініл)-1-(4-(5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл)феніл)етан-1-он	^1H -ЯМР (400 МГц, DMSO-D6) δ 8,15-8,20 (m, 4H), 7,55 (s, 1H), 7,51 (d, 1H), 7,45 (t, 1H), 7,34 (d, 1H), 4,79 (dd, 2H), 2,37 (d, 3H); LCMS (M-1): 392,90
91	2-(трет-Бутилсульфініл)-1-(4-(5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл)феніл)етан-1-он	^1H -ЯМР (400 МГц, DMSO-D6) δ 8,26 (s, 4H), 4,55 (d, 1H), 4,30 (d, 1H), 1,27 (s, 9H); LCMS (M-1): 359,05
92	1-(4-(5-(Трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл)феніл)-2-((4-(трифторметил)феніл)сульфініл)етан-1-он	^1H -ЯМР (400 МГц, DMSO-D6) δ 8,17-8,22 (m, 4H), 7,98 (s, 4H), 5,00 (d, 1H), 4,88 (d, 1H); LCMS (M-1): 446,95

Таблиця 5

Наступні сполуки одержували за допомогою процедури, аналогічної описаній у прикладі 5

№ сполуки	Назва згідно IUPAC	Аналітичні дані
93	2-(Ізопропілсульфініл)-1-(4-(5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл)феніл)етан-1-он	^1H -ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 8,24 (s, 4H), 4,64 (d, 1H), 4,50 (d, 1H), 3,02-3,09 (m, 1H), 1,24 (dd, 6H); LCMS (M+1) 347

Приклад 6. Одержання 2-((3-фторфеніл)сульфоніл)-1-(4-(5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл)феніл)етан-1-ону (сполука 105)

До перемішуваного розчину 2-((3-фторфеніл)тіо)-1-(4-(5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл)феніл)етан-1-ону (0,15 г, 0,39 ммоль) в суміші метанолу (8 мл) і води (2 мл) додавали оксон (0,482 г, 0,785 ммоль) при 0 °C. Одержану в результаті реакційну суміш додатково перемішували при 25 °C протягом 30 хв., а потім нагрівали при 60 °C протягом 3 год. Після завершення реакційну суміш гасили водою (50 мл) і тричі екстрагували етилацетатом (50 мл). Об'єднаний шар етилацетату промивали двічі сольовим розчином (25 мл), висушували над сульфатом натрію і випарювали при зниженому тиску до сухого стану з одержанням 2-((3-фторфеніл)сульфоніл)-1-(4-(5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл)феніл)етан-1-ону (120 мг, 0,29 ммоль, вихід 75 %). ^1H -ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 8,16-8,21 (m, 4H), 7,77-7,80 (m, 2H), 7,71 (td, 1H), 7,60-7,64 (m, 1H), 5,55 (s, 2H); LCMS (M-1): 412,95

Таблиця 6

Наступні сполуки одержували за допомогою процедури, аналогічної описаній у прикладі 6

№ сполуки	Назва згідно IUPAC	Аналітичні дані
94	2-((3,4-Дихлорфеніл)сульфоніл)-1-(4-(5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл)феніл)етан-1-он	^1H -ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 8,15-8,22 (m, 5H), 7,95 (d, 1H), 7,89 (dd, 1H), 5,62 (s, 2H); LCMS (M-1) 462,70
95	2-((4-Хлорфеніл)сульфоніл)-1-(4-(5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл)феніл)етан-1-он	^1H -ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 8,15-8,21 (m, 4H), 7,92-7,97 (m, 2H), 7,73 (dt, 2H), 5,51 (s, 2H); LCMS (M-1): 428,75
96	2-((3,4-Дифторфеніл)сульфоніл)-1-(4-(5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл)феніл)етан-1-он	^1H -ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 8,16-8,22 (m, 4H), 8,05-8,10 (m, 1H), 7,81-7,84 (m, 1H), 7,72-7,78 (m, 1H), 5,56 (s, 2H); LCMS (M-1): 430,80
97	2-(Бензилсульфоніл)-1-(4-(5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл)феніл)етан-1-он	^1H -ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 8,16-8,30 (m, 4H), 7,40-7,50 (m, 5H), 5,09 (s, 2H), 4,70 (d, 2H); LCMS (M-1): 409
98	2-((4-Метоксибензил)сульфоніл)-1-(4-(5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл)феніл)етан-1-он	^1H -ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 8,25 (d, 4H), 7,33-7,35 (m, 2H), 6,96-6,99 (m, 2H), 5,04 (s, 2H), 4,63 (d, 2H), 3,74 (d, 3H); LCMS (M-1): 438,80
99	2-((1-Фенілетил)сульфоніл)-1-(4-(5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл)феніл)етан-1-он	^1H -ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 8,15-8,23 (m, 4H), 7,37-7,56 (m, 5H), 4,96 (t, 2H), 4,81 (q, 1H), 1,65-1,72 (m, 3H); LCMS (M-1): 422,85
100	2-(Циклогексилсульфоніл)-1-(4-(5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл)феніл)етан-1-он	^1H -ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 8,15-8,35 (m, 4H), 5,11-5,28 (m, 2H), 3,32-3,35 (m, 1H), 3,26-3,32 (m, 1H), 2,11-2,17 (m, 2H), 1,84 (dd, 2H), 1,65 (d, 1H), 1,11-1,46 (m, 5H); LCMS (M-1): 400,95
101	2-((5-Метилтіазол-2-іл)сульфоніл)-1-(4-(5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл)феніл)етан-1-он	^1H -ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 8,16-8,21 (m, 4H), 7,86 (d, 1H), 5,70 (d, 2H), 2,41 (dd, 3H); LCMS (M-1): 415,80
102	2-(Фенілсульфоніл)-1-(4-(5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл)феніл)етан-1-он	^1H -ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 8,15-8,19 (m, 4H), 7,90-7,93 (m, 2H), 7,71-7,75 (m, 1H), 7,61-7,66 (m, 2H), 5,43 (s, 2H); LCMS (M-1): 394,80

Таблиця 6

Наступні сполуки одержували за допомогою процедури, аналогічної описаній у прикладі 6

№ сполуки	Назва згідно IUPAC	Аналітичні дані
103	1-(4-(5-(Трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл)феніл)-2-((3-(трифторметил)феніл)сульфоніл)етан-1-он	^1H -ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 8,24-8,26 (m, 2H), 8,13-8,20 (m, 5H), 7,91 (t, 1H), 5,65 (s, 2H); LCMS (M-1): 462,75
104	2-(о-Толілсульфоніл)-1-(4-(5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл)феніл)етан-1-он	^1H -ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 8,15-8,20 (m, 4H), 7,80 (dd, 1H), 7,61 (td, 1H), 7,40-7,46 (m, 2H), 5,34 (s, 2H), 2,67 (s, 3H); LCMS (M-1): 408,95
106	2-(Ізопропілсульфоніл)-1-(4-(5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл)феніл)етан-1-он	^1H -ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 8,23-8,28 (m, 4H), 5,14 (s, 2H), 3,49-3,56 (m, 1H), 1,30-1,34 (m, 6H); LCMS (M-1): 360,75
107	2-(Тіазол-2-ілсульфоніл)-1-(4-(5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл)феніл)етан-1-он	^1H -ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 8,30 (d, 1H), 8,14-8,22 (m, 5H), 5,70 (d, 2H); LCMS (M-1): 401,70
108	2-(трет-Бутилсульфоніл)-1-(4-(5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл)феніл)етан-1-он	^1H -ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 8,24 (s, 4H), 5,03 (s, 2H), 1,39 (s, 9H); LCMS (M-1): 374,80
109	1-(4-(5-(Трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл)феніл)-2-((4-(трифторметил)феніл)сульфоніл)етан-1-он	^1H -ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 8,18 (dd, 6H), 8,05 (d, 2H), 5,62 (s, 2H); LCMS (M-1): 462,85
110	2-(м-Толілсульфоніл)-1-(4-(5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл)феніл)етан-1-он	^1H -ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 8,14-8,19 (m, 4H), 7,68-7,72 (m, 2H), 7,49-7,55 (m, 2H), 5,39 (s, 2H), 2,38 (s, 3H); LCMS (M-1): 408,85
111	2-((2-Фторфеніл)сульфоніл)-1-(4-(5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл)феніл)етан-1-он	^1H -ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 8,20 (s, 4H), 7,79-7,86 (m, 2H), 7,50-7,55 (m, 1H), 7,44-7,48 (m, 1H), 5,46 (s, 2H); LCMS (M-1): 412,75
112	2-(Піридин-4-ілсульфоніл)-1-(4-(5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл)феніл)етан-1-он	^1H -ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 8,93 (dd, 2H), 8,16-8,22 (m, 4H), 7,91 (dd, 2H), 5,67 (s, 2H). LCMS (M-1): 395,85

Приклад 7. Одержання 2-((3-фторфеніл)тіо)-1-(5-(5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл)піridин-2-іл)етан-1-ону (сполука № 115)

а) Стадія 1. 6-(1-Етоксивініл)нікотинонітрил

До перемішуваного розчину 6-хлорнікотинонітрилу (15 г, 108 ммоль) у толуолі (120 мл) додавали (1-етоксивініл)трибутилстанан (40 мл, 119 ммоль) і біс(трифенілфосфін)паладію(II) дихлорид (3,8 г, 5,4 ммоль) при 25 °C. Реакційну суміш дегазували за допомогою азоту протягом 15 хв. і потім реакційну суміш нагрівали при 80 °C протягом 16 год. Реакційну суміш фільтрували через подушку з целіту та фільтрат концентрували при зниженому тиску з одержанням неочищеного продукту. Неочищений продукт очищали за допомогою колонкової хроматографії на силікагелі із застосуванням як елюента 10 % етилацетату в гексані з одержанням 6-(1-етоксивініл)нікотинонітрилу (16 г, вихід 87 %).

б) Стадія-2. 6-(1-Етоксивініл)-N'-гідроксинікотинімідамід

До перемішуваного розчину 6-(1-етоксивініл)нікотинонітрилу (16 г, 95 ммоль) в етанолі (120 мл) додавали гідроксиламін (7 мл, 114 ммоль) при 25 °C. Потім реакційну суміш перемішували при 25 °C протягом 12 год. Реакційну суміш концентрували при зниженному тиску з одержанням 6-(1-етоксивініл)-N'-гідроксинікотинімідаміду (19 г, вихід 98 %).

с) Стадія-3. 3-(6-(1-Етоксивініл)піridin-3-іл)-5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол

До перемішуваного розчину 6-(1-етоксивініл)-N'-гідроксинікотинімідаміду (18 г, 87 ммоль) у тетрагідрофурані (160 мл) повільно додавали триетиламін (15 мл, 104 ммоль) при 0 °C, потім повільно додавали трифтороцтовий ангідрид (15 мл, 104 ммоль) при 0 °C. Забезпечували перемішування реакційної суміші протягом 12 год. при 25 °C. Після закінчення реакції реакційну суміш розбавляли етилацетатом (200 мл) і двічі промивали насиченим розчином бікарбонату натрію (200 мл); органічний шар відділяли, висушували над безводним сульфатом натрію,

- концентрували при зниженому тиску з одержанням неочищеного продукту. Неочищений продукт очищали за допомогою колонкової хроматографії на силікагелі із застосуванням як елюента 15 % етилацетату у гексані з одержанням 3-(6-(1-етоксивініл)піридин-3-іл)-5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазолу (11 г, 40 ммоль, вихід 46%).
- 5 d) Стадія-4. 2-Бром-1-(5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл)піридин-2-іл)етан-1-он
До перемішуваного розчину 3-(6-(1-етоксивініл)піридин-3-іл)-5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазолу (11 г, 38,6 ммоль) у тетрагідрофурані (100 мл) повільно додавали воду (4 мл), N-бромсукцинімід (5,8 г, 33 ммоль) при 0 °C, забезпечували перемішування реакційної суміші протягом 2 год. при 25 °C. Після закінчення реакції реакційну суміш розбавляли етилацетатом (200 мл) і промивали водою (200 мл), органічний шар відділяли, висушували над безводним сульфатом натрію, концентрували при зниженному тиску з одержанням неочищеного продукту. Неочищений продукт очищали за допомогою колонкової хроматографії на силікагелі із застосуванням як елюента 10 % етилацетату у гексані з одержанням 2-бром-1-(5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл)піридин-2-іл)етан-1-ону (8 г, 24 ммоль, вихід 63 %).
- 10 e) Стадія-6. 2-((3-Фторфеніл)тіо)-1-(5-(5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл)піридин-2-іл)етан-1-он
До перемішуваного розчину 3-фторбензолтіолу (0,06 мл, 0,71 ммоль) в ацетонітрилі (8 мл) додавали карбонат калію (0,1 г, 0,7 ммоль) при 25 °C, потім додавали 2-бром-1-(5-(5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл)піридин-2-іл)етан-1-он (0,2 г, 0,6 ммоль) при 25 °C. Реакційну суміш перемішували при 25 °C протягом 4 год. Після закінчення реакції реакційну суміш розбавляли дихлорметаном (20 мл) і двічі промивали водою (20 мл), висушували над безводним сульфатом натрію та концентрували при зниженному тиску з одержанням неочищеного продукту. Неочищений продукт очищали за допомогою препаративної HPLC із одержанням 2-((3-фторфеніл)тіо)-1-(5-(5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл)піридин-2-іл)етан-1-ону (65 мг, вихід 28 %).

Таблиця 7

Наступні сполуки одержували за допомогою аналогічної процедури, описаної у прикладі 7

№ сполуки	Назва згідно IUPAC	Аналітичні дані
115	2-((3-Фторфеніл)тіо)-1-(5-(5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл)піридин-2-іл)етан-1-он	¹ Н-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 9,36 (q, 1H), 8,65 (dd, 1H), 8,20 (dd, 1H), 7,34 (td, 1H), 7,26 (dt, 1H), 7,18 (dq, 1H), 7,05-6,99 (m, 1H), 4,80 (s, 2H); LCMS (M+1): 383,95
116	2-((4-Метоксифеніл)тіо)-1-(5-(5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл)піридин-2-іл)етан-1-он	¹ Н-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 9,31 (q, 1H), 8,64 (dd, 1H), 8,17 (dd, 1H), 7,35-7,31 (m, 2H), 6,91-6,87 (m, 2H), 4,49 (s, 2H), 3,78-3,73 (m, 3H); LCMS (M+1): 396,00
117	2-((4-Метоксибензил)тіо)-1-(5-(5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл)піридин-2-іл)етан-1-он	¹ Н-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 9,33 (q, 1H), 8,65 (dd, 1H), 8,22 (dd, 1H), 7,26-7,22 (m, 2H), 6,88-6,84 (m, 2H), 3,97 (s, 2H), 3,72-3,69 (m, 5H); LCMS (M+1): 409,75
118	2-(Бензилтіо)-1-(5-(5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл)піридин-2-іл)етан-1-он	¹ Н-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 9,33 (q, 1H), 8,65 (dd, 1H), 8,22 (dd, 1H), 7,35-7,22 (m, 5H), 3,99 (s, 2H), 3,76 (s, 2H); LCMS (M+1): 379,95
119	2-(Цикlopентилтіо)-1-(5-(5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл)піридин-2-іл)етан-1-он	¹ Н-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 9,33 (q, 1H), 8,64 (dd, 1H), 8,22 (dd, 1H), 4,11 (s, 2H), 3,16-3,10 (m, 1H), 1,99-1,91 (m, 2H), 1,69-1,59 (m, 2H), 1,58-1,47 (m, 2H), 1,45-1,37 (m, 2H); LCMS (M+1): 357,70
120	2-((2,6-Дихлорфеніл)тіо)-1-(5-(5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл)піридин-2-іл)етан-1-он	¹ Н-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 9,23 (q, 1H), 8,64 (dd, 1H), 8,18 (dd, 1H), 7,56 (dd, 2H), 7,42 (dd, 1H), 4,47 (s, 2H); LCMS (M+1): 435,65
121	2-(Бензо[д]оксазол-2-ілтіо)-1-(5-(5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл)піридин-2-іл)етан-1-он	¹ Н-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 9,43 (q, 1H), 8,69 (dd, 1H), 8,24 (dd, 1H), 7,67-7,56 (m, 2H), 7,33-7,29 (m, 2H), 5,28 (d, 2H); LCMS (M+1): 406,70

Таблиця 7

Наступні сполуки одержували за допомогою аналогічної процедури, описаної у прикладі 7

№ сполуки	Назва згідно IUPAC	Аналітичні дані
122	2-((4-(Трифторметокси)феніл)тіо)-1-(5-(5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл)піridин-2-іл)етан-1-он	^1H -ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 9,34 (q, 1H), 8,65 (dd, 1H), 8,19 (dd, 1H), 7,51-7,48 (m, 2H), 7,31 (dd, 2H), 4,77 (s, 2H); LCMS (M-1): 447,90
123	2-((4-Метоксифеніл)сульфоніл)-1-(5-(5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл)піridин-2-іл)етан-1-он	^1H -ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 9,26 (q, 1H), 8,63 (dd, 1H), 8,15 (dd, 1H), 7,82-7,78 (m, 2H), 7,13-7,09 (m, 2H), 5,35 (s, 2H), 3,83 (s, 3H); LCMS (M+1): 428,05
124	2-((4-Метоксибензил)сульфоніл)-1-(5-(5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл)піridин-2-іл)етан-1-он	^1H -ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 9,39 (q, 1H), 8,69 (dd, 1H), 8,26 (dd, 1H), 7,36-7,27 (m, 2H), 6,98-6,92 (m, 2H), 5,10 (s, 2H), 4,62 (d, 2H), 3,75 (d, 3H); LCMS (M-1): 439,75
125	2-(Бензилсульфоніл)-1-(5-(5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл)піridин-2-іл)етан-1-он	^1H -ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 9,38 (dq, 1H), 8,70-8,65 (m, 1H), 8,28-8,20 (m, 1H), 7,45-7,37 (m, 5H), 5,13 (d, 2H), 4,79-4,63 (m, 2H); LCMS (M-1): 409,75
126	2-(Цикlopентилсульфоніл)-1-(5-(5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл)піridин-2-іл)етан-1-он	^1H -ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 9,41 (q, 1H), 8,68 (dd, 1H), 8,26 (dd, 1H), 5,16 (s, 2H), 3,91-3,83 (m, 1H), 2,02-1,90 (m, 4H), 1,58-1,67 (m, 4H); LCMS (M-1): 387,90
127	2-((3-Фторфеніл)сульфоніл)-1-(5-(5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл)піridин-2-іл)етан-1-он	^1H -ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 9,29 (q, 1H), 8,64 (dd, 1H), 8,17 (dd, 1H), 7,80-7,76 (m, 2H), 7,73-7,68 (m, 1H), 7,65-7,59 (m, 1H), 5,53 (s, 2H); LCMS (M-1): 413,70
128	2-((3-Фторфеніл)сульфініл)-1-(5-(5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл)піridин-2-іл)етан-1-он	^1H -ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 9,29 (q, 1H), 8,64 (dd, 1H), 8,18 (dd, 1H), 7,65-7,55 (m, 3H), 7,40-7,35 (m, 1H), 4,90 (dd, 2H); LCMS (M+1): 399,70
129	2-((4-Метоксифеніл)сульфініл)-1-(5-(5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл)піridин-2-іл)етан-1-он	^1H -ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 9,29 (q, 1H), 8,62 (dd, 1H), 8,14 (dd, 1H), 7,65-7,61 (m, 2H), 7,09 (dt, 2H), 4,86 (d, 1H), 4,75 (d, 1H), 3,78 (s, 3H); LCMS (M+1): 411,95
130	2-((4-Метоксибензил)сульфініл)-1-(5-(5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл)піridин-2-іл)етан-1-он	^1H -ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 9,36 (q, 1H), 8,66 (dd, 1H), 8,20 (dd, 1H), 7,29-7,27 (m, 2H), 6,93 (dd, 2H), 4,73 (d, 1H), 4,59 (d, 1H), 4,29 (d, 1H), 4,12 (d, 1H), 3,75 (s, 3H); LCMS (M+1): 425,95
131	2-(Бензилсульфініл)-1-(5-(5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл)піridин-2-іл)етан-1-он	^1H -ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 9,36 (q, 1H), 8,67 (dd, 1H), 8,21 (dd, 1H), 7,40-7,34 (m, 5H), 4,77 (d, 1H), 4,64 (d, 1H), 4,36 (d, 1H), 4,19 (d, 1H); LCMS (M+1): 396,05
132	2-((2,6-Дихлорфеніл)сульфініл)-1-(5-(5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл)піridин-2-іл)етан-1-он	^1H -ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 9,32 (q, 1H), 8,65 (dd, 1H), 8,19 (dd, 1H), 7,59-7,52 (m, 3H), 5,50 (d, 1H), 5,16 (d, 1H); LCMS (M-1): 449,50
133	2-(Цикlopентилсульфініл)-1-(5-(5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл)піridин-2-іл)етан-1-он	^1H -ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 9,38 (q, 1H), 8,67 (dd, 1H), 8,23 (dd, 1H), 4,71 (d, 1H), 4,55 (d, 1H), 3,41-3,34 (m, 1H), 2,06-1,85 (m, 3H), 1,65-1,57 (m, 5H); LCMS (M-1): 372,00

Приклад 8. Одержання 2-(2-фторфенокси)-1-(5-(5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл)піridин-2-іл)етан-1-ону (сполука 114)

5 До перемішуваного розчину 2-фторфенолу (0,08 г, 0,71 ммоль) в ацетонітрілі (8 мл) в атмосфері азоту додавали карбонат калію (0,18 г, 1,3 ммоль) при 0 °C. Реакційну суміш перемішували протягом 15 хв. при 0 °C, потім додавали 2-бром-1-(5-(5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл)піridин-2-іл)етан-1-он (0,2 г, 0,6 ммоль) при 0 °C. Забезпечували перемішування реакційної суміші протягом 4 год. при 25 °C. Після закінчення реакції реакційну суміш розбавляли етилацетатом (10 мл) і промивали водою (20 мл). Органічний шар

5 висушували над безводним сульфатом натрію; розчинник випарювали при зниженому тиску з одержанням неочищеного продукту. Неочищений продукт очищали за допомогою 10 препаративної HPLC з одержанням 2-(2-фторфенокси)-1-(5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл)піридин-2-іл)етан-1-ону (55 мг, вихід 25 %). ^1H -ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 9,37 (t, 1H), 8,68 (dd, 1H), 8,19 (d, 1H), 7,26-7,20 (m, 1H), 7,14 (td, 1H), 7,06 (t, 1H), 6,97-6,92 (m, 1H), 5,85 (s, 2H); LCMS (M+1): 367,95.

Приклад 9. Одержання 2-((2-фторфеніл)аміно)-1-(5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл)піридин-2-іл)етан-1-ону (сполука 153)

10 До розчину 2-бром-1-(5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл)піридин-2-іл)етан-1-ону (0,35 г, 1,04 ммоль) в етанолі (8 мл) додавали бікарбонат натрію (0,17 г, 2,08 ммоль) і 2-фторанілін (0,14 г, 1,25 ммоль) при 25 °C, реакційну суміш перемішували при 25 °C протягом 12 год. Після закінчення реакції реакційну суміш розбавляли етилацетатом (25 мл) і промивали 15 водою (30 мл); органічний шар відділяли, висушували над безводним сульфатом натрію, концентрували при зниженному тиску з одержанням неочищеного продукту. Неочищений продукт очищали за допомогою колонкової флеши-хроматографії на силікагелі із застосуванням як елюента 10 % етилацетату у гексані з одержанням 2-((2-фторфеніл)аміно)-1-(5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл)піридин-2-іл)етан-1-ону (60 мг, 0,164 ммоль, вихід 16 %). ^1H -ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 9,39 (q, 1H), 8,67 (dd, 1H), 8,19 (dd, 1H), 7,05 (ddd, 1H), 6,93 (t, 1H), 6,70-6,66 (m, 1H), 6,61-6,55 (m, 1H), 5,59-5,56 (m, 1H), 4,92 (d, 2H); LCMS (M+1): 366,85.

20 Приклад 10. Одержання N-(2-оксо-2-(4-(5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл)феніл)етил)бензолсульфонаміду (сполука 77)

25 До перемішуваного розчину бензолсульфоногідразиду (0,2 г, 1,15 ммоль) у метанолі (5 мл) додавали 3-бромобензальдегід (0,135 мл, 1,15 ммоль). Реакційну суміш перемішували при 65 °C протягом 2 год. Реакційну суміш концентрували при зниженному тиску з одержанням 30 неочищеного продукту, потім неочищенну сполуку розчиняли в ацетонітрилі (5 мл), додавали 2-бром-1-(4-(5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл)феніл)етан-1-он (0,35 г, 1,04 ммоль), карбонат цезію (0,034 г, 0,104 ммоль), потім реакційну суміш перемішували при 25 °C протягом 30 хв. Реакційну суміш розбавляли етилацетатом (25 мл) і промивали водою (20 мл), висушували над безводним сульфатом натрію та концентрували при зниженному тиску з одержанням неочищеного продукту. Неочищений продукт очищали за допомогою колонкової флеши-хроматографії на силікагелі із застосуванням як елюента 30 % етилацетату в гексані з одержанням

35 N-(2-оксо-2-(4-(5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл)феніл)етил)бензолсульфонаміду (67 мг, 0,16 ммоль, вихід 16 %). ^1H -ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 8,10-8,19 (m, 5H), 7,84 (dt, J=6,6, 1,7 Гц, 2H), 7,55-7,65 (m, 3H), 4,54 (d, J=5,6 Гц, 2H); LCMS (M-1): 409,85.

Таблиця 8

Наступні сполуки одержували за допомогою аналогічної процедури, описаної у прикладі 10

№ сполуки	Назва згідно IUPAC	Аналітичні дані
134	4-Метил-N-(2-оксо-2-(4-(5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл)феніл)етил)бензолсульфонамід	^1H -ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 8,17 (dd, J=6,8, 2,0 Гц, 2H), 8,11 (dd, J=6,7, 2,1 Гц, 2H), 8,05 (t, J=5,7 Гц, 1H), 7,72 (dd, J=6,5, 1,8 Гц, 2H), 7,36-7,38 (m, 2H), 4,49 (d, J=5,9 Гц, 2H), 2,37 (s, 3H); LCMS (M-1): 425,95

40 Приклад 11. Одержання 2-гідрокси-1-(4-(5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл)феніл)етан-1-ону (сполука 154)

a) Стадія-1. N'-Гідрокси-4-вінілбензимідамід

45 До перемішуваного розчину 4-вінілбензонітрилу (10 г, 77 ммоль) і етанолу (200 мл) додавали 50 % водний розчин гідроксиламіну (4,74 мл, 77 ммоль) при 0 °C. Одержану в результатах реакційну суміш перемішували при 65 °C протягом 12 год. Після закінчення реакції реакційну суміш концентрували при зниженному тиску з одержанням гідрокси-4-вінілбензимідаміду (10,5 г, вихід 84 %).

b) Стадія-2. 5-(Трифторметил)-3-(4-вінілфеніл)-1,2,4-оксадіазол

До перемішуваного розчину гідрокси-4-вінілбензимідаміду (10,5 г, 64,7 ммоль) та тетрагідрофурану (100 мл) додавали трифторметиловий ангідрид (13,5 мл, 97 ммоль) при 0 °C і перемішували при 25 °C протягом 12 год. Реакційну суміш розбавляли етилацетатом (150 мл) і

двічі промивали розчином бікарбонату натрію (40 мл). Органічний шар висушували над безводним сульфатом натрію та концентрували при зниженному тиску з одержанням 5-(трифторметил)-3-(4-вінілфеніл)-1,2,4-оксадіазолу (11,6 г, вихід 75 %).

с) Стадія-3. 3-(4-(Оксиран-2-іл)феніл)-5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол

До перемішуваного розчину 5-(трифторметил)-3-(4-вінілфеніл)-1,2,4-оксадіазолу (12 г, 50 ммоль) і дихлорметану (150 мл) додавали 3-хлорпероксибензойну кислоту (33,2 г, 125 ммоль) при 25 °C протягом 12 год. Після закінчення реакції реакційну суміш концентрували при зниженному тиску, розбавляли гексаном (80 мл) і фільтрували. Органічний шар двічі промивали 10 % розчином гідроксиду натрію (50 мл) і органічний шар висушували над безводним сульфатом натрію та концентрували при зниженному тиску з одержанням 3-(4-(оксиран-2-іл)феніл)-5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазолу (10,5 г, вихід 91 %).

д) Стадія-5. 1-(4-(5-(Трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл)феніл)етан-1,2-діол

До перемішуваного розчину 3-(4-(оксиран-2-іл)феніл)-5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазолу (0,3 г, 1,171 ммоль) і води (20 мл) додавали нітрат церію-амонію (0,128 г, 0,234 ммоль) при 25 °C. Одержану в результаті реакційну суміш перемішували протягом 6 год. при 25 °C. Після закінчення реакції реакційну суміш розбавляли етилацетатом (50 мл) і промивали водою (50 мл). Шар етилацетату висушували над безводним сульфатом натрію та концентрували при зниженному тиску. Неочищений залишок очищали а допомогою розтирання із застосуванням гексану (100 мл) з одержанням 1-(4-(5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл)феніл)етан-1,2-діолу (0,25 г, вихід 92 %).

е) Стадія 6. 2-гідрокси-1-(4-(5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл)феніл)етан-1-он

До перемішуваного розчину 1-(4-(5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл)феніл)етан-1,2-діолу (0,5 г, 1,823 ммоль) в ацетонітролі (5 мл) і воді (5 мл) додавали бромід натрію (0,375 г, 3,65 ммоль) та оксон (1,121 г, 1,823 ммоль) при 0 °C в атмосфері азоту. Одержану в результаті реакційну суміш перемішували протягом 6 год. при 25 °C. Після закінчення реакції реакційну суміш розбавляли етилацетатом (10 мл) і промивали розчином тіосульфату натрію (80 мл) (10 мл). Шар етилацетату висушували над безводним сульфатом натрію та концентрували при зниженному тиску. Неочищений залишок очищали за допомогою колонкової хроматографії із застосуванням 18 % етилацетату у гексані як елюента на силікагелі з одержанням 2-гідрокси-1-(4-(5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл)феніл)етан-1-ону. (0,20 г, вихід 40 %). ¹H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ 8,19-8,23 (d, 2H), 8,13 (d, 2H), 5,23 (t, 1H), 4,84 (d, 2H); LCMS (M-1): 270,75.

БІОЛОГІЧНІ ПРИКЛАДИ

Як описано в даному документі, сполуки загальної формули (I) демонструють фунгіцидні активності, які вони надають щодо багатьох фітопатогенних грибів, які уражають важливі сільськогосподарські культури. Сполуки за даним винаходом оцінювали щодо їхньої активності, як описано в наступних випробуваннях.

Приклади біологічних випробувань щодо грибкових патогенів

Приклад 1. *Rugularia oryzae* (пірикуляріоз рису)

Сполуки розчиняли в 0,3 % розчині диметилсульфоксиду і потім додавали у картопляно-декстрозне агарове середовище безпосередньо перед його розподілом у чашки Петрі. Розподіляли 5 мл середовища зі сполукою у потрібній концентрації в 60-мм стерильні чашки Петрі. Після затвердіння середовища кожен планшет засівали міцеліальним диском розміром 5 мм, взятим із периферійної зони планшета з вірулентною культурою, що активно зростає. Планшети інкубували в камерах для зростання за температури 25 °C і відносної вологості 60 % протягом семи днів, а потім радіальний ріст вимірювали та порівнювали з таким у необробленого контролю. Сполуки 49 66 69 70 71 73 80 83 91 106 110 112 114 118 119 128 133 145 148 149 150 при 300 ppm забезпечували мінімум 70 % контролю в таких випробуваннях порівняно з необробленим контролем, який демонстрував значне поширення хвороби.

Приклад 2. *Botrytis cinerea* (сіра пліснява)

Сполуки розчиняли в 0,3 % розчині диметилсульфоксиду і потім додавали у картопляно-декстрозне агарове середовище безпосередньо перед його розподілом у чашки Петрі. Розподіляли 5 мл середовища зі сполукою у потрібній концентрації в 60-мм стерильні чашки Петрі. Після затвердіння середовища кожен планшет засівали міцеліальним диском розміром 5 мм, взятим із периферійної зони планшета з вірулентною культурою, що активно зростає. Планшети інкубували в камерах для зростання за температури 22 °C і відносної вологості 90 % протягом семи днів, а потім радіальний ріст вимірювали та порівнювали з таким у необробленого контролю. Сполука 114 при 300 ppm забезпечувала мінімум 70 % контролю в таких випробуваннях порівняно з необробленим контролем, який демонстрував значний розвиток хвороби.

Приклад 3. *Alternaria solani* (альтернаріоз томату/картоплі)

Сполуки розчиняли в 0,3 % розчині диметилсульфоксиду і потім додавали у картопляно-декстрозне агарове середовище безпосередньо перед його розподілом у чашки Петрі. Розподіляли 5 мл середовища зі сполукою у потрібній концентрації в 60-мм стерильні чашки Петрі. Після затвердіння середовища кожен планшет засівали міцеліальним диском розміром 5 мм, взятим із периферійної зони планшета з вірулентною культурою, що активно зростає. Планшети інкубували в камерах для зростання за температури 25 °C і відносної вологості 60 % протягом семи днів, а потім радіальний ріст вимірювали та порівнювали з таким у необрбленим контролем. Сполуки 17 18 21 27 39 61 68 69 80 91 112 119 128 132 133 135 140 149 150 при 300 ppm забезпечували мінімум 70 % контролю в таких випробуваннях порівняно з необрбленим контролем, який демонстрував значний розвиток хвороби.

Приклад 4. *Colletotrichum capsici* (антракноз)

Сполуки розчиняли в 0,3 % розчині диметилсульфоксиду і потім додавали у картопляно-декстрозне агарове середовище безпосередньо перед його розподілом у чашки Петрі. Розподіляли 5 мл середовища зі сполукою у потрібній концентрації в 60-мм стерильні чашки Петрі. Після затвердіння середовища кожен планшет засівали міцеліальним диском розміром 5 мм, взятим із периферійної зони планшета з вірулентною культурою, що активно зростає. Планшети інкубували в камерах для зростання за температури 25 °C і відносної вологості 60 % протягом семи днів, а потім радіальний ріст вимірювали та порівнювали з таким у необрбленим контролем. Сполуки 15 107 129 135 141 144 145 146 149 при 300 ppm забезпечували мінімум 70 % контролю в таких випробуваннях порівняно з необрбленим контролем, який демонстрував значний розвиток хвороби.

Приклад 5. *Septoria lycopersici / Corynespora cassicola* (пламистість листів томата)

Сполуки розчиняли в 0,3 % розчині диметилсульфоксиду і потім додавали у картопляно-декстрозне агарове середовище безпосередньо перед його розподілом у чашки Петрі. Розподіляли 5 мл середовища зі сполукою у потрібній концентрації в 60-мм стерильні чашки Петрі. Після затвердіння середовища кожен планшет засівали міцеліальним диском розміром 5 мм, взятим із периферійної зони планшета з вірулентною культурою, що активно зростає. Планшети інкубували в камерах для зростання за температури 25 °C і відносної вологості 70 % протягом семи днів, а потім радіальний ріст вимірювали та порівнювали з таким у необрбленим контролем. Сполуки 68 і 150 при 300 ppm забезпечували мінімум 70 % контролю в таких випробуваннях порівняно з необрбленим контролем, який демонстрував значний розвиток хвороби.

Приклад 6. *Fusarium cultorum* (прикоренева гниль злакових)

Сполуки розчиняли в 0,3 % розчині диметилсульфоксиду і потім додавали у картопляно-декстрозне агарове середовище безпосередньо перед його розподілом у чашки Петрі. Розподіляли 5 мл середовища зі сполукою у потрібній концентрації в 60-мм стерильні чашки Петрі. Після затвердіння середовища кожен планшет засівали міцеліальним диском розміром 5 мм, взятим із периферійної зони планшета з вірулентною культурою, що активно зростає. Планшети інкубували в камерах для зростання за температури 25 °C і відносної вологості 60 % протягом семи днів, а потім радіальний ріст вимірювали та порівнювали з таким у необрбленим контролем. Сполука 140 при 300 ppm забезпечувала мінімум 70 % контролю в таких випробуваннях порівняно з необрбленим контролем, який демонстрував значний розвиток хвороби.

Приклад 7. Випробування сої щодо *Phakopsora pachyrhizi*

Сполуки розчиняли в 2 % диметилсульфоксиді/ацетоні, а потім змішували з водою, що містила емульгатор, до точного об'єму для розпилення, що становив 50 мл. Виливали 50 мл цього розчину для розпилення у пульверизатори для подальших видів застосування.

Для випробування попереджувальної активності сполук здорові молоді роспини сої, вирощені в теплиці, обприскували складом активної сполуки у вказаних нормах застосування всередині розпилювальних камер із використанням сопел із порожнім конусом. Через один день після обробки рослини інокулювали суспензією спор, що містила 2×10^5 *Phakopsora pachyrhizi* conidia. Потім заражені рослини поміщали в камеру-теплицю з температурою 22-24 °C і відносною вологістю 80-90 % для прояву захворювання.

Візуальну оцінку ефективності сполук здійснювали шляхом оцінювання тяжкості хвороби (шкала 0-100 %) на прикладі оброблених рослин через 3, 7, 10 і 15 днів після застосування. Ефективність (%) контролю) сполук розраховували шляхом порівняння ступеня хвороби в оброблених рослин із таким у необрбленим контролем. Обпилені рослини також оцінювали щодо сумісності рослин шляхом реєстрування симптомів, таких як некроз, хлороз і низькорослість. Сполуки 1 2 3 4 5 6 9 10 11 12 13 14 15 16 17 18 19 20 21 22 23 24 25 26 27 28 29

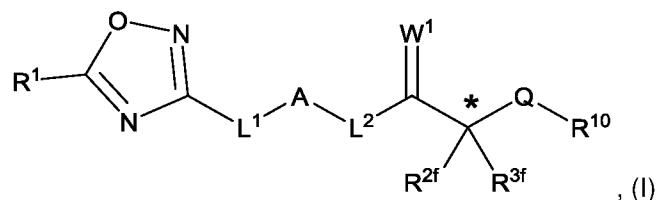
33 34 35 36 40 41 42 44 45 46 47 49 50 52 53 54 56 57 58 60 63 64 65 66 67 78 82 83 84 85 86 87 88 94 95 96 98 100 103 135 136 при 500 ppm забезпечували мінімум 70 % контролю в таких випробуваннях порівняно з необробленим контролем, який демонстрував значний розвиток хвороби.

5 За наявності опису даного винаходу з посиланням на певні переважні аспекти фахівцю в даній галузі техніки стануть очевидними й інші аспекти з урахуванням специфікації. Для фахівців у даній галузі техніки буде очевидним, що багато модифікацій, як щодо матеріалів, так і щодо способів, можуть бути здійснені на практиці без відступу від обсягу даного винаходу.

10

ФОРМУЛА ВИНАХОДУ

1. Сполука формули (I):



15

де

R¹ являє собою C₁-C₂-галогеналкіл;

L¹ являє собою прямий зв'язок, -CR²R³-, -C(=W¹)-, -O-, -S(=O)₀₋₂- і -NR^{4a}- , де знак "-" на початку та в кінці групи позначає точку приєднання або до оксадіазольного кільця, або до А;

20

L² являє собою прямий зв'язок або -(CR^{2a}R^{3a})₁₋₃-;

А являє собою ароматичне карбоциклічне кільце, де гетероатоми ароматичного гетероциклічного кільця вибрані з N, O і S; і кільце А необов'язково заміщене однією або більше ідентичними або різними групами R^A;

25

R^A вибраний із групи, що складається з водню, галогену, ціано, нітро, аміно, гідрокси, SF₅, C₁-C₆-алкілу, C₂-C₆-алкенілу, C₂-C₆-алкінілу, C₃-C₈-циклоалкілу, C₃-C₈-циклоалкілалкілу, C₁-C₆-галогеналкілу, C₁-C₆-алкоксі-C₁-C₄-алкілу, C₁-C₆-гідроксіалкілу, C₂-C₆-галогеналкенілу, C₂-C₆-галогеналкінілу, C₃-C₈-галогенциклоалкілу, C₁-C₆-алкокси, C₁-C₆-галогеналкокси, C₁-C₆-галогеналкоксикарбонілу, C₁-C₆-алкілтіо, C₁-C₆-галогеналкілтіо, C₁-C₆-галогеналкілсульфінілу, C₁-C₆-галогеналкілсульфонілу, C₁-C₆-алкілсульфінілу, C₁-C₆-алкіламіно,

30

C₁-C₆-діалкіламіно, C₃-C₈-циклоалкіламіно, C₁-C₆-алкіл-C₃-C₈-циклоалкіламіно, C₁-C₆-алкілкарбонілу, C₁-C₆-алкоксикарбонілу, C₁-C₆-алкіламінокарбонілу, C₁-C₆-діалкіламінокарбонілу, C₁-C₆-алкоксикарбонілокси, C₁-C₆-алкіламінокарбонілокси, C₁-C₆-діалкіламінокарбонілокси, 5-11-членного спіроциклічного кільца і 3-6-членного карбоциклічного або гетероциклічного кільца;

35

де 5-11-членне спіроциклічне кільце і 3-6-членне карбоциклічне або гетероциклічне кільце можуть бути необов'язково заміщені одним або більше ідентичними або різними замісниками, вибраними із групи, що складається з галогену, ціано, нітро, гідрокси, C₁-C₆-алкілу, C₂-C₆-алкенілу, C₂-C₆-алкінілу, C₃-C₈-циклоалкілу, C₃-C₈-циклоалкілалкілу, C₁-C₆-алкоксіалкілу, C₁-C₆-гідроксіалкілу, C₂-C₆-галогеналкенілу, C₂-C₆-галогеналкінілу, C₃-C₆-

40

галогенциклоалкілу, C₁-C₆-алкокси, C₁-C₆-алкілтіо, C₁-C₆-галогеналкілтіо, C₁-C₆-галогеналкілсульфінілу, C₁-C₆-галогеналкілсульфонілу, C₁-C₆-алкілсульфінілу, C₁-C₆-алкілсульфонілу, C₁-C₆-алкіламіно, C₃-C₆-циклоалкіламіно, C₁-C₆-алкіл-C₃-C₆-циклоалкіламіно, C₁-C₆-алкілкарбонілу, C₁-C₆-алкоксикарбонілу, C₁-C₆-алкіламінокарбонілу, ді-C₁-C₆-алкіламінокарбонілу, C₁-C₆-алкоксикарбонілокси, C₁-C₆-алкіламінокарбонілокси і ді-C₁-C₆-алкіламінокарбонілокси; або

45

два R^A разом із атомами, до яких вони приєднані, можуть утворювати 3-10-членні ароматичні або неароматичні карбоциклічні кільца або систему кілець, або ароматичні або неароматичні гетероциклічні кільца або систему кілець; де вказане кільце або система кілець можуть бути необов'язково заміщені однією або більше ідентичними або різними групами R^a, вибраними із групи, що складається з галогену, ціано, нітро, C₁-C₆-алкілу, C₁-C₆-галогеналкілу, C₁-C₆-алкокси, C₁-C₆-галогеналкокси, C₁-C₆-алкілтіо, C₁-C₆-галогеналкілтіо, C₃-C₈-циклоалкілу, C₁-C₆-алкоксі-C₁-C₄-алкілу, C₃-C₈-галогенциклоалкілу, C₁-C₆-алкіламіно, ді-C₁-C₆-алкіламіно і C₃-C₈-циклоалкіламіно;

50

де один або більше атомів С неароматичного карбоциклічного кільца можуть бути необов'язково заміщені C(=O), C(=S), C(=CR^{2b}R^{3b}) і C=N R^{6a};

55

де гетероатом ароматичного гетероциклічного кільця вибраний із N, O і S; де гетероатом неароматичного гетероциклічного кільця вибраний із N, O, S(=O)₀₋₂ і S(=O)₀₋₁(=NR^{6a}), і один або більше атомів С неароматичного гетероциклічного кільця можуть бути необов'язково заміщені C(=O), C(=S), C(=CR^{2b}R^{3b}) і C=NR^{6a};

алкенілтіо, $C_1\text{-}C_6\text{-алкоксі}\text{-}C_1\text{-}C_6\text{-алкілкарбонілу}$, $C_1\text{-}C_6\text{-галогеналкоксикарбоніламіно}$, $\text{ди}(C_1\text{-}C_6\text{-галогеналкіл})\text{аміно}\text{-}C_1\text{-}C_6\text{-алкілу}$, $C_3\text{-}C_8\text{-галогенциклоалкенілоксі}\text{-}C_1\text{-}C_6\text{-алкілу}$, $C_1\text{-}C_6\text{-алкоксі}(C_1\text{-}C_6\text{-алкіл})\text{амінокарбонілу}$, $C_1\text{-}C_6\text{-галогеналкілсульфоніламінокарбонілу}$, $C_1\text{-}C_6\text{-алкоксикарбонілалкокси}$, $C_1\text{-}C_6\text{-алкіламінотіокарбоніламіно}$, $C_3\text{-}C_8\text{-циклоалкіл}\text{-}C_1\text{-}C_6\text{-алкіламіно}\text{-}C_1\text{-}C_6\text{-алкілу}$, $C_1\text{-}C_6\text{-алкілтіокарбонілу}$, $C_3\text{-}C_8\text{-циклоалкенілоксі}\text{-}C_1\text{-}C_6\text{-алкілу}$, $C_1\text{-}C_6\text{-алкоксі}\text{-}C_1\text{-}C_6\text{-алкоксикарбонілу}$, $\text{ди}\text{-}C_1\text{-}C_6\text{-алкіламінотіокарбоніламіно}$, $C_1\text{-}C_6\text{-галогеналкоксі}\text{-}C_1\text{-}C_6\text{-галогеналкоксі}$, $C_1\text{-}C_6\text{-алкоксі}\text{-}C_1\text{-}C_6\text{-галогеналкоксі}$, $C_3\text{-}C_8\text{-галогенциклоалкоксі}\text{-}C_1\text{-}C_6\text{-алкіл}$, $\text{ди}\text{-}C_1\text{-}C_6\text{-алкіламінокарбоніламіно}$, $C_1\text{-}C_6\text{-алкоксі}\text{-}C_2\text{-}C_6\text{-алкенілу}$, $C_1\text{-}C_6\text{-алкілтіокарбонілоксі}$, $C_1\text{-}C_6\text{-галогеналкоксі}\text{-}C_1\text{-}C_6\text{-алкоксі}$, $C_1\text{-}C_6\text{-галогеналкілсульфоніламіно}$, $C_3\text{-}C_8\text{-циклоалкіл}\text{-}C_1\text{-}C_6\text{-алкіламіно}\text{-}C_1\text{-}C_6\text{-алкілу}$, $C_1\text{-}C_6\text{-алкоксі}\text{-}C_1\text{-}C_6\text{-алкоксикарбонілу}$, $C_1\text{-}C_6\text{-алкіламінотіокарбоніламіно}$, $C_3\text{-}C_8\text{-циклоалкенілоксі}\text{-}C_1\text{-}C_6\text{-алкілу}$, $C_1\text{-}C_6\text{-алкіламінокарбоніламіно}$, $C_1\text{-}C_6\text{-галогеналкоксі}\text{-}C_1\text{-}C_6\text{-галогеналкіламіно}$, $C_1\text{-}C_6\text{-алкіламінокарбоніл}\text{-}C_1\text{-}C_6\text{-алкіламіно}$, $\text{три}\text{-}C_1\text{-}C_6\text{-алкілсиліл}\text{-}C_2\text{-}C_6\text{-алкінілоксі}$, $\text{три}\text{-}C_1\text{-}C_6\text{-алкілсиліл}\text{-}C_2\text{-}C_6\text{-алкінілу}$, $\text{ціано}(C_1\text{-}C_6\text{-алкоксі})\text{-}C_1\text{-}C_6\text{-алкіл}$, $\text{ди}\text{-}C_1\text{-}C_6\text{-алкілтіо}\text{-}C_1\text{-}C_6\text{-алкіл}$, $C_1\text{-}C_6\text{-алкоксисульфоніламіно}$, $C_3\text{-}C_8\text{-галогенциклоалкоксикарбонілу}$, $C_1\text{-}C_6\text{-алкіл}\text{-}C_3\text{-}C_8\text{-циклоалкілкарбонілу}$, $C_3\text{-}C_8\text{-галогенциклоалкілкарбонілу}$, $C_2\text{-}C_6\text{-алкенілоксикарбонілу}$, $C_2\text{-}C_6\text{-алкінілоксикарбонілу}$, $C_2\text{-}C_6\text{-галогеналкінілкарбонілоксі}$, $C_2\text{-}C_6\text{-галогеналкінілкарбонілоксі}$, $C_2\text{-}C_6\text{-цианокарбонілоксі}$, $C_1\text{-}C_6\text{-цианокарбонілоксі}$, $C_3\text{-}C_8\text{-циклоалкіл}\text{-}C_1\text{-}C_6\text{-алкілсульфоніламіно}$, $C_3\text{-}C_8\text{-циклоалкіл}\text{-}C_1\text{-}C_6\text{-алкілсульфоніламіно}$, $C_1\text{-}C_6\text{-цианоалкілсульфоніламіно}$, $C_2\text{-}C_6\text{-галогеналкенілсульфоніламіно}$, $C_2\text{-}C_6\text{-алкінілциклоалкіламіно}$, $C_2\text{-}C_6\text{-цианоалкеніламіно}$, $C_2\text{-}C_6\text{-цианоалкініламіно}$, $C_1\text{-}C_6\text{-алкоксикарбонілоксі}$, $C_2\text{-}C_6\text{-алкенілоксикарбонілоксі}$, $C_2\text{-}C_6\text{-алкінілоксикарбонілоксі}$, $C_1\text{-}C_6\text{-алкоксі}\text{-}C_1\text{-}C_6\text{-алкілкарбонілоксі}$, $Сульфілімінів$, $Сульфоксимінів$, SF_5 , $-OR^{12}$, $-NR^{13}R^{14}$, нітро , $-SH$, $-SCN$, $-C(=O)R^{15}$, $-C(=O)OR^{12}$, $-C(=O)NR^{13}R^{14}$, $-NR^{13}C(=O)R^{15}$, $-O(C=O)R^{15}$, $-O(C=O)NR^{13}R^{14}$, $-C(NOR^{13})R^{15}$, $-NR^{13}SO_2R^{16}$, $-CSR^{16}$, $-C=S)OR^{12}$, $-C(S)NR^{13}R^{14}$, $-NR^{13}C(=S)R^{15}$, $-O(C=S)R^{15}$, $-O(C=S)NR^{13}R^{14}$, $-O(C=S)SR^{16}$, $-N=C(R^{15})_2$, $-NHCN$, $-SO_2NHCN$, $-C(=O)NHCN$, $-C(=S)NHCN$, $-C(=S(O))NHCN$ і $-SO_2NR^{12}R^{13}$; або R^{8a} і R^{8b} ; R^{8a} і R^{10} ; R^{8b} і R^{10} ; R^{8c} і R^{10} ; R^{4b} і R^{10} ; R^{2f} і R^{10} ; і або R^{3f} і R^{10} разом із атомами, до яких вони приєднані, можуть утворювати 3-8-членні гетероциклічні кільця або кільцеву систему, де гетероатом вибраний із групи, що складається з N, O і S(O)₀₋₂, і член кільця, що являє собою C, гетероциклічного кільця або кільцевої системи може бути заміщений C(O), C(S), C(=CR^{2c}R^{3c}) або C(=NR^{6b}), і вказані гетероциклічні кільця або кільцева система можуть бути необов'язково заміщені галогеном, ціано, $C_1\text{-}C_4\text{-алкілом}$, $C_2\text{-}C_4\text{-алкенілом}$, $C_2\text{-}C_4\text{-алкінілом}$, $C_1\text{-}C_4\text{-галогеналкілом}$, $C_2\text{-}C_4\text{-галогеналкенілом}$, $C_2\text{-}C_4\text{-галогеналкінілом}$, $C_3\text{-}C_6\text{-циклоалкілом}$, $C_3\text{-}C_6\text{-галогенциклоалкілом}$, $C_1\text{-}C_4\text{-алкоксі}$ або $C_1\text{-}C_4\text{-галогеналкоксі}$; R^{12} вибраний із групи, що складається із $C_1\text{-}C_6\text{-алкілу}$, $C_1\text{-}C_6\text{-галогеналкілу}$, $C_3\text{-}C_8\text{-циклоалкілу}$ і $C_3\text{-}C_8\text{-галогенциклоалкілу}$, R^{13} і R^{14} незалежно вибраний із групи, що складається з водню, гідроксилу, ціано, $C_1\text{-}C_6\text{-алкілу}$, $C_1\text{-}C_6\text{-галогеналкілу}$, $C_1\text{-}C_6\text{-алкоксі}$, $C_3\text{-}C_8\text{-циклоалкілу}$, $C_3\text{-}C_8\text{-галогенциклоалкілу}$, фенілу і 5- або 6-членного гетероциклічного кільця; де вказаний феніл, 5- або 6-членне гетероциклічне кільце можуть бути необов'язково заміщені галогеном, $C_1\text{-}C_6\text{-алкілом}$, $C_1\text{-}C_6\text{-галогеналкілом}$, $C_1\text{-}C_6\text{-алкоксі}$, $C_3\text{-}C_8\text{-циклоалкілом}$, $C_3\text{-}C_8\text{-галогенциклоалкілом}$ і $C_1\text{-}C_6\text{-алкілтіо}$, або R^{13} і R^{14} разом із атомом N, до якого вони приєднані, можуть утворювати 3-7-членні гетероциклічні кільце; де гетероатом гетероциклічного кільця вибраний із N, O або S(O)₀₋₂, і член кільця, що являє собою C, гетероциклічного кільця може бути заміщений C(O) і C(S), де вказане гетероциклічне кільце може бути необов'язково заміщене галогеном, $C_1\text{-}C_6\text{-алкілом}$, $C_1\text{-}C_6\text{-галогеналкілом}$, $C_1\text{-}C_6\text{-алкоксі}$, $C_3\text{-}C_8\text{-циклоалкілом}$, $C_3\text{-}C_8\text{-галогенциклоалкілом}$ і $C_1\text{-}C_6\text{-алкілтіо}$, R^{15} являє собою водень, гідрокси, галоген, аміно, $C_1\text{-}C_6\text{-алкіламіно}$, $\text{ди}\text{-}C_1\text{-}C_6\text{-алкіламіно}$, $C_1\text{-}C_6\text{-алкіл}$, $C_1\text{-}C_6\text{-галогеналкіл}$, $C_1\text{-}C_6\text{-алкоксі}$, $C_1\text{-}C_6\text{-галогеналкоксі}$, $C_3\text{-}C_8\text{-циклоалкіл}$, $C_3\text{-}C_8\text{-циклоалкіл}$, феніл, 5- або 6-членне гетероциклічне кільце можуть бути необов'язково заміщені галогеном, $C_1\text{-}C_6\text{-алкілом}$, $C_1\text{-}C_6\text{-галогеналкілом}$, $C_1\text{-}C_6\text{-алкоксі}$, $C_3\text{-}C_8\text{-циклоалкілом}$, $C_3\text{-}C_8\text{-галогенциклоалкілом}$ і $C_1\text{-}C_6\text{-алкілтіо}$, R^{16} являє собою водень, галоген, ціано, $C_1\text{-}C_6\text{-алкіл}$, $C_1\text{-}C_6\text{-галогеналкіл}$, $C_1\text{-}C_6\text{-алкоксі}$, $C_1\text{-}C_6\text{-галогеналкоксі}$, $C_3\text{-}C_8\text{-циклоалкіл}$ і $C_3\text{-}C_8\text{-циклоалкіл}$; та/або її N-оксиди, комплекси з металами, ізомери, поліморфи або прийнятні з погляду сільського господарства солі.

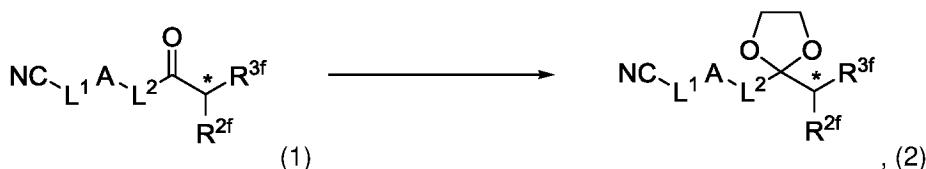
2. Сполука формули (I) за п. 1, де R^1 являє собою $C_1\text{-}галогеналкіл$, де галоген являє собою хлор або фтор;

- L¹ являє собою прямий зв'язок;
- L² являє собою прямий зв'язок;
- А являє собою 3-6-членне ароматичне карбоциклічне кільце або ароматичне гетероциклічне кільце, де гетероатом ароматичного гетероциклічного кільця вибраний із N, O і S; і А необов'язково заміщений однією або більше ідентичними або різними групами R^A;
- R^A вибраний із групи, що складається з водню, галогену, ціано, нітро, аміно, гідрокси, SF₅, C₁-C₆-алкілу, C₂-C₆-алкенілу, C₂-C₆-алкінілу, C₃-C₈-циклоалкілу, C₃-C₈-циклоалкілалкілу, C₁-C₆-галогеналкілу, C₁-C₆-алкоксі-C₁-C₄-алкілу, C₁-C₆-гідроксіалкілу, C₂-C₆-галогеналкенілу, C₂-C₆-галогеналкінілу, C₃-C₈-галогенциклоалкілу, C₁-C₆-алкокси, C₁-C₆-галогеналкокси, C₁-C₆-галогеналкоксикарбонілу і C₁-C₆-алкілтіо;
- W¹ являє собою О;
- Q являє собою прямий зв'язок, О, S(=O)₀₋₂, S(=O)₀₋₁(=NR^{4b}), NR^{4b}, CR^{2e}R^{3e}, -N=S(=NR^{8a})(R^{8b})-; -N=S(=O)₀₋₁(R^{8c})-;
- R¹⁰ вибраний із групи, що складається з галогену, гідрокси, ціано, C₁-C₆-алкілу, C₂-C₆-алкенілу, C₂-C₆-алкінілу, C₃-C₈-циклоалкілу, C₃-C₈-галогенциклоалкілу, C₁-C₆-алкіл-C₃-C₈-циклоалкілу, C₃-C₈-циклоалкіл-C₁-C₆-алкілу, C₁-C₆-алкіл-C₃-C₈-циклоалкіл-C₁-C₆-алкілу, C₃-C₈-циклоалкенілу, C₁-C₆-алкокси, C₁-C₆-алкоксі-C₁-C₆-алкілу, C₃-C₈-циклоалкоксі-C₁-C₆-алкілу, C₁-C₆-алкіл-C₁-C₆-тіоалкілу, C₁-C₆-алкілсульфініл-C₁-C₆-алкілу, C₁-C₆-алкілсульфоніл-C₁-C₆-алкілу, C₁-C₆-алкіламіно, ді-C₁-C₆-алкіламіно, C₁-C₆-алкіламіно-C₁-C₆-алкілу, C₃-C₈-циклоалкіламіно, C₃-C₈-циклоалкіламіно-C₁-C₆-алкілу, C₁-C₆-алкілкарбонілу, C₁-C₆-гідроксіалкілу, C₂-C₆-гідроксіалкенілу, C₂-C₆-гідроксіалкінілу, C₂-C₆-алкенілокси, C₂-C₆-галогеналкенілокси, C₂-C₆-алкінілокси, C₂-C₆-галогеналкінілокси, C₁-C₆-алкілкарбонілалкокси, C₁-C₆-алкілтіо, C₁-C₆-галогеналкілтіо, C₃-C₈-циклоалкілтіо, C₁-C₆-алкілсульфініл, C₁-C₆-галогеналкілсульфініл, C₁-C₆-алкілсульфоніл, C₁-C₆-галогеналкілсульфоніл, C₃-C₈-циклоалкілсульфоніл, три-C₁-C₆-алкіл силілу, C₁-C₆-алкілсульфоніламіно, C₁-C₆-галогеналкілсульфоніламіно, C₁-C₆-алкілкарбонілтіо, C₁-C₆-алкілсульфонілопкси, C₆-C₁₀-арилсульфонілопкси, C₆-C₁₀-арилсульфоніл, C₆-C₁₀-арилсульфініл, C₆-C₁₀-арилтіо, C₁-C₆-цианоалкілу, C₂-C₆-алкілтіо, C₂-C₆-алкеніламіно, C₂-C₆-алкініламіно, C₁-C₆-галогеналкіламіно, C₁-C₆-алкоксіаміно, C₁-C₆-галогеналкоксіаміно, C₁-C₆-алкоксикарбоніламіно, C₂-C₆-алкенілтіо, SF₅, -OR¹², -NR¹³R¹⁴, нітро, -SH, -SCN, -C(=O)R¹⁵, -C(=O)OR¹², -C(=O)NR¹³R¹⁴, -NR¹³C(=O)R¹⁵ і Z¹Q¹.
3. Сполука формули (I) за п. 1, де:
- R¹ являє собою C₁-галогеналкіл, де галоген являє собою хлор або фтор;
- L¹ являє собою прямий зв'язок;
- L² являє собою прямий зв'язок;
- А являє собою феніл або піridил; де вказане фенільне або піридинильне кільце може бути необов'язково заміщене однією або більше ідентичними або різними групами R^A;
- R^A вибраний із групи, що складається з водню, галогену, ціано, нітро, аміно, гідрокси, SF₅, C₁-C₆-алкілу, C₃-C₈-циклоалкілу, C₁-C₆-галогеналкілу, C₁-C₆-гідроксіалкілу, C₁-C₆-алкокси і C₁-C₆-галогеналкокси;
- W¹ являє собою О;
- Q являє собою прямий зв'язок, О, S(=O)₀₋₂, S(=O)₀₋₁(=NR^{4b}), NR^{4b} і CR^{2e}R^{3e};
- R¹⁰ вибраний із групи, що складається з галогену, гідрокси, ціано, C₁-C₆-алкілу, C₂-C₆-алкенілу, C₂-C₆-алкінілу, C₃-C₈-циклоалкілу, C₃-C₈-галогенциклоалкілу, C₁-C₆-алкіл-C₃-C₈-циклоалкілу, C₃-C₈-циклоалкенілу, C₁-C₆-алкокси, C₁-C₆-алкоксі-C₁-C₆-алкілу, C₃-C₈-циклоалкоксі-C₁-C₆-алкілу, C₁-C₆-алкіл-C₁-C₆-тіоалкілу, C₁-C₆-алкілсульфініл-C₁-C₆-алкілу, C₁-C₆-алкілсульфоніл-C₁-C₆-алкілу, C₁-C₆-алкіламіно, ді-C₁-C₆-алкіламіно, C₁-C₆-алкіламіно-C₁-C₆-алкілу, C₃-C₈-циклоалкіламіно, C₃-C₈-циклоалкіламіно-C₁-C₆-алкілу, C₁-C₆-алкілсульфонілопкси, C₆-C₁₀-арилсульфонілопksi, C₂-C₆-галогеналкенілокси, C₂-C₆-алкінілокси, C₂-C₆-галогеналкінілокси, C₁-C₆-алкілкарбонілалкокси, C₁-C₆-алкілтіо, C₁-C₆-галогеналкілтіо, C₃-C₈-циклоалкілтіо, C₁-C₆-алкілсульфініл, C₁-C₆-галогеналкілсульфініл, C₁-C₆-алкілсульфоніл, C₁-C₆-галогеналкілсульфоніл, три-C₁-C₆-алкіл силілу, C₁-C₆-алкілсульфоніламіно, C₁-C₆-галогеналкілсульфоніламіно, C₁-C₆-алкілкарбонілтіо, C₁-C₆-алкілсульфонілопкси, C₆-C₁₀-арилсульфонілопksi, C₆-C₁₀-арилсульфоніл, C₆-C₁₀-арилсульфініл.

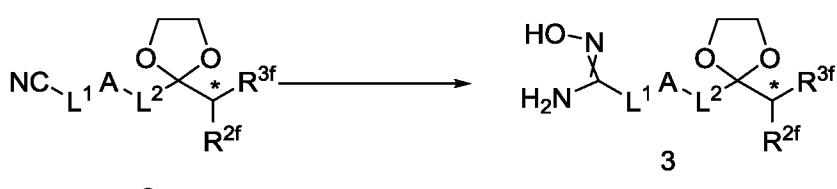
C₆-C₁₀-арилтіо, C₁-C₆-цианоалкілу, C₂-C₆-алкінілтіо, C₂-C₆-алкеніламіно, C₂-C₆-алкініламіно, C₁-C₆-галогеналкіламіно, C₁-C₆-алкоксіаміно, C₁-C₆-галогеналкоксіаміно, C₁-C₆-алкоқсикарбоніламіно, C₂-C₆-алкенілтіо, SF₅, -OR¹², -NR¹³R¹⁴, нітро, -SH, -SCN, -C(=O)R¹⁵, -C(=O)OR¹², -C(=O)NR¹³R¹⁴, -NR¹³C(=O)R¹⁵ і Z¹Q¹.

- | | |
|----|--|
| 5 | 4. Сполука формули (I) за п. 1, де вказана сполука формули (I) вибрана із 2-фенокси-1-(4-(5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл)феніл)етан-1-ону; |
| 10 | (трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл)феніл)етан-1-ону; |
| 15 | (трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл)феніл)етан-1-ону; |
| 20 | (трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл)феніл)етан-1-ону; |
| 25 | (трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл)феніл)етан-1-ону; |
| 30 | (оксадіазол-3-іл)феніл)етан-1-ону; |
| 35 | (оксадіазол-3-іл)феніл)етан-1-ону; |
| 40 | (оксадіазол-3-іл)феніл)етан-1-ону; |
| 45 | (оксадіазол-3-іл)феніл)етан-1-ону; |
| 50 | (оксадіазол-3-іл)феніл)етан-1-ону; |
| 55 | (оксадіазол-3-іл)феніл)етан-1-ону; |
| 60 | (оксадіазол-3-іл)феніл)етан-1-ону; |

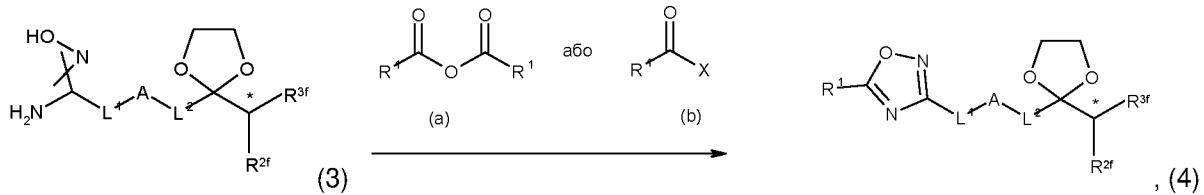
- 3-іл)феніл)-2-(2-метоксіетоксі)етан-1-ону; 2-(цикlopропілметокси)-1-(2-фтор-4-(5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл)феніл)етан-1-ону; 1-(2-оксо-2-(4-(5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл)феніл)етил)піперазин-2-ону і 4-метил-1-(2-оксо-2-(4-(5-(трифторметил)-1,2,4-оксадіазол-3-іл)феніл)етил)піперазин-2-ону.
5. Сполука за п. 1, де вказана сполука є застосовуваною як фунгіцид.
6. Комбінація, що містить сполуку формули (I) за п. 1 і щонайменше одну додаткову пестицидно активну речовину, вибрану із групи, що складається з фунгіцидів, інсектицидів, нематоцидів, акарицидів, біопестицидів, гербіцидів, антидотів, регуляторів росту рослин, антибіотиків, добрив і поживних речовин.
10. Композиція для контролю або попередження захворювань рослин, яка містить сполуку формули (I) за п. 1 і щонайменше одну агрохімічно прийнятну допоміжну речовину.
15. Композиція за п. 7, де вказана композиція може додатково містити щонайменше один додатковий активний інгредієнт.
19. Композиція за п. 7, де вказана композиція наноситься на насінню, і кількість сполуки формули (I) в указаній композиції знаходиться в діапазоні від 0,1 г а.і. до 10 кг а.і. на 100 кг насіння.
20. Композиція за п. 7, де захворювання рослин зумовлені патогенами іржі, вибраними із групи, що включає Hemileia vastatrix (іржа кавового дерева), Uromyces appendiculatus/fabaе/phaseoli (іржа бобових), Puccinia spp. (види іржі) на різних рослинах, вибрані із P. triticina (бура або листяна іржа), P. striiformis (лінійна або жовта іржа), P. Hordei (карликова іржа), P. graminis (стеблова або чорна іржа) або P. recondita (бура або листяна іржа) на злакових культурах, вибраних із пшениці, ячменю або жита, і Phakopsora spp. на різних рослинах, зокрема Phakopsora pachyrhizi та P. meibomiae (іржа сої) на видах сої.
25. Способ контролю фітопатогенних грибів або попередження ураження ними, де способ включає обробку грибів або матеріалів, рослин, частин рослин, місця їх зростання, ґрунту або насіння, що мають бути захищені щодо ураження грибами, ефективною кількістю щонайменше однієї сполуки формули (I) за п. 1 або комбінації за п. 6, або композиції за п. 7.
30. Способ контролю або попередження зараження рослин фітопатогенними мікроорганізмами в сільськогосподарських культурах та/або садових культурах, де ефективну кількість щонайменше однієї сполуки формули (I) за п. 1 або комбінації за п. 6, або композиції за п. 7 наносять на насіння рослин.
35. 13. Способ одержання сполуки формули (I) за п. 1, де вказаний спосіб передбачає стадії:
а) введення захисної групи на карбонільну групу сполуки формули (1) із застосуванням придатного захисного засобу з одержанням сполуки формули (2):



де L^1 являє собою прямий зв'язок; А являє собою арил, і L^2 являє собою прямий зв'язок;
б) здійснення реакції сполуки формули (2) з гідроксиламіном із одержанням сполуки формули (3):



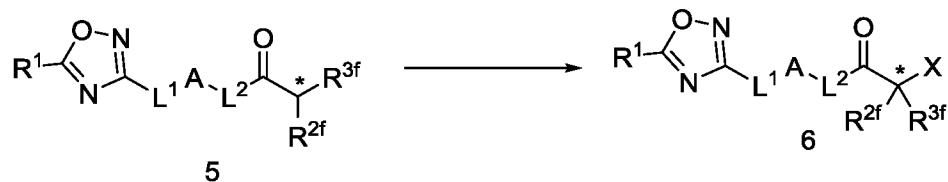
45. де L^1 являє собою прямий зв'язок; А являє собою арил, і L^2 являє собою прямий зв'язок;
с) здійснення реакції сполуки формули (3) із придатним ангідридом карбонової кислоти формули (а) або хлоридом карбонової кислоти формули (б) із одержанням сполуки формули (4):



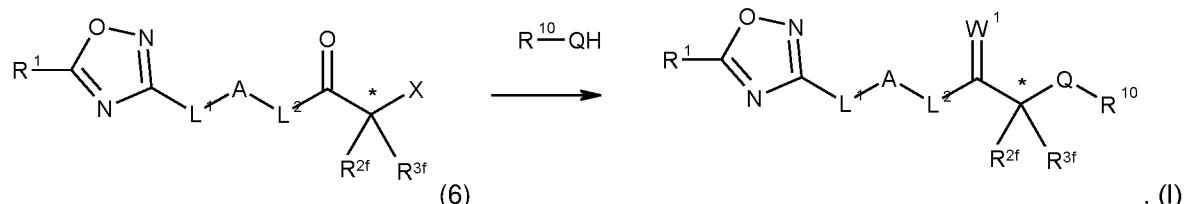
де L^1 являє собою прямий зв'язок; A являє собою арил, і L^2 являє собою прямий зв'язок;
 д) видалення захисної групи зі сполуки формули (4) у присутності придатного засобу для
 видалення захисної групи з одержанням сполуки формули (5):



де L^1 являє собою прямий зв'язок; A являє собою арил, і L^2 являє собою прямий зв'язок;
 е) галогенування сполуки формули (5) у присутності придатного засобу для галогенування з
 одержанням сполуки формули (6):

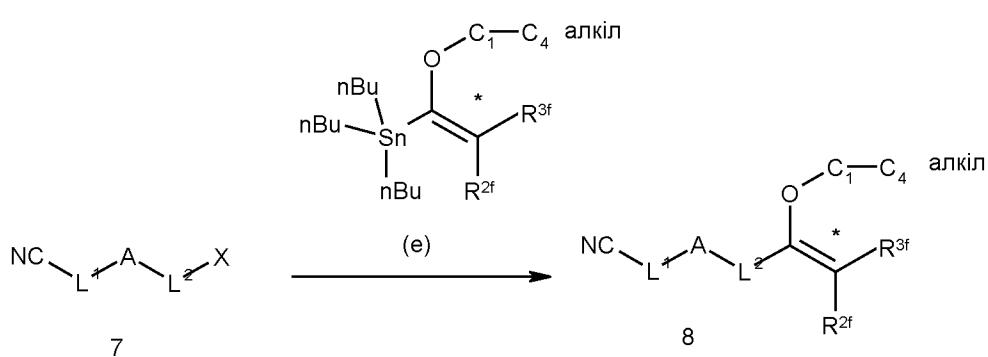


15 де L^1 являє собою прямий зв'язок; A являє собою арил, і L^2 являє собою прямий зв'язок;
 ф) здійснення реакції сполуки формули (6) зі сполукою формули (с) з одержанням сполуки
 формули (I):



20 де L^1 являє собою прямий зв'язок; A являє собою арил; L^2 являє собою прямий зв'язок; X являє
 собою Br, Cl або I, і W^1 являє собою O.

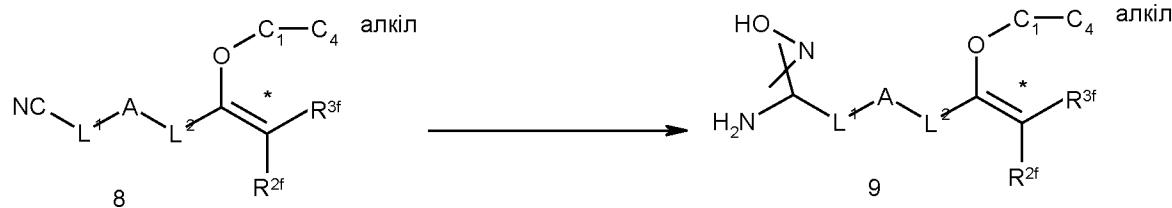
14. Спосіб синтезу сполуки формули (I) за п. 1, де вказаний спосіб передбачає стадії:
 а) здійснення реакції сполуки формули (7) зі сполукою формули (е) з одержанням сполуки
 формули (8):



де L^1 являє собою прямий зв'язок; А являє собою арил або піridил; L^2 являє собою прямий зв'язок, і Х являє собою Br, Cl або I;

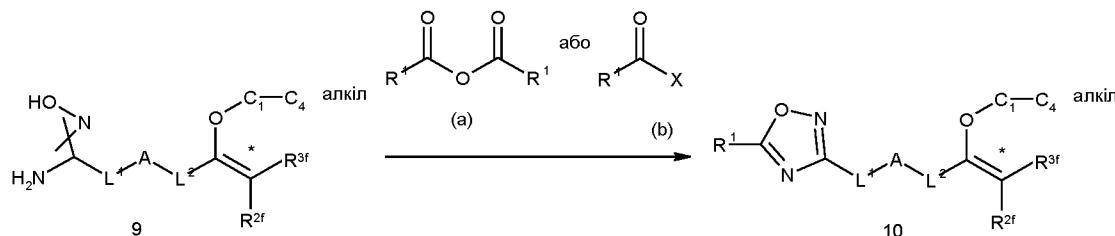
алкіл

- 5 б) здійснення реакції сполуки формули (8) з гідроксиламіном із одержанням сполуки формули (9):



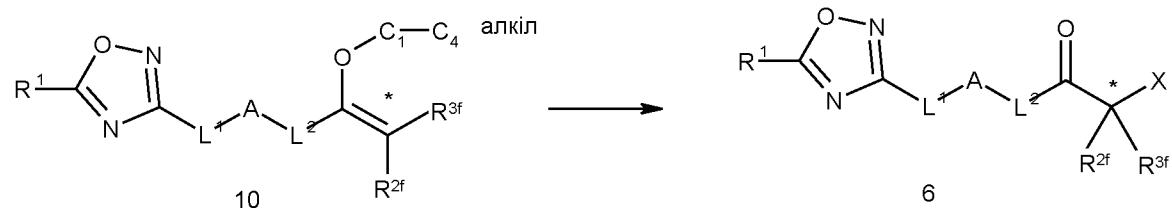
10 де L^1 являє собою прямий зв'язок; А являє собою арил або піridил, і L^2 являє собою прямий зв'язок;

- с) здійснення реакції сполуки формули (9) із придатним ангідридом карбонової кислоти формули (a) або хлоридом карбонової кислоти формули (b) із одержанням сполуки формули (10):



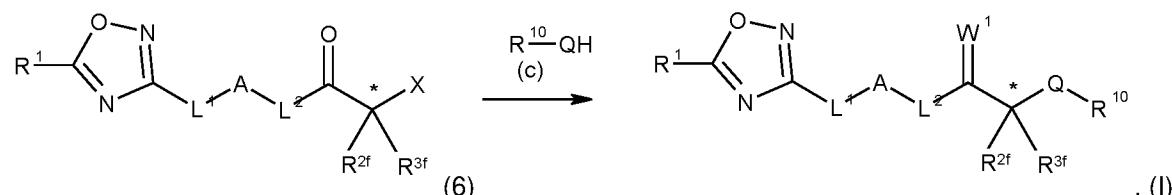
15 де L^1 являє собою прямий зв'язок; А являє собою арил або піridил, і L^2 являє собою прямий зв'язок;

- 20 д) галогенування сполуки формули (10) у присутності придатного засобу для галогенування з одержанням сполуки формули (6):



25 де L^1 являє собою прямий зв'язок; А являє собою арил або піridил; L^2 являє собою прямий зв'язок, і Х являє собою Br, Cl або I;

- е) здійснення реакції сполуки формули (6) зі сполукою формули (c) з одержанням сполуки формули (I):

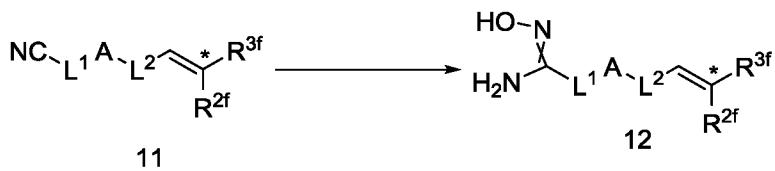


- 30 де L^1 являє собою прямий зв'язок; А являє собою арил або піridил; L^2 являє собою прямий зв'язок; Х являє собою Br, Cl або I, і W^1 являє собою O.

15. Спосіб синтезу сполуки формули (I) за п. 1, де вказаний спосіб передбачає стадії:

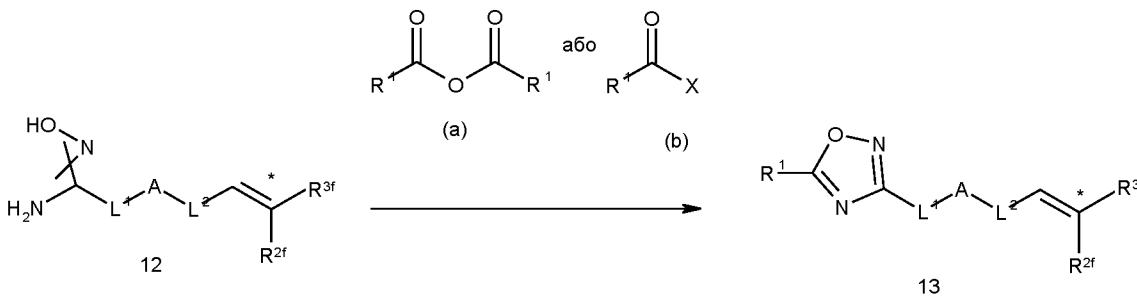
- а) здійснення реакції сполуки формули (11) з гідроксиламіном із одержанням сполуки формули (12):

35



де L^1 являє собою прямий зв'язок; А являє собою арил або піridил, і L^2 являє собою прямий зв'язок;

- 5 b) здійснення реакції сполуки формули (12) із придатним ангідридом карбонової кислоти формули (а) або хлоридом карбонової кислоти формули (б) із одержанням сполуки формули (13):



10

де L^1 являє собою прямий зв'язок; А являє собою арил або піridил, і L^2 являє собою прямий зв'язок;

c) здійснення реакції сполуки формули (13) із придатним окиснювальним засобом із одержанням сполуки формули (14):

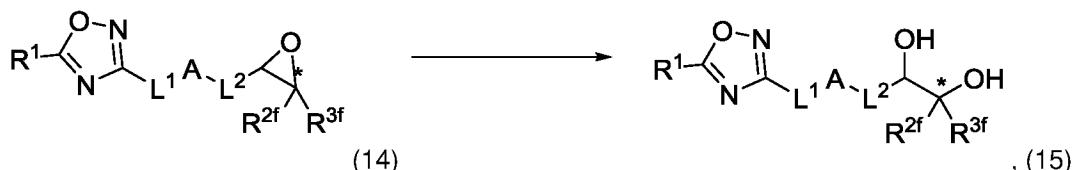
15



де L^1 являє собою прямий зв'язок; А являє собою арил або піridил, і L^2 являє собою прямий зв'язок;

20

d) здійснення гідролізу сполуки формули (14) у присутності придатного гідролізувального засобу з одержанням сполуки формули (15):

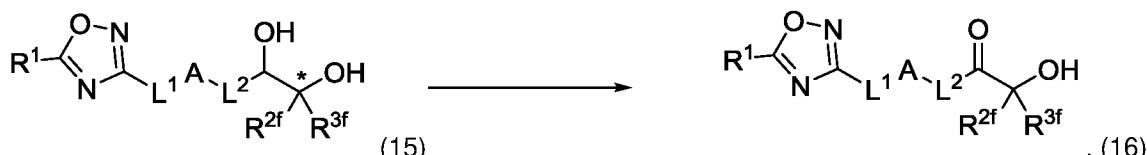


25

де L^1 являє собою прямий зв'язок; А являє собою арил або піridил, і L^2 являє собою прямий зв'язок;

e) окислення сполуки формули (15) у присутності придатного окиснювального засобу з одержанням сполуки формули (16):

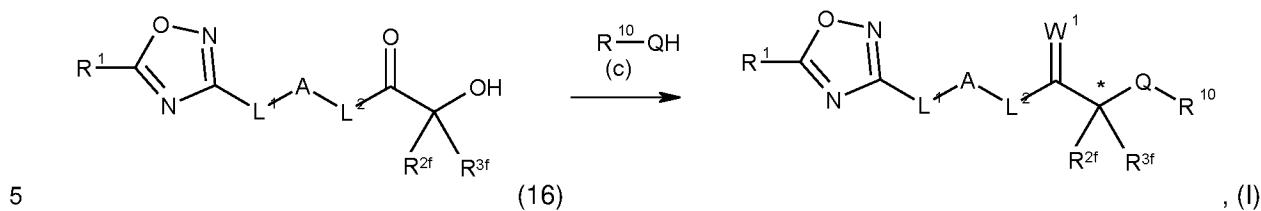
30



де L^1 являє собою прямий зв'язок; А являє собою арил або піridил, і L^2 являє собою прямий

зв'язок;

f) здійснення реакції сполуки формули (16) зі сполукою формули (c) з одержанням сполуки формули (l):

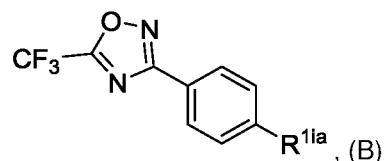


де L^1 являє собою прямий зв'язок;

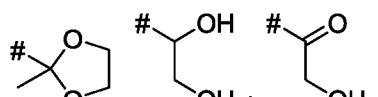
A являє собою арил або піridил;

L^2 являє собою прямий зв'язок, і W^1 являє собою O .

10 16. Сполука формули (B):

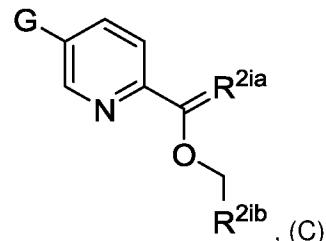


де



15 R^{1ia} вибраний із

17. Сполука формули (C):



20 де G вибраний із групи, що складається з

R^{2ia} вибраний із групи, що складається з CH_2 і O ;

R^{2ib} вибраний із групи, що складається з метилу і галогену.

